

和黄医药在 2014 年度 AACR 大会上公布沃利替尼和依吡替尼数据

2014 年 4 月 4 日: 和黄中国医药科技有限公司 (简称“和黄医药”) 今日宣布将在 2014 年 4 月 5 日至 9 日于美国圣地亚哥举行的美国癌症研究协会 (AACR) 2014 年会上公布部分在研产品的临床前及临床研究数据。其中由和黄医药自主研发的两个高选择性小分子新型药物, 沃利替尼 (HMPL-504/AZD6094) 和依吡替尼 (HMPL-813) 的相关数据也将同时发布。沃利替尼的数据发布由和黄医药与合作伙伴阿斯利康共同筹备。

美国癌症研究协会 (AACR) 是世界上创立最早、规模最大的专注于癌症研究的科学组织, 致力于癌症的预防及治疗。AACR 拥有来自超过 90 个国家的逾 34,000 名会员, 包括实验研究者, 转化医学及临床研究者, 人口学家, 医疗保健专业人员和癌症倡权者。AACR 每年召开 20 多场会议及研讨会, 其中最大的当属每年吸引超过 18,000 名与会者的 AACR 年会。这些会议集结了国际癌症领域的高、精、尖技术, 对癌症的预防, 生化, 诊断及治疗起到了积极的推动作用。

和黄医药将就沃利替尼的发现, 临床前研究和早期临床评估作口头报告, 也将以海报形式重点展示沃利替尼在非小细胞肺癌患者中的靶向治疗可行性。同时展示的还有和黄医药自主研发的表皮生长因子受体 (“EGFR”) 抑制剂依吡替尼 (HMPL-813) 在食道癌模型中的抗肿瘤活性, 为依吡替尼的后续临床研究适应症选择奠定基础。

第一次会议: 新药问世

日期: 2014 年 4 月 6 日

主题: 沃利替尼的发现, 临床前及早期临床评估: 一种高选择性 c-Met 激酶抑制剂

第二次会议: 激酶抑制剂

日期: 2014 年 4 月 7 日

主题: 中国食道癌患者的 EGFR 基因扩增和蛋白表达研究及 EGFR 抑制剂: 依吡替尼在食道癌模型中的抗肿瘤活性

第三次会议: 模式生物的临床前研究

日期: 2014 年 4 月 8 日

主题: 在非小细胞肺癌临床前试验模型中靶向 MET 治疗: 为沃利替尼的后续临床研究奠定基础

详情可登陆: <http://chi-med.com/eng/irinfo/presentations.htm>. 更多 2014 AACR 年会信息及摘要可参见 “编者注” 和登陆 <http://www.aacr.org>.

关于 c-Met 通道

c-Met (也称为 HGFR) 信号通道在哺乳类动物正常生长和发育过程中具有特殊作用。然而已有研究表明, cMet 通道在不同的癌症中表现异常。异常通道的激活可导致癌细胞的增殖, 迁移及存活的失常。c-Met 通道的激活有

四种表现形式：c-Met 基因扩增，HGF/c-Met 过度表达，突变，以及与其他受体的串扰。c-Met 基因扩增在胃癌，头颈癌及肠癌中较为普遍；而 c-Met 的过度表达常见于许多实体肿瘤类型中，如肺癌，胃癌，头颈癌，肠癌及食道癌。此外，这其中的许多癌症，例如肺癌，胃癌及食道癌都与亚洲人口关系更为密切。

2008 年全球肺癌发病估计超过 160 万例，其中中国占了 52 万例。在中国和全球范围内，肺癌都是发病率最高的癌症。

关于沃利替尼

沃利替尼 (HMPL-504/AZD6094) 是一种高选择性口服 c-Met 激酶抑制剂，主要适应症包括肺癌、胃癌和肾癌。它能有效抑制人体肿瘤模型中的肿瘤增殖，尤其是 c-Met 基因扩增及高表达的肿瘤。c-Met 基因扩增及高蛋白表达水平将做为筛选临床受试者的标准。2011 年 12 月，和黄医药与英国阿斯利康签署关于开发沃利替尼的合作协议，并于 2012 年 2 月启动了在澳大利亚的临床 I 期试验。2013 年 6 月，和黄医药在中国启动沃利替尼的临床 I 期试验。

截至目前，沃利替尼在晚期癌症患者的临床试验中显现出良好的安全性，耐受性及药效/药代动力学特性。其在多种肿瘤类型中表现出良好的抗肿瘤活性，尤其是乳头状肾细胞癌（“PRCC”），这种肾癌目前国际上尚无公认的治疗方法。乳头状肾细胞癌占到肾癌新发病例的 10-15%。基因突变导致的 c-Met 信号通道畸变激活在乳头状肾细胞癌得到了证实，因此对 c-Met 通道的有效抑制可能成为此类癌症的一种治疗方式。

和黄医药将在 2014 年 5 月 30 日至 6 月 3 日美国芝加哥举行的美国临床肿瘤学会（ASCO）2014 年会上公布沃利替尼的 I 期临床试验的结果。针对多种肿瘤类型的 c-Met 基因扩增，基因突变及过度表达的 II 期概念验证性（POC）研究也计划将于年内展开。

关于食道癌

作为全球第五大最常见的恶性肿瘤，食道癌在中国的癌症致死率位列第四，几乎每十位癌症患者中就有一位死于食道癌。虽然食道癌的诊断和全身化疗方案已经取得了长足的进步，但其整体的预后却差强人意。综合统计食道癌各期的 5 年整体存活率仅在 15-25% 左右，患者亟盼更好的治疗方案。

关于依吡替尼

表皮生长因子(EGF) 及其受体 (EGFR) 信号通道在人体正常生长和发育过程中具有特殊作用。然而大量的研究表明，EGFR 通道的异常表现和激活可诱发多种恶性肿瘤，如肺癌，肠癌及食道癌等。激活的 EGFR 通道可导致肿瘤细胞增殖，迁移侵入脑部及其他组织器官。依吡替尼 (HMPL-813) 是和黄医药自主研发的口服表皮生长因子受体 (EGFR) 酪氨酸激酶抑制剂。在多种移植瘤的模型研究中，通过口服给药的方式，依吡替尼展现出良好的激酶选择性及广谱抗肿瘤活性。在原位脑瘤模型的临床前研究中，依吡替尼亦表现出良好的脑组织渗透性及疗效，以远低于致毒水平的口服剂量在脑组织中达到了预期疗效所需的药物浓度。和黄医药于 2011 年在中国启动的 I 期临床试验显示依吡替尼具有良好的药物耐受性及药代动力学特性，同时具备 EGFR 抑制剂预期的抗肿瘤活性，且在伴有 EGFR 激活突变的非小细胞肺癌患者中获得了部分响应。