



Leap Therapeutics和百济神州宣布就DKN-01达成独家选择权和授权许可协议； Leap Therapeutics同时宣布2700万美元股权融资

- 百济神州获得在亚太地区（日本除外）开发和商业化Leap Therapeutics的DKN-01的权利
- 计划启动Leap Therapeutics的DKN-01与百济神州的抗PD-1抗体替雷利珠单抗的联合研究

美国麻省剑桥和中国北京，2020年1月3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医药公司，专注于用于癌症治疗的创新型分子靶向和免疫肿瘤药物的开发和商业化。两家公司今日宣布，就Leap Therapeutics的Dickkopf-1（DKK1）抗体DKN-01在亚洲（日本除外）、澳大利亚和新西兰的临床开发和商业化达成了独家选择权和许可协议。Leap Therapeutics将保留在世界其他地区开发、生产和商业化DKN-01的独家权利。此外，Leap Therapeutics宣布与百济神州和两家机构投资者达成一项2700万美元的股权融资协议。

百济神州战略合作

百济神州免疫肿瘤学首席医学官贲勇医学博士表示：“我们很高兴能够探索抗PD-1抗体替雷利珠单抗与DKN-01的联合疗法，DKN-01迄今为止在生物标志物定义的胃癌患者中和免疫检查点抑制剂结合表现积极。与Leap Therapeutics的合作是我们致力于开发创新疗法以满足亚洲和世界各地尚未满足的医疗需求的又一例证。”

根据协议条款，Leap Therapeutics将从百济神州获得300万美元的预付现金付款，百济神州将获得在亚洲（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。如百济神州依据后续初步概念验证试验结果决定行权，Leap Therapeutics将有资格从百济神州获得一笔额外付款。此外，Leap Therapeutics有资格根据特定开发、监管和销售里程碑的实现从百济神州获得付款，总交易价值最高为1.32亿美元，并有资格获得DKN-01在许可区域内任何产品销售的分层版税。作为同步进行的2700万美元股权投资的一部分，百济神州将对Leap Therapeutics进行一项500万美元的股权投资。

Leap Therapeutics公司总裁兼首席执行官Christopher K. Mirabelli博士表示：“就进一步开发 DKN-01开展合作一直是我们的首要战略重点。我们很高兴开始与全球肿瘤领域的领导者百济神州的合作，百济神州是Leap Therapeutics的理想合作伙伴，他们在亚太地区的肿瘤药物开发方面拥有丰富的经验，他们的专业知识和丰富的产品将支持我们满足在食管胃、妇科和其他癌症方面远未被满足的医疗需求的努力。”

在选择权有效期内，Leap Therapeutics同意就DKN-01和替雷利珠单抗联合疗法开展研究。Leap Therapeutics计划在约40例二线DKK1高表达的胃腺/胃食管结合部癌患者中评估DKN-01和替雷利珠单抗联合疗法，以建立在此类患者中DKN-01联合PD-1抑制剂的积极临床经验。此外，Leap Therapeutics计划在约20例一线胃腺/胃食管结合部癌患者中评估DKN-01与替雷利珠单抗和化疗联合治疗的疗效。Leap Therapeutics预计将在2020年上半年启动这些临床试验。

股权融资

与百济神州签署授权协议同时，Leap Therapeutics已签订证券购买协议，以定向增发的形式，在股权融资生效后，以每股10.55美元的价格向一家主要机构投资者出售1,421,801股新指定的A系列强制性可转换优先股，向百济神州和Perceptive Advisors出售1,137,442股新指定的B系列强制性可转换优先股。优先股股价等同普通股每股1.055美元，即为Leap Therapeutics 2020年1月2日定价当日在纳斯达克全球股票市场的普通股收盘价。交易结束后，A系列强制性可转换优先股的持有者还将获得一份有投票权的特别优先股，这将使其有权选举Leap Therapeutics董事会的一名成员。经Leap Therapeutics股东批准，A系列强制性可转换优先股将自动转换为预支的认股权证，以购买14,218,010股普通股，B系列强制性可转换优先股将自动转换为11,374,420股普通股，另外额外股份代表每年8%的应计股息。在股东批准并转换优先股后，投资者还将收到认股权证，以每股2.11美元的行权价格购买至多同等数量的普通股。在扣除Leap Therapeutics应付的配售代理费用和预计的发行费用之前，Leap Therapeutics从本次发行中获得的总收益约为2700万美元，不包括任何行使认证股权的收益。在符合惯例成交条件的情况下，股权融资计划在2020年1月8日或之前生效。

Leap Therapeutics计划召开一次股东特别大会，以批准增加普通股的授权股数，将可转换优先股转换为普通股，发行认股权证等相关事宜。关于此次股东大会，Leap Therapeutics已与总共持有公司29.3%现有发行普通股的HealthCare Ventures附属实体签订了投票协议，以投票表决其所有收益股份，对股东特别大会上提出的方案投赞成票。

Raymond James公司是该项股权融资的配售代理。

定向增发的证券尚未根据经修订的《1933年证券法》或美国其他州的证券法进行登记，如果未在美国证券交易委员会（SEC）进行登记或者不符合适用的登记豁免例外情形，则不得在美国发行或出售。Leap Therapeutics已同意向美国证券交易委员会提交一份登记声明，内容包括转售由优先股转化的普通股股份以及行使定向增发的认股权证。

本新闻稿不构成出售或征集购买任何证券的要约，在任何州，若该等要约、邀请和出售根据该州的法律进行登记或取得资格之前是违法的，则不得在该州出售该等证券。

关于DKN-01

DKN-01是一种人源化单克隆抗体，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。

关于胃食管结合部/胃腺癌

胃食管结合部是食管和胃的连接处。根据其组织位置，胃食管结合部腺癌通常被与食管癌或胃癌归为一类。胃腺癌（胃癌）仍旧是最常见的致死癌症之一，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。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ⁱⁱ。

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，它是针对Wnt通路调节剂Dickkopf-1（DKK1）蛋白的人源化单克隆抗体。针对DKN-01，目前正在开展其用于治疗食管胃癌、肝胆癌、妇科癌症和前列腺癌的临床试验。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的、商业阶段的、以研发为基础的生物科技公司，专注于分子靶向和免疫肿瘤疗法的研发。百济神州目前在中国大陆、美国、澳大利亚和瑞士拥有3300多名员工，在研产品线包括新型口服小分子类和单克隆抗体类抗癌药物。百济神州目前也正在打造抗癌治疗的药物组合方案，旨在为癌症患者的生活带来持续、深远的影响。百济神州在美国销售其自主研发的BTK抑制剂BRUKINSA™（泽布替尼）；在中国，其抗PD1抗体药物百泽安®（替雷利珠单抗）已经获得上市批准。在新基物流有限责任公司（属于百时美施贵宝公司）的授权下，百济神州在华销售ABRAXANE®注射用紫杉醇（白蛋白结合型）、瑞复美®（来那度胺）和维达莎®（注射用阿扎胞苷）；在安进公司的授权下，百济神州计划在华销售安加维®（XGEVA®）地舒单抗注射液。^{iii,iv}

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。这些声明包括有关股权融资生效，在股东特别大会上获得股东批准，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。该等风险和不确定性包括但不限于：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，将包含在飞跃制药公司向美国证券交易委员会提交的定期文件中，包括Leap Therapeutics于2019年4月1日向美国证券交易委员会提交的截至2018年12月31日财年的年度报告10-K表格，以及飞跃制药公司的季度报告10-Q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

该新闻稿包含根据《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，包括有关与Leap Therapeutics协议相关的特定候选产品的未来开发和可能的商业化活动，潜在的向Leap Therapeutics的付款，以及其他并非历史信息的相关信息。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；以及百济神州在最近季度报告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期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该些信息。

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

¹ <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC6444111/>

ⁱⁱ <https://gco.iarc.fr/>

ⁱⁱⁱ ABRAXANE[®]为 Abraxis 有限责任公司（属于百时美施贵宝公司）注册商标；瑞复美[®]和维达莎[®]为新基医药公司（属于百时美施贵宝公司）的注册商标。

^{iv} 安加维[®]（XGEVA[®]）为安进公司的注册商标。