

和黃醫藥在中國啟動新型 FGFR 抑製劑 HMPL 453 的 I/II 期臨床試驗

2017 年 6 月 22 日：和黃醫藥近日在中國啟動 HMPL-453 的 I/II 期臨床試驗。HMPL-453 是一種靶向成纖維細胞生長因子受體 (FGFR) 的新型高選擇性小分子抑製劑。2017 年 6 月 19 日首位受試者接受給藥治療。該試驗是今年早先在澳大利亞展開的 I 期臨床試驗的一項補充研究。

該試驗是一項多中心單臂開放標籤的兩階段研究，旨在評估 HMPL - 453 作為單一療法在治療攜帶 FGFR 基因突變的實體瘤患者中的安全性，耐受性，藥代動力學特性和初步療效。劑量爬升階段將招募局部晚期或轉移性實體瘤的患者，這些患者缺乏標準療法或標準療法被證實為無效或不耐受，但暫不考慮 FGFR 基因表達狀態，旨在確定最大耐受劑量和臨床 II 期研究的推薦劑量。

劑量爬升之後的劑量擴展階段將進一步評估臨床 II 期研究推薦劑量的安全性，耐受性和藥代動力學特性以及初步的抗腫瘤功效。這一階段將主要招募有 FGFR 異常表達的癌症患者，包括晚期膀胱癌，晚期膽管癌等實體腫瘤。第二階段研究的主要終點是客觀緩解率 (ORR)，次要終點包括緩解持續時間 (DoR)，疾病控制率(DCR)，無進展生存期(PFS)，總生存期(OS)和安全性。該研究的詳細信息請登陸 clinicaltrials.gov，檢索 [NCT03160833](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT03160833) 查看。

關於膀胱癌和膽管癌

膀胱癌佔尿路上皮癌的約 90%。膀胱癌是美國第六大，也是中國第九大最常見的惡性腫瘤，兩國每年各有約 80,000 例新發病例。在美國，疾病已轉移的患者五年生存率約為 5%。儘管局部晚期或轉移性尿路上皮癌的治療取得了一定進步，但患者的預後仍然很差，需要更多的治療方案。

作為在世界範圍內未得到滿足的醫療需求，膽管癌佔全球胃腸癌的 3% 左右，是膽道（肝，膽囊和膽管的聯合系統）最常見的惡性腫瘤。膽管癌根據解剖位置分為肝內或肝外，研究表明肝內膽管癌的發生率有明顯的上升。目前膽管癌預後不佳，5 年生存率低於 5%。

關於 FGFR

FGFR 是受體酪氨酸激酶的亞家族。FGFR 信號通路的激活是數個生物過程的關鍵。在正常生理情況下，FGF / FGFR 信號通路參與胚胎髮育（器官發生和形態發生），組織修復，血管生成，神經內分泌和代謝平衡。鑑於其在許多重要生理過程中的複雜性和關鍵作用，異常的 FGFR 信號傳導被發現是腫瘤增長，促進血管生成以及針對抗腫瘤治療產生抗性的驅動力。目前還沒有專門針對 FGFR 信號通路的療法獲批。

關於 HMPL-453

HMPL - 453 是一種靶向成纖維細胞生長因子受體 FGFR 1, 2, 3 的新型高選擇性小分子抑制劑。在臨床前研究中, HMPL - 453 與同類其他藥物相比表現出藥效強, 激酶選擇性高及安全性更佳的特點。和黃醫藥正在澳大利亞展開 HMPL-453 的一項 I 期臨床研究, 詳細內容請登陸 clinicaltrials.gov, 檢索 [NCT02966171](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02966171) 查看。