

呋喹替尼首個概念驗證性臨床研究成功，和黃醫藥獲得 1800 萬美元里程碑付款

星期二，2015 年 5 月 12 日：和黃中國醫藥科技有限公司今日宣布呋喹替尼以轉移性結直腸癌為適應症的首個概念驗證性 (POC) 臨床研究達到預期終點，成功觸發第一個里程碑，和黃醫藥將於 2015 年第二季度獲得禮來 1800 萬美元付款。呋喹替尼是由和黃醫藥自主研發的一種血管內皮生長因子酪氨酸激酶受體的新型選擇性抑製劑。該研究的詳細結果將在今年的重要醫學會議上公佈。

基於 2013 年 10 月禮來與和黃醫藥簽署的共同致力於呋喹替尼在中國的開發、審批和銷售的合作協議，和黃醫藥將獲得 1000 萬美元的里程碑付款。此外，和黃醫藥還將收到 800 萬美元的付款，用於補償籌備和啟動轉移性結直腸癌在中國的 III 期 FRESCO 臨床研究，以及在蘇州建立臨床供藥生產基地的相關費用。

和黃中國醫藥科技有限公司的首席執行官賀雋表示：“我們非常高興呋喹替尼的首個概念驗證性臨床研究成功。與禮來的合作對和黃醫藥而言意義非凡，希望我們繼續加深合作，使呋喹替尼在不久的將來能大獲成功。”

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。血管生成對腫瘤的形成發揮著關鍵的作用，抑制由 VEGF 調控的新生血管的生成成為了治療多種腫瘤的重要途徑。

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。

2014 年 4 月，和黃醫藥啟動呋喹替尼的首個概念驗證性 II 期臨床研究，該試驗旨在比較呋喹替尼聯合最佳支持治療和安慰劑聯合最佳支持治療作為轉移性結直腸癌患者的三線或以上療法的藥效及安全性。該試驗為隨機雙盲安慰劑對照的多中心臨床試驗。目標受試者為至少經過 2 輪抗腫瘤治療失敗的轉移性結腸癌患者，曾用藥物包括奧沙利鉑和氟尿嘧啶類藥物及伊立替康。總計 71 名患者以 2:1 的比例隨機接受呋喹替尼聯合最佳支持治療或安慰劑聯合最佳支持治療。

該研究於 2014 年 8 月完成入組。和黃醫藥於 2015 年 3 月，宣布呋喹替尼以轉移性結直腸癌為適應症的首個 POC 臨床研究成功達到主要試驗終點。研究結果顯示該試驗成功地達到了無進展生存期的主要療效終點。次要療效終點（包括客觀緩解率，疾病控制率以及總生存期）的評估工作目前正在開展中。此次概念驗證性研究證實呋喹替尼的安全性與之前的臨床試驗所獲得的數據相符，未出現超出預期的重大不良安全事件。試驗的詳細結果將於稍後公佈。

2014 年 6 月，和黃醫藥啟動了呋喹替尼治療非小細胞肺癌的 II 期臨床試驗，該臨床研究為隨機雙盲安慰劑對照的多中心驗證性臨床試驗。共有 91 名患者以 2:1 的比例隨機接受呋喹替尼聯合最佳支持治療或者安慰劑聯合最佳支持治療。呋喹替尼以非小細胞肺癌為適應症的 II 期臨床試驗已於 2015 年 3 月完成受試者入組，預計將於 2015 年中公佈試驗結果。

2014 年 10 月，和黃醫藥啟動了呋喹替尼的 Ib 期劑量探究臨床試驗，與紫杉醇聯合用藥治療二線胃癌患者。

同年 12 月，呋喹替尼以結直腸癌為適應症的中國 III 期臨床試驗（FRESCO）正式啟動。目標受試者為局部晚期或轉移性結直腸癌患者，這些受試者至少經過 2 輪抗腫瘤治療的失敗，曾用藥物包括奧沙利鉑和氟尿嘧啶類藥物及伊立替康。該臨床研究中，約 25 家研究中心將入組超過 400 名受試者，研究結果預計將於 2016 年公佈。

關於血管細胞內皮生長因子受體（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 相關通路的抑制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 中國的結直腸癌患者人數預計達到了 39 萬例，年發病率佔癌症患者的 10.2%，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 抑制劑市場將飛速發展。