

開拓藥業 AR-PROTAC (GT20029) 美國 I 期臨床試驗完成受試者入組給藥

北京時間 2022 年 10 月 27 日，開拓藥業（股票代碼：9939.HK），一家專注於潛在同類首創和同類最佳創新藥物研發及產業化的生物製藥公司，今日宣佈，其自主研發的新型靶向雄激素受體 (AR) 的蛋白降解嵌合體 (PROTAC) 化合物 GT20029 治療雄激素性脫髮和痤瘡的美國 I 期臨床試驗已於 2022 年 10 月 25 日完成全部 120 名受試者入組及給藥。GT20029 基於 PROTAC 技術開發，是全球首個進入臨床階段的外用 PROTAC 化合物。

該項 I 期臨床試驗是一項隨機、雙盲、安慰劑對照、平行設計、劑量遞增研究，以評估 GT20029 在健康受試者中單次給藥劑量遞增和在患有雄激素性脫髮或痤瘡的受試者中多次給藥劑量遞增後的安全性、耐受性和藥代動力學等特徵。

臨床前研究顯示，GT20029 通過降解雄激素受體蛋白可以有效阻斷 AR 信號通路啟動導致的毛囊產生的萎縮微型化作用，抑制毛髮變細、變軟和脫落。同時 GT20029 僅在局部產生療效，通過限制皮膚滲透從而減少全身藥物暴露，以獲得更好的安全性。

開拓藥業創始人、董事長兼首席執行官童友之博士表示：“非常高興看到 GT20029 美國 I 期臨床試驗完成入組和給藥，作為全球首家研發外用 PROTAC 的公司，我們一直在積極探索將 PROTAC 應用於臨床局部治療的創新藥物策略。GT20029 作為 PROTAC 化合物，在給藥頻次和藥效方面，和福瑞他恩相比，希望有所優化，滿足不同類型脫髮及痤瘡患者的需求。脫髮困擾著全球約 16 億人，痤瘡影響著全球約 7.2 億人，面對脫髮和痤瘡這兩個適應症巨大的未被滿足的臨床需

求，我們將加速推進 GT20029 和福瑞他恩的臨床進程，期待早日為全球雄激素性脫髮和痤瘡患者群體提供安全有效的創新療法。”

關於 GT20029

GT20029 是開拓藥業基於 PROTAC 技術開發的外用化合物。2021 年 4 月，中國國家藥品監督管理局 (NMPA) 批准 GT20029 開展臨床試驗。2022 年 8 月，GT20029 中國 I 期臨床試驗完成受試者入組給藥。2021 年 7 月，GT20029 獲得美國食品藥品監督管理局 (FDA) 的 I 期臨床試驗許可。2022 年 2 月，GT20029 美國 I 期臨床試驗完成首例受試者給藥。

關於開拓藥業

開拓藥業成立於 2009 年，專注發展潛在 “best-in-class” 和 “first-in-class” 創新藥物的研發及產業化，致力成為創新療法研究、開發及商業化的領軍企業。公司經過多年的發展，以雄激素受體 (AR) 相關疾病為核心，研發多通道產品組合，產品覆蓋全球高發病率癌症及其它未滿足臨床需求的疾病領域，包括新冠肺炎、前列腺癌、乳腺癌、肝癌、脫髮和痤瘡等。開拓藥業前瞻性佈局了包含小分子創新藥、生物創新藥及聯合療法的多元化產品管線，包括 7 款正在開展臨床研究的產品，如兩款雄激素受體 (AR) 拮抗劑、ALK-1 單抗、AR-PROTAC 化合物、PD-L1/TGF β 雙靶點抗體、mTOR 激酶靶向抑制劑和 Hedgehog 抑制劑，以及正在進行臨床前研究的 ALK-1/VEGF 雙抗和 c-Myc 抑制劑等。公司在全球擁有已獲得及申請中的 110 多項專利，多個專案被列為國家十二五、十三五 “重大新藥創制” 專項。2020 年 5 月 22 日，開拓藥業正式在香港聯

合交易所有限公司主機板掛牌上市，股票代碼：9939.HK。歡迎訪問公司網站：

www.kintor.com.cn