

和黃醫藥將在 2014 年度 ASCO 大會上公佈 VEGFR, c-Met 和 VEGFR/FGFR 選擇性抑制劑的 I 期臨床資料

2014 年 5 月 22 日: 和黃中國醫藥科技有限公司 (簡稱 “和黃醫藥”) 今日宣布, 將在 2014 年 5 月 30 日至 6 月 3 日於美國芝加哥舉行的第 50 屆美國臨床腫瘤學會 (ASCO) 年會上公佈部分在研產品的 I 期和 Ib 期臨床研究數據, 其中包括由和黃醫藥自主研發的三個新型高選擇性小分子藥物呋喹替尼 (HMPL-013), AZD6094 (HMPL-504/ 沃利替尼) 和索凡替尼 (HMPL-012)。沃利替尼的數據發布由和黃醫藥與合作夥伴阿斯利康共同籌備。

美國臨床腫瘤學會是一個成立於 1964 年的非盈利性組織, 宗旨是改善腫瘤的治療與預防。目前已有約 30000 名腫瘤科醫師加入了 ASCO, 分屬各個腫瘤專科和亞專科。會員包括腫瘤治療及預防領域的各界醫師和專家。每年這些專業人員聚集在 ASCO, 一同探討尖端科技, 進行學習交流。

和黃醫藥將分別對三個新型激酶抑制劑進行展示公佈, 相關信息如下:

標題: 選擇性 VEGFR 抑制劑呋喹替尼針對有既往治療史的晚期結直腸癌病患的 Ib 期臨床研究

摘要編號: #3548

目錄: 胃腸(結直腸)癌

日期& 時間: 2014 年 5 月 31 日, 上午 8:00

標題: 選擇性 c-Met 抑制劑 AZD6094 (HMPL-504/ 沃利替尼) 針對晚期實體瘤的首次人體 I 期臨床研究

摘要編號: #11111

目錄: 腫瘤生物學

日期& 時間: 2014 年 5 月 31 日, 下午 1:15

標題: 選擇性 VEGFR/FGFR 雙抑制劑索凡替尼研製劑針對晚期實體瘤的首次人體 I 期臨床研究

摘要編號: #2615

目錄: 藥物開發

日期& 時間: 2014 年 5 月 31 日, 上午 8:00

詳情可登錄 www.chi-med.com。更多關於 2014 ASCO 年會及摘要信息可登錄 am.asco.org。

關於血管細胞內皮生長因數受體 (VEGF) 和中國的結直腸癌現狀

癌症進入到晚期，腫瘤會分泌大量的蛋白配體血管細胞內皮生長因子(VEGF)，以促進腫瘤組織周圍過度的脈管系統的生成(血管生成)，為腫瘤細胞的生長提供更多的血流，氧氣和營養。VEGF 和其受體 VEGFR 在腫瘤的血管生成中起到了至關重要的作用，因此，對 VEGF/VEGFR 相關通路的抑製成為了阻斷新生血管發展，防止腫瘤增長和侵入的一種新的治療策略。

結直腸癌是中國第三大最常見的惡性腫瘤，2012 年發病率佔癌症患者的 10.2%。中國的結直腸癌患者人數預計達到了 39 萬例，成為了繼肺癌，肝癌，胃癌和食道癌之後的第五大癌症致死原因。

截至目前，數種抗 VEGF/VEGFR 製劑對多種腫瘤類型顯示出臨床療效。縱觀中國癌症市場的規模和增長情況，未來幾年中國的 VEGF/VEGFR 抑製劑市場將飛速發展。

關於呋喹替尼

呋喹替尼是一種新型高選擇性抑制血管細胞內皮生長因子受體 (VEGFR1,2 及 3) 的小分子化合物。在臨床 I 期試驗中有 40 名晚期癌症患者接受了呋喹替尼的給藥治療。和黃醫藥在 2013 年 4 月舉行的美國癌症研究協會 (AACR) 年會上公佈了 I 期臨床試驗的詳細結果，詳情可見 www.chi-med.com。基於 I 期的臨床數據，II 期臨床試驗已於 2014 年 4 月初啟動，為隨機雙盲安慰劑對照的多中心驗證性臨床試驗，該試驗的受試者為轉移性結直腸癌患者。

2013 年 10 月，和黃醫藥與美國禮來就呋喹替尼在中國的開發、審批和銷售正式簽署了協議。

關於腎細胞癌 (腎癌)

腎細胞癌佔成人惡性腫瘤約 3%。在美國，每年有 65,000 個新發病例被診斷為腎細胞癌，每年死亡病例為 13,500 例。全球範圍內，每年診斷出 270,000 個新發病例，死亡病例達到 116,000 例。相比女性，男性患腎細胞癌的機率更高，高發年齡為 50-70 歲。

腎細胞癌是由多種具有不同基因和生化特點的腫瘤亞型組成的一種異質性疾病。在腎細胞癌的腫瘤變異型中，透明細胞性腎癌是最常見的，占到腎臟惡性腫瘤的 75-90%。而乳頭狀腎細胞癌 (PRCC) 是非透明細胞性腎癌中最常見的種類，佔其總數的 10-15%。

關於 c-Met 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，cMet 通道在不同的癌症中表現異常。異常通道的激活可導致癌細胞的增殖，遷移及存活的失常。c-Met 通道的激活有四種表現形式：c-Met 基因擴增，HGF/c-Met 蛋白過度表達，突變，以及與其他受體的串擾。c-Met 基因擴增在胃癌，頭頸癌及腸癌中較為普遍；而 c-Met 的蛋白過度表達常見於許多實體腫瘤類型中，如肺癌，胃癌，頭頸癌，腸癌及食道癌。此外，這其中的許多癌症，例如肺癌，胃癌及食道癌 (伴有 EGFR 基因突變) 都與亞洲人口關係更為密切。

C-Met 酪氨酸激酶結構域的突變已經在遺傳性的乳頭狀腎細胞癌(PRCC) 患者中得到明確驗證，直接表明 c-Met 參與到人體腫瘤生成。

關於沃利替尼(HMPL-504/AZD6094)

沃利替尼(HMPL-504/AZD6094) 是一種高選擇性口服 c-Met 激酶抑制劑，主要適應症包括肺癌、胃癌和腎癌。它能有效抑制人體腫瘤模型中的腫瘤增殖，尤其是 c-Met 基因擴增及蛋白高表達的腫瘤。c-Met 基因擴增及蛋白高表達水平將做為篩選臨床受試者的標準。2011 年 12 月，和黃醫藥與英國阿斯利康簽署關於開發沃利替尼的合作協議，並於 2012 年 2 月啟動了在澳大利亞的臨床 I 期試驗。2013 年 6 月，和黃醫藥在中國啟動沃利替尼的臨床 I 期試驗。

關於索凡替尼 (HMPL-012)

索凡替尼 (HMPL-012) 是以血管細胞內皮生長因子受體 (VEGFR) 和成纖維細胞生長因子受體 (FGFR) 雙靶點的酪氨酸激酶抑制劑。臨床前數據表明索凡替尼選擇性良好，主要作用於 VEGFR 和 FGFR ，能有效抑制腫瘤血管的生成。主要適應症包括肝細胞癌（肝癌）、神經內分泌腫瘤、結直腸癌和乳腺癌。索凡替尼的首次人體臨床 I 期試驗已在中國啟動，截至目前，該藥顯示出良好的安全性，耐受性及藥代動力學特性，在包括肝癌在內的多種腫瘤類型中表現出良好的抗腫瘤活性。

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。