

吉利德和默沙东将共同开发并商业化在研 HIV 长效联合疗法

-合作将专注于 Lenacapavir 和 Islatravir 的口服和注射制剂-

-合作将两种处于研发后期的可能具有互补性的药物联合在一起，旨在提供创新、长效的 HIV 治疗方案-

2021年3月15日，吉利德科学和默沙东宣布，双方已达成协议，在 HIV 领域共同开发并商业化一项 HIV 长效治疗方案。这是一种联合了吉利德的在研核衣壳抑制剂 lenacapavir 和默沙东的在研核苷反转录酶易位抑制剂 islatravir 的双药疗法，有望为 HIV 感染者提供新的，且具有重要意义的治疗选择。

Islatravir 和 lenacapavir 都是处于临床试验后期的潜在的同类最优药物，目前均已获得关键性的临床数据。这两种药物的半衰期都很长，并且在临床研究中证明了低剂量的活性，可支持用于开发口服和注射用长效在研联合疗法。

口服联合疗法的首个临床研究预计将于 2021 年下半年开始。根据协议，吉利德和默沙东将成为合作伙伴，共担运营责任，分担开发、商业化和营销成本，也分享未来收益。

基于双方在革新 HIV 治疗方面的既往经验，默沙东和吉利德关注于对长效疗法的探索，这可能成为 HIV 药物开发的一大重要创新。如今，HIV 感染者已可通过单一片剂获得治疗，不过，相比口服单片，更低频次的口服用药或非经常性的注射治疗选择将有可能满足个人偏好，并解决与依从性和隐私有关的顾虑。

随着 HIV 治疗方案的发展，长效疗法可能为 HIV 感染者及其医生提供更多的选择，将有助于保持以感染者的个人需求为中心的治疗。

默沙东董事会主席兼首席执行官福维泽 (Kenneth C. Frazier) 表示：“在默沙东，我们坚定地致力于改善对 HIV 感染者的治疗，这是我们拯救生命、改善生活这一使命的一部分。与吉利德的合作将两家致力于抗击 HIV 的公司联系在一起，共同研发有潜力的新型长效治疗方案，是我们充分利用该新药治疗 HIV 战略的重要一步。”

“通过与默沙东的合作，吉利德进一步强化了我们在革新 HIV 治疗领域的长期实力。”吉利德科学董事长兼首席执行官 Daniel O'Day 说：“过去几十年来，我们通过倾听 HIV 感染者及治疗医生的声音而不断规划、提升我们在 HIV 领域的工作。现在，我们正采用同样的方法来推进长效疗法，并将结合两家公司的尖端科研以加速进展。”

Lenacapavir 和 islatravir 的单独或联合使用均属在研药物，尚未在中国或全球任何其他地方得到批准。它们的安全性和有效性尚未确定。

合作条款

根据协议条款，吉利德和默沙东将共同开发并共同商业化用于治疗 HIV 感染者的长效产品，该产品联合了吉利德的在研核衣壳抑制剂 lenacapavir 和默沙东的在研核苷反转录酶易位抑制剂 islatravir。合作最初将侧重于基于组合产品的长效口服制剂和长效注射制剂，如双方同意，也或将在合作中纳入其他制剂。

在口服和注射制剂项目中，吉利德和默沙东对于全球研发和商业化费用的分担比例分别为 60%和 40%。对于长效口服产品，吉利德将主导在美国的商业化，默沙东将主导在欧盟及世界其他地区的商业化。对于长效注射产品，默沙东将主导在美国的商业化，吉利德将主导在欧盟及世界其他地区的商业化。

吉利德和默沙东将在美国及其他特定主要市场进行联合推广。双方将平分全球产品收入，直至产品收入超过特定预设的收入水平。一旦口服联合疗法的年净销售额超过 20 亿美元，超过阈值部分的收入分成将调整为吉利德 65%、默沙东 35%。一旦注射联合疗法的年净销售额超过 35 亿美元，超过阈值部分的收入分成将调整为默沙东 65%、吉利德 35%。

除了基于 lenacapavir 和 islatravir 的潜在联合用药，吉利德还将有权选择许可默沙东的特定在研口服整合酶抑制剂用于与 lenacapavir 的联合用药研发。相应的，默沙东将有权选择许可吉利德的特定在研口服整合酶抑制剂用于与 islatravir 的联合用药研发。各方均可在另一家公司的在研整合酶抑制剂完成第一阶段临床试验后，对其行使选择权。在行使选择权后，两家公司将分担研发费用并分享收益，除非未行使选择权的公司选择退出。两家公司目前都有处于临床前开发阶段的口服一周一次的整合酶抑制剂。

Cowen&Company LLC 为吉利德的财务顾问。Hogan Lovells 和 White&Case, LLP 为吉利德的法律顾问。Morgan、Lewis & Bockius 和 Gibson Dunn 担任默沙东的法律顾问。

关于 Islatravir (MK-8591)

Islatravir (MK-8591) 是默沙东的在研核苷反转录酶易位抑制剂 (NRTTI)，有易位抑制（阻止核苷酸与 DNA 链的结合，导致即时链终止）和延迟链终止（即使在易位的情况下也会阻止核苷酸掺入）的双重作用。目前正在评估 islatravir 与其他反逆转录病毒药物联合治疗 HIV-1 感染的疗效，包括日服一次的 ILLUMINATE 临床试验。Islatravir 作为一种单一成分，在多种制剂中用于 HIV-1 感染的暴露前预防 (PrEP) 的研究也正在开展，其中包括评估每月一次口服方案的 IMPOWER 临床试验。2012 年，默沙东从位于日本町市的 Yamasa 公司获得 islatravir (4'-乙炔基-2-氟-2'-脱氧腺苷或 EFdA) 的许可证。

关于 Lenacapavir

Lenacapavir 是一种新型的在研核衣壳抑制剂，能够阻断 HIV 衣壳（一种包围和保护病毒遗传物质和必需酶的蛋白质）的活性。在体外研究中，lenacapavir 阻断了病毒生命周期的多个不同阶段，有望阻止病毒变得具有传染性或影响未受感染的细胞。多个正在进行的临床研究对 lenacapavir 的安全性、有效性和剂量进行了评估。AID2020 公布的第一阶段研究数据显示，通过每六个月一次皮下注射 lenacapavir，可用于 HIV 治疗和预防。在 2020 年美国感染性疾病周（ID Week 2020）期间，吉利德宣布了计划评估 lenacapavir 作为可注射的 PrEP 方案，每六个月一次用于顺性别女性。此外，吉利德还计划针对与男性发生性关系的男性和有变性经历的人群开展 PrEP 研究。这两项研究预计将于 2021 年开始。