

和黃醫藥啟動表皮生長因子受體 (EGFR) 抑製劑西利替尼 (Theliatinib) I 期 臨床試驗

2012 年 11 月 1 日, 星期四: 和黃醫藥今日宣布啟動西利替尼 (HMPL-309) I 期臨床試驗。西利替尼是和黃醫藥研發項目中第四個進入國內臨床試驗的靶向抗腫瘤藥物。西利替尼是表皮生長因子受體 (EGFR) 口服小分子抑製劑, 作用於表達野生型 EGFR 的腫瘤或由於使用第一代 EGFR 治療藥物而產生耐藥的腫瘤。2012 年 10 月 30 日第一位患者接受了該藥的臨床 I 期試驗治療。

I 期臨床試驗主要評估西利替尼在晚期實體瘤病人上的安全性和耐受性, 以確定最大耐受劑量, 同時評估其抑制非小細胞肺癌 (NSCLC) 的初步療效, 確定西利替尼單次給藥和多次給藥下的藥物代謝情況, 研究西利替尼的抗腫瘤活性與生物標記物之間的關係。

臨床前研究表明, 西利替尼的各個耐受劑量在野生型 EGFR 動物模型上表現出良好的抗腫瘤活性, 同時西利替尼具有良好的藥代動力學特性以及安全性, 組織分佈情況良好。與第一代 EGFR 抑製劑相比, 西利替尼對野生型 EGFR 和 EGFR 耐藥腫瘤有更好的抗腫瘤療效。和黃醫藥總裁賀雋先生說, “如果臨床研究也顯示出這些特性, 我們就完全有理由相信西利替尼可以成為這一領域中重要的治療藥物。”

關於表皮生長因子受體 (EGFR) 和非小細胞肺癌 (NSCLC)

EGFR 在與表皮生長因子(EGF) 結合後, 激活一系列下游信號活動, 包括調解腫瘤細胞增殖, 抑制細胞死亡等。EGFR 抑製劑可阻斷這些信號通路, 從而抑制腫瘤細胞生長和存活。

2008 年全球肺癌患者約超過 160 萬例, 中國則超過 52 萬例。在中國及全球範圍內, 肺癌已成為發病最高的癌症之一。

第一代小分子 EGFR 抑製劑, 如吉非替尼 (易瑞沙™) 和埃羅替尼 (特羅凱™), 主要用於治療攜帶 EGFR 敏感突變基因的非小細胞肺癌。2011 年, 特羅凱™ 的全球銷售額達到了約 14 億美元。但是非小細胞肺癌病患中僅有 10-30 % (根據地域區別數據有所差異) 可能攜帶 EGFR 敏感突變基因。而大部分患者均為攜帶野生型 EGFR, 目前可用的 EGFR 抑製劑對這些病患均無明顯的治療效果。臨床前研究表明, 西利替尼對於治療野生型 EGFR 的非小細胞肺癌病患和對吉非替尼和埃羅替尼有抗藥性的病患具有有很好的治療潛力。

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 名科學家和員工, 其在研的針對癌症和炎症的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。