



Leap Therapeutics和百济神州宣布DKN-01联合百泽安®针对转移性胃腺癌或胃食管结合部癌临床试验实现首例患者给药

美国麻省剑桥和中国北京 -- 2020年9月21日 -- Leap Therapeutics（纳斯达克代码：LPTX）是一家开发靶向免疫肿瘤疗法的生物技术公司；百济神州（纳斯达克代码：BGNE；香港联交所代码：06160）是一家处于商业阶段的生物科技公司。两家公司今天宣布DisTinGuish临床试验已实现首例患者给药。DisTinGuish是一项2a期临床试验，旨在评估Leap Therapeutics的在研抗Dickkopf-1（DKK1）抗体DKN-01联合百济神州的抗PD-1抗体百泽安®，另加化疗或不加化疗，用于治疗胃腺癌或胃食管结合部癌（G/GEJ）患者。

Leap Therapeutics首席医学官Cynthia Sirard医学博士表示：“DisTinGuish临床试验实现首例患者给药是DKN-01研究项目中的一个关键里程碑事件。我们很高兴能有机会评估DKN-01与百泽安®联合用药，特别是在一组携带DKK1生物标志物的食管胃癌患者群体中已有不俗的表现。我们期待与百济神州紧密合作，评估该项新型联合疗法的潜力，应对这一在全球范围内高度未被满足的医疗需求。”

DisTinGuish是一项非随机、开放性、多中心的2a期临床试验（[NCT04363801](#)），旨在评估DKN-01联合百泽安®，另加化疗或不加化疗，作为不可手术局部晚期成年G/GEJ腺癌患者的一线或二线疗法。该临床试验将分为两个部分进行，预计将入组至多72例患者。

A部分将入组至多24例未曾接受过全身治疗的局部晚期/转移性G/GEJ腺癌患者（一线疗法），B部分将入组至多48例先前接受过治疗、不可手术的局部晚期或转移性的DKK1高表达的G/GEJ腺癌患者（二线疗法）。该项临床研究旨在评估G/GEJ腺癌患者接受静脉注射DKN-01及百泽安®，另加或不加CAPOX（卡培他滨和奥沙利铂）治疗的安全性、耐受性及有效性。治疗将以21天为周期重复进行，直至患者符合预先制定的治疗中断标准或不再获得临床益处。该试验的A、B两个部分将同时进行。

Leap Therapeutics先前与百济神州就DKN-01达成一项独家选择权和授权许可协议，其中百济神州获得在亚洲（日本除外）、澳大利亚和新西兰开发和商业化DKN-01的独家授权许可，而Leap Therapeutics保留在世界其他地区开发、生产和商业化DKN-01的独家权利。Leap Therapeutics在美国开展的此项联合用药试验为该协议的一部分。

关于 DKN-01

DKN-01是一款人源化单克隆抗体，可与Dickkopf-1（DKK1）蛋白结合并阻断其活性，Dickkopf-1（DKK1）蛋白是Wnt/ β -catenin信号传导的调节剂，Wnt/ β -catenin信号是一种通常涉及肿瘤发生和抑制免疫系统的信号通路。DKK1通过增强髓样抑制细胞的活性并抑制NK配体对肿瘤细胞的作用，在肿瘤细胞信号传导和介导免疫抑制性肿瘤微环境中发挥重要作用。美国食品药品监督管理局（U.S. FDA）已授予DKN-01孤儿药资格认定，用于治疗胃和胃食管结合部腺癌。

关于百泽安®（替雷利珠单抗注射液）

百泽安®是一款人源化IgG4抗程序性死亡受体1（PD-1）单克隆抗体，设计目的是为最大限度地减少与巨噬细胞中的Fc γ R受体结合。临床前数据表明，巨噬细胞中的Fc γ R受体结合之后会激活抗体依赖细胞介导杀伤T细胞，从而降低了PD-1抗体的抗肿瘤活性。百泽安®已获得中国国家药品监督管理局（NMPA）批准用于治疗至少经过二线系统化疗的复发或难治性经典霍奇金淋巴瘤患者，以及获批用于治疗PD-L1高表达的含铂化疗失败包括新辅助或辅助化疗12个月内进展的局部晚期或转移性尿路上皮癌患者。

此外，NMPA药品审评中心（CDE）已受理百泽安®的三项新适应症上市申请且正在审评过程中，包括一项用于治疗既往接受过治疗的不可切除肝细胞癌患者、一项联合化疗用于治疗一线晚期鳞状非小细胞肺癌（NSCLC）患者以及另一项联合化疗用于治疗一线晚期非鳞状NSCLC患者。

百泽安®在中国以外国家地区尚未获批。

关于胃腺癌或胃食管结合部腺癌

胃腺癌（胃癌）是全球最常见及死亡率最高的癌症之一，特别是在老年男性中ⁱ。根据 GLOBOCAN 2018 数据，胃癌是第五大常见肿瘤和第三大致死癌症，2018 年约有 783,000 例死亡ⁱ。百分之九十五的胃癌病例为腺癌ⁱ。胃癌的发病和死亡率根据地区差异很大，与饮食和幽门螺旋杆菌感染高度相关ⁱ。胃食管结合部为连接食道和胃的区域。考虑到其解剖位置，在临床试验中，胃食管结合部腺癌经常与食道癌或胃癌归为一类。

关于 Leap Therapeutics

Leap Therapeutics（纳斯达克代码：LPTX）专注于开发靶向和免疫肿瘤疗法。DKN-01是Leap Therapeutics最先进的临床候选药物，是一款针对Wnt通路调节剂Dickkopf-1（DKK1）蛋白的人源化单克隆抗体。公司目前正在开展DKN-01用于治疗食管胃癌、肝胆癌、妇科癌症和前列腺癌的临床试验。Leap Therapeutics已与百济神州有限公司达成战略合作，百济神州由此获得在亚太地区（日本除外）开发和商业化Leap Therapeutics的DKN-01的权利。有关 Leap Therapeutics 的更多信息，请访问<http://www.leaptx.com>或Leap Therapeutics向美国证券交易委员会提交的公开文件，这些文件可通过电子化数据收集、分析及检索系统（EDGAR）在<http://www.sec.gov>上或通过<https://investors.leaptx.com>查阅。

关于百济神州

百济神州是一家全球性、商业阶段的生物科技公司，专注于研究、开发、生产以及商业化创新性药物以为全世界患者提高疗效和药品可及性。百济神州目前在中国大陆、美国、澳大利亚和欧洲拥有 4200 多名员工，正在加速推动公司多元化的新型疗法药物管线。目前，百济神州两款自主研发的药物，BTK 抑制剂百悦泽®（泽布替尼胶囊）正在美国和中国进行销售、抗 PD-1 抗体药物百泽安®（替雷利珠单抗注射液）在中国进行销售。此外，百济神州在中国正在或计划销售多款由安进公司、新基物流有限公司（隶属百时美施贵宝公司）以及 EUSA Pharma 授权的肿瘤药物。欲了解更多信息，请访问 www.beigene.cn。

Leap Therapeutics 前瞻性声明

本新闻稿包含《1933年证券法》第27A条、《1934年证券交易法》第21E条和《1995年私人证券诉讼改革法》所指的前瞻性声明，涉及风险和不确定性。这些声明包括有关DKN-01推进期望的声明，包括未来研究的启动、时间和设计、未来研究的注册、未来选择权行使的可能性、里程碑或百济神州支付的特许权使用费，以及其他未来的期望、计划和前景。尽管Leap Therapeutics公司认为，截至作出声明之日，该等前瞻性声明中反映的期望是合理的，但前瞻性声明会受到已知和未知的风险、不确定性和其他因素的影响，这些因素可能导致实际结果与我们的期望存在重大差异。该风险和不确定性包括但不限于：新型冠状病毒带来的临床试验的启动、实施与完成，实验室操作，生产活动和其他研究的延迟及其他不利影响；我们对费用、未来收入、资本要求和融资需求的估计的准确性；我们产品开发活动和临床试验的结果、成本和时间安排；不确定的临床开发过程，包括临床试验可能没有有效的设计或无法产生积极结果的风险；我们获得和保持对我们的候选药物的监管批准的能力；我们的候选药物市场的规模和增长潜力；我们继续获得和维护我们的候选药物的知识产权保护的能力；以及其他风险。有关可能导致实际结果出现重大差异的因素的详细信息，将包含在Leap Therapeutics向美国证券交易委员会提交的定期文件中，包括Leap Therapeutics于2020年3月16日向美国证券交易委员会提交的截至 2019年12月31日财年的年度报告10-K 表格，季度报告10-Q表格以及向美国证券交易委员会呈报的其他相关表格。本新闻稿中包含的任何前瞻性声明仅针对截止于作出声明之日的情况。我们没有义务更新本新闻稿中包含的任何前瞻性声明，以反映本新闻稿发布之日以后所发生的事件或情况，或反映意外事件的发生。

百济神州前瞻性声明

本新闻稿包含根据《1995年私人证券诉讼改革法案》（Private Securities Litigation Reform Act of 1995）以及其他联邦证券法律中定义的前瞻性声明，包括有关DKN-01与百泽安®联合用药相关的进展、预期的临床开发和药政注册里程碑以及该组合疗法潜能的声明。由于各种重要因素的影响，实际结果可能与前瞻性声明有重大差异。这些因素包括了以下事项的风险：百济神州证明其候选药物功效和安全性的能力；候选药物的临床结果可能不支持进一步开发或上市审批；药政部门的行动可能会影响到临床试验的启动、时间表和进展以及产品上市审批；百济神州的上市产品及药物候选物（如能获批）获得商业成功的能力；百济神州对其技术和药物知识产权保护获得和维护的能力；百济神州依赖第三方进行药物开发、生产和其他服务的情况；百济神州有限的营运历史和获得进一步的营运资金以完成候选药物开发和商业化的能力；新冠肺炎全球大流行对公司临床开发、商业化运营以及其他业务带来的影响；以及百济神州在最近年度报告的10-Q表格中“风险因素”章节里更全面讨论的各类风险；以及百济神州向美国证券交易委员会会后呈报中关于潜在风险、不确定性以及其他重要因素的讨论。本新闻稿中的所有信息仅及于新闻稿发布之日，除非法律要求，百济神州并无责任更新这些信息。

Leap Therapeutics 联系人

Douglas E. Onsi
+1 617-714-0360
donsi@leaptx.com

Heather Savelle
+1 212-600-1902
heather@argotpartners.com

百济神州联系人

投资者联系人
周密
+86 10-5895-8058
ir@beigene.com

媒体联系人
吕磊
+86 10-6844-5311
media@beigene.com

ⁱ <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC6444111/>