

和黄医药将在 2014 年度 ASCO 大会上公布 VEGFR, c-Met 和 VEGFR/FGFR 选择性抑制剂的 I 期临床数据

2014 年 5 月 22 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 5 月 30 日至 6 月 3 日于美国芝加哥举行的第 50 届美国临床肿瘤学会 (ASCO) 年会上公布部分在研产品的 I 期和 Ib 期临床研究数据, 其中包括由和黄医药自主研发的三个新型高选择性小分子药物 咪唑替尼 (HMPL-013), AZD6094 (HMPL-504/沃利替尼) 和 索凡替尼 (HMPL-012)。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。

美国临床肿瘤学会是一个成立于 1964 年的非盈利性组织, 宗旨是改善肿瘤的治疗与预防。目前已有约 30000 名肿瘤科医师加入了 ASCO, 分属各个肿瘤专科和亚专科。会员包括肿瘤治疗及预防领域的各界医师和专家。每年这些专业人员聚集在 ASCO, 一同探讨尖端科技, 进行学习交流。

和黄医药将分别对三个新型激酶抑制剂进行展示公布, 相关信息如下:

标题: 选择性 VEGFR 抑制剂咪唑替尼针对有既往治疗史的晚期结直肠癌病患的 Ib 期临床研究
摘要编号: #3548
目录: 胃肠 (结直肠) 癌
日期 & 时间: 2014 年 5 月 31 日, 上午 8:00

标题: 选择性 c-Met 抑制剂 AZD6094 (HMPL-504/沃利替尼) 针对晚期实体瘤的首次人体 I 期临床研究
摘要编号: #11111
目录: 肿瘤生物学
日期 & 时间: 2014 年 5 月 31 日, 下午 1:15

标题: 选择性 VEGFR/FGFR 双抑制剂索凡替尼研磨制剂针对晚期实体瘤的首次人体 I 期临床研究
摘要编号: #2615
目录: 药物开发
日期 & 时间: 2014 年 5 月 31 日, 上午 8:00

详情可登录 www.chi-med.com。更多关于 2014 ASCO 年会及摘要信息可登录 am.asco.org。

关于血管细胞内皮生长因子受体 (VEGF) 和中国的结直肠癌现状

癌症进入到晚期，肿瘤会分泌大量的蛋白配体血管细胞内皮生长因子(VEGF)，以促进肿瘤组织周围过度的脉管系统的生成(血管生成)，为肿瘤细胞的生长提供更多的血流，氧气和营养。VEGF 和其受体 VEGFR 在肿瘤的血管生成中起到了至关重要的作用，因此，对 VEGF/VEGFR 相关通路的抑制成为了阻断新生血管发展，防止肿瘤增长和侵入的一种新的治疗策略。

结直肠癌是中国第三大最常见的恶性肿瘤，2012 年发病率占癌症患者的 10.2%。中国的结直肠癌患者人数预计达到了 39 万例，成为了继肺癌，肝癌，胃癌和食道癌之后的第五大癌症致死原因。

截至目前，数种抗 VEGF/VEGFR 制剂对多种肿瘤类型显示出临床疗效。纵观中国癌症市场的规模和增长情况，未来几年中国的 VEGF/VEGFR 抑制剂市场将飞速发展。

关于呋喹替尼

呋喹替尼是一种新型高选择性抑制血管细胞内皮生长因子受体 (VEGFR1,2 及 3) 的小分子化合物。在临床 I 期试验中有 40 名晚期癌症患者接受了呋喹替尼的给药治疗。和黄医药在 2013 年 4 月举行的美国癌症研究协会 (AACR) 年会上公布了 I 期临床试验的详细结果，详情可见 www.chi-med.com。基于 I 期的临床数据，II 期临床试验已于 2014 年 4 月初启动，为随机双盲安慰剂对照的多中心验证性临床试验，该试验的受试者为转移性结直肠癌患者。

2013 年 10 月，和黄医药与美国礼来就呋喹替尼在中国的开发、审批和销售正式签署了协议。

关于肾细胞癌 (肾癌)

肾细胞癌占成人恶性肿瘤约 3%。在美国，每年有 65,000 个新发病例被诊断为肾细胞癌，每年死亡病例为 13,500 例。全球范围内，每年诊断出 270,000 个新发病例，死亡病例达到 116,000 例。相比女性，男性患肾细胞癌的机率更高，高发年龄为 50-70 岁。

肾细胞癌是由多种具有不同基因和生化特点的肿瘤亚型组成的一种异质性疾病。在肾细胞癌的肿瘤变异型中，透明细胞性肾癌是最常见的，占到肾脏恶性肿瘤的 75-90%。而乳头状肾细胞癌 (PRCC) 是非透明细胞性肾癌中最常见的种类，占其总数的 10-15%。

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 蛋白过度表达，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 的蛋白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 (伴有 EGFR 基因突变) 都与亚洲人口关系更为密切。

C-Met 酪氨酸激酶结构域的突变已经在遗传性的乳头状肾细胞癌(PRCC)患者中得到明确验证，直接表明 c-Met 参与到人体肿瘤生成。

关于沃利替尼 (HMPL-504/AZD6094)

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 基因扩增及蛋白高表达的肿瘤。c-Met 基因扩增及蛋白高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。

关于索凡替尼 (HMPL-012)

索凡替尼 (HMPL-012) 是以血管细胞内皮生长因子受体 (VEGFR) 和成纤维细胞生长因子受体 (FGFR) 双靶点的酪氨酸激酶抑制剂。临床前数据表明索凡替尼选择性良好，主要作用于 VEGFR 和 FGFR，能有效抑制肿瘤血管的生成。主要适应症包括肝细胞癌（肝癌）、神经内分泌肿瘤、结直肠癌和乳腺癌。索凡替尼的首次人体临床 I 期试验已在中国启动，截至目前，该药显示出良好的安全性，耐受性及药代动力学特性，在包括肝癌在内的多种肿瘤类型中表现出良好的抗肿瘤活性。

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 位科学家和员工，其在研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。