

和黃醫藥啟動新型受體 (c-Met) 抑製劑沃利替尼 (Volitinib) I 期臨床試驗

2012 年 2 月 22 日：和黃醫藥今日宣佈在澳大利亞啟動沃利替尼 (HMPL-504) I 期臨床試驗。沃利替尼是一種小分子新型靶向治療藥物，是 c-Met 受體酪氨酸激酶的高選擇性抑製劑，用於癌症治療。沃利替尼是和黃醫藥研發的眾多腫瘤化合物之一，也是和黃醫藥第一個在澳大利亞開展臨床試驗的抗腫瘤藥物。2011 年 12 月 21 日，阿斯利康與和黃醫藥簽署了一項合作協議，共同致力於沃利替尼 (Volitinib) 在全球範圍內的開發、註冊和銷售。

沃利替尼的 I 期臨床已經通過澳大利亞 Bellberry 人體研究倫理委員會的批准。首先將在 Sir Charles Gairdner 醫院 (簡稱 "SCGH") 進行，由 Michael Millward 教授監督指導，Michael Millward 教授是 SCGH 腫瘤內科主任以及西澳大學臨床腫瘤研究教授。此項 I 期臨床研究主要評估沃利替尼治療晚期癌症患者的安全性和耐受性，確定其最大耐受劑量，同時評估沃利替尼治療多種腫瘤，包括肺癌和胃癌的初步療效。c-Met 的基因擴增和蛋白表達水平將會在後階段的臨床試驗中作為篩選患者的指標。

Michael Millward 教授表示：“沃利替尼是一種高選擇性地抑制 c-Met 的口服抗癌藥物。我們非常榮幸其首次人體 I 期臨床試驗能夠在澳大利亞開展，同時也非常高興能夠在這個很有潛力的個體化新藥的全球開發中起到關鍵性的作用。

沃利替尼是經過對 274 個激酶的篩選而證實的一種高選擇性 ATP 競爭性 c-Met 抑製劑。沃利替尼的臨床前研究表明在一系列的人體腫瘤異體移植模型中，特別對於 c-Met 基因擴增或 c-Met 過度表達的情況有腫瘤抑製作用。

關於 c-Met 信號通道

c-Met (也稱為 HGFR) 信號通道在哺乳類動物正常生長和發育過程中具有特殊作用。然而已有研究表明，這種通道在不同的癌症中表現異常。沃利替尼是有效的高選擇性 c-Met 抑製劑，在一系列臨床前疾病模型中已證明其可有效地抑制腫瘤生長，尤其是對於 c-Met 基因擴增或 c-Met 蛋白過度表達等 c-Met 信號傳導異常的腫瘤具有明顯的抑製作用。這些生物標誌物可能在後期階段臨床試驗中用於篩選有效臨床試驗受試患者。

關於和黃醫藥

和黃醫藥是中國領先的創新藥物研發企業，主要研發治療癌症和自身免疫性疾病的創新藥物。和黃醫藥目前擁有約 200 位科學家和員工，其在研新型口服藥物在北美、歐洲、澳大利亞和大中華區均有臨床試驗。