

和黄医药启动表皮生长因子受体 (EGFR) 抑制剂西利替尼 (Theliatinib) I 期临床 床试验

2012 年 11 月 1 日, 星期四: 和黄医药今日宣布启动西利替尼 (HMPL-309) I 期临床试验。西利替尼是和黄医药研发项目中第四个进入国内临床试验的靶向抗肿瘤药物。西利替尼是表皮生长因子受体 (EGFR) 口服小分子抑制剂, 作用于表达野生型 EGFR 的肿瘤或由于使用第一代 EGFR 治疗药物而产生耐药的肿瘤。2012 年 10 月 30 日第一位患者接受了该药的临床 I 期试验治疗。

I 期临床试验主要评估西利替尼在晚期实体瘤病人上的安全性和耐受性, 以确定最大耐受剂量, 同时评估其抑制非小细胞肺癌 (NSCLC) 的初步疗效, 确定西利替尼单次给药和多次给药下的药物代谢情况, 研究西利替尼的抗肿瘤活性与生物标记物之间的关系。

临床前研究表明, 西利替尼的各个耐受剂量在野生型 EGFR 动物模型上表现出良好的抗肿瘤活性, 同时西利替尼具有良好的药代动力学特性以及安全性, 组织分布情况良好。与第一代 EGFR 抑制剂相比, 西利替尼对野生型 EGFR 和 EGFR 耐药肿瘤有更好的抗肿瘤疗效。和黄医药总裁贺隽先生说, “如果临床研究也显示出这些特性, 我们就完全有理由相信西利替尼可以成为这一领域中重要的治疗药物。”

关于表皮生长因子受体 (EGFR) 和非小细胞肺癌 (NSCLC)

EGFR 在与表皮生长因子(EGF)结合后, 激活一系列下游信号活动, 包括调解肿瘤细胞增殖, 抑制细胞死亡等。EGFR 抑制剂可阻断这些信号通路, 从而抑制肿瘤细胞生长和存活。

2008 年全球肺癌患者约超过 160 万例, 中国则超过 52 万例。在中国及全球范围内, 肺癌已成为发病最高的癌症之一。

第一代小分子 EGFR 抑制剂, 如吉非替尼 (易瑞沙™) 和埃罗替尼 (特罗凯™), 主要用于治疗携带 EGFR 敏感突变基因的非小细胞肺癌。2011 年, 特罗凯™的全球销售额达到了约 14 亿美元。但是非小细胞肺癌病患中仅有 10-30% (根据地域区别数据有所差异) 可能携带 EGFR 敏感突变基因。而大部分患者均为携带野生型 EGFR, 目前可用的 EGFR 抑制剂对这些病患均无明显的治疗效果。临床前研究表明, 西利替尼对于治疗野生型 EGFR 的非小细胞肺癌病患和对吉非替尼和埃罗替尼有抗药性的病患有很好的治疗潜力。

关于和黄医药

和黄医药是中国领先的创新药物研发企业, 主要研发治疗癌症和自身免疫性疾病的创新药物。和黄医药目前拥有约 200 名科学家和员工, 其在研的针对癌症和炎症的新型口服药物在北美、欧洲、澳大利亚和大中华区均有临床试验。