

开拓药业 AR-PROTAC (GT20029) 美国 I 期临床试验完成受试者入组给药

北京时间 2022 年 10 月 27 日，开拓药业（股票代码：9939.HK），一家专注于潜在同类首创和同类最佳创新药物研发及产业化的生物制药公司，今日宣布，其自主研发的新型靶向雄激素受体 (AR) 的蛋白降解嵌合体 (PROTAC) 化合物 GT20029 治疗雄激素性脱发和痤疮的美国 I 期临床试验已于 2022 年 10 月 25 日完成全部 120 名受试者入组及给药。GT20029 基于 PROTAC 技术开发，是全球首个进入临床阶段的外用 PROTAC 化合物。

该项 I 期临床试验是一项随机、双盲、安慰剂对照、平行设计、剂量递增研究，以评估 GT20029 在健康受试者中单次给药剂量递增和在患有雄激素性脱发或痤疮的受试者中多次给药剂量递增后的安全性、耐受性和药代动力学等特征。

临床前研究显示，GT20029 通过降解雄激素受体蛋白可以有效阻断 AR 信号通路启动导致的毛囊产生的萎缩微型化作用，抑制毛发变细、变软和脱落。同时 GT20029 仅在局部产生疗效，通过限制皮肤渗透从而减少全身药物暴露，以获得更好的安全性。

开拓药业创始人、董事长兼首席执行官童友之博士表示：“非常高兴看到 GT20029 美国 I 期临床试验完成入组和给药，作为全球首家研发外用 PROTAC 的公司，我们一直在积极探索将 PROTAC 应用于临床局部治疗的创新药物策略。GT20029 作为 PROTAC 化合物，在给药频次和药效方面，和福瑞他恩相比，希望有所优化，满足不同类型脱发及痤疮患者的需求。脱发困扰着全球约 16 亿人，痤疮影响着全球约 7.2 亿人，面对脱发和痤疮这两个适应症巨大的未被满足的临床需

求，我们将加速推进 GT20029 和福瑞他恩的临床进程，期待早日为全球雄激素性脱发和痤疮患者群体提供安全有效的创新疗法。”

关于 GT20029

GT20029 是开拓药业基于 PROTAC 技术开发的外用化合物。2021 年 4 月，中国国家药品监督管理局 (NMPA) 批准 GT20029 开展临床试验。2022 年 8 月，GT20029 中国 I 期临床试验完成受试者入组给药。2021 年 7 月，GT20029 获得美国食品药品监督管理局 (FDA) 的 I 期临床试验许可。2022 年 2 月，GT20029 美国 I 期临床试验完成首例受试者给药。

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/TGFβ 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