

香港交易及結算所有限公司及香港聯合交易所有限公司對本公告的內容概不負責，對其準確性或完整性亦不發表任何聲明，並明確表示，概不對因本公告全部或任何部分內容而產生或因倚賴該等內容而引致的任何損失承擔任何責任。

本公告所作出的前瞻性陳述僅與本文作出該陳述當日的事件或資料有關。除法律規定外，於作出前瞻性陳述當日之後，無論是否出現新資料、未來事件或其他情況，我們並無責任更新或公開修改任何前瞻性陳述及預料之外的事件。請細閱本公告，並理解我們的實際未來業績或表現可能與預期有重大差異。本公告中有關我們或任何董事及／或本公司的意向的陳述或提述乃於本公告刊發日期作出。任何該等意向均可能因未來發展而出現變動。



CStone Pharmaceuticals

基石藥業

(於開曼群島註冊成立的有限公司)

(股份代號: 2616)

自願公告

基石藥業核心產品CS5001 (ROR1 ADC) 的首次人體研究最新數據在2024年ASCO會議上發佈

基石藥業(「本公司」或「基石藥業」)欣然宣佈，本公司研發管綫2.0的重磅產品CS5001 (ROR1 ADC) 治療晚期實體瘤和淋巴瘤患者的1a/1b期全球多中心首次人體研究的數據在美國臨床腫瘤學會(ASCO)年會上以壁報形式公佈。

關鍵亮點

- 首次人體研究的最新數據顯示，CS5001在不同劑量水平、對於多綫經治的晚期實體瘤和淋巴瘤均能表現出良好的耐受性和令人鼓舞的抗腫瘤活性。
- CS5001是目前已知首個在實體瘤和淋巴瘤中均觀察到抗腫瘤活性的ROR1抗體偶聯藥物(ADC)。
- CS5001全球多中心I期試驗的劑量遞增目前仍在美國、澳大利亞和中國同步進行；近期將啟動在多瘤種中的劑量擴展研究；預計2024年內將啟動註冊臨床研究。
- 更多CS5001的最新臨床數據將在後續投資者會議或學術會議(如ESMO, ASH等)中定期公佈。

基石藥業首席執行官、研發總裁兼執行董事楊建新博士表示：“我們非常高興能在ASCO這一著名會議上公佈CS5001的首次人體研究數據。CS5001分子設計的獨特性已被其在臨床上所展現出的良好耐受性和安全性充分印證。雖然研究仍處於劑量探索階段，我們已經可以在多種惡性腫瘤中觀察到CS5001明顯的抗腫瘤活性，包括瀰漫大B細胞淋巴瘤(DLBCL)、霍奇金淋巴瘤、胰腺癌、非小細胞肺癌(NSCLC)、乳腺癌，卵巢癌等。值得強調的是，CS5001是目前已知首個針對實體瘤展現出臨床抗腫瘤活性的ROR1 ADC。令我們更為欣喜的是，隨著研究穩步推進，在ASCO壁報數據截止日之後，我們在血液瘤和實體瘤中持續收穫了更多CS5001抗腫瘤活性的臨床證據。這些更新的臨床數據將在後續的投資者會議或學術大會上公佈，我們也

期待進一步挖掘CS5001這款潛在同類最佳ROR1 ADC在廣泛瘤種中的開發潛力。”。

CS5001是一種新型ROR1導向的ADC，具有吡咯並苯二氮卓（PBD）前藥的獨特設計。首次人體研究旨在評估CS5001在晚期實體瘤和B細胞淋巴瘤患者中的安全性、藥代動力學（PK）特徵和抗腫瘤活性。

此次ASCO壁報中披露的CS5001的最新有效性和安全性數據如下：

- 截至壁報數據截止日，已完成1a期前九個劑量水平（7至156 $\mu\text{g}/\text{kg}$ ）的劑量限制性毒性（DLT）的評估；未觀察到DLT，且未達到最大耐受劑量（MTD）。
- 已觀察到的藥物相關不良事件大多為1級或2級（評價標準NCI-CTCAE v5.0），表明CS5001針對多線經治的晚期實體瘤和淋巴瘤患者均能表現出良好的耐受性和安全性。
- 藥代動力學數據表明CS5001的暴露量與劑量成正比，且ADC和總抗體的暴露量相似，表明CS5001 ADC在血液循環中具有出色的穩定性。
- 已在多種實體瘤（評價標準RECIST v1.1）和血液腫瘤（評價標準Lugano 2014）中觀察到CS5001令人鼓舞的抗腫瘤活性：
 - 霍奇金淋巴瘤：從第5劑量水平（50 $\mu\text{g}/\text{kg}$ ）起觀察到客觀緩解；第5-9劑量水平的9例可評估的患者中有1例達到完全緩解（CR）以及4例達到部分緩解（PR），客觀緩解率（ORR）為55.6%。
 - 彌漫大B細胞淋巴瘤（DLBCL）：從第7劑量水平（100 $\mu\text{g}/\text{kg}$ ）起觀察到客觀緩解；第7-9劑量水平的6例可評估的患者中有1例達到CR以及2例達到PR，ORR為50.0%。
 - 在實體瘤中，從第7劑量水平（100 $\mu\text{g}/\text{kg}$ ）起也開始觀察到多例PR和疾病穩定（SD）伴腫瘤負荷減小，包括非小細胞肺癌（NSCLC；1例PR及3例SD），胰腺癌（1例PR），三陰性乳腺癌（TNBC；1例SD），卵巢癌（1例SD）；基於以上療效趨勢，隨著劑量的增加，預計在實體瘤患者中有望觀察到更好的療效。

目前，該研究1a期劑量遞增仍在進行中；同步將在特定較高劑量組入組更多患者、累積更多數據，用以初步確定II期推薦劑量（RP2D）和評估ROR1表達與療效之間的關係。同時我們也將於近期啟動涵蓋多瘤種的1b期劑量擴展研究進行劑量優化；預期將在2024年年底前啟動註冊性臨床研究。

關於CS5001（ROR1 ADC）

CS5001是一款以受體酪氨酸激酶樣孤兒受體1（receptor tyrosine kinase-like orphan receptor 1, ROR1）為靶點臨床階段的抗體偶聯藥物（ADC）。CS5001具有獨特的設計，使用腫瘤特異激活的吡咯並苯二氮卓（pyrrolobenzodiazepine, PBD）前毒素載荷（Payload）和連接子(linker)。CS5001只在到達腫瘤後，被腫瘤細胞內吞後，在溶酶體中其連接子被在腫瘤細胞中高表達的特異性酶切割釋放PBD前毒素，繼而PBD前毒素在腫瘤細胞內被激活，從而殺死腫瘤細胞。這種連接子加前毒素的“雙控”機制有效地減少與傳統PBD載荷有關的毒性問題，而獲得更大的安全窗口。CS5001已在幾種臨床前癌症模型中證明具有完全的腫瘤抑制作用，並展示出良好的血清半衰期及藥代動力學特徵，在多種實體瘤和血液瘤中擁有巨大的臨床開發潛力和廣泛的應用。此外，CS5001利用定向偶聯技術獲得精準的藥物抗體比率，便於實現均質生產及大規模生產。

2020年10月，基石藥業與LigaChem Biosciences, Inc.（LCB）就CS5001的開發和商業化達成授權協議。CS5001最初是由韓國領先的生物科技公司LCB和ABL Bio共同合成。根據協議條款，基石藥業獲得CS5001在韓國以外的全球其他地區的獨家開發和商業化權利。

關於基石藥業

基石藥業（香港聯交所代碼：2616）成立於2015年底，是一家專注于抗腫瘤藥物研發的創新啟動型生物醫藥企業，致力於滿足中國和全球癌症患者的殷切醫療需求。截至目前，公司已成功上市4款創新藥、獲批14項新藥上市申請（NDA）以及9項適應症。當前研發管綫均衡配置了潛在同類首創或同類最佳的抗體偶聯藥物（ADC）、多特異性抗體、以及免疫療法和精準治療藥物在內的12款候選藥物。同時，基石藥業擁有一支自身管理團隊，“全鏈條”覆蓋臨床前探索、臨床轉化、臨床開發、藥物生產、商務拓展、商業運營等關鍵環節。

如需瞭解有關基石藥業的更多資訊，請訪問：www.cstonepharma.com。

「上市規則」第18A.05條規定的警示聲明：本公司未必能夠成功地研發及推廣CS5001。本公司股東及潛在投資者於買賣本公司股份時，務請審慎行事。

前瞻性陳述

概不保證本公告所載關於本集團業務發展之任何前瞻性聲明，或任何事宜將可達成、將真實發生或將實現或屬完整或準確。本公告所披露有關本集團財務及其他方面的數據亦未經其核數師審核或審閱。本公司股東及／或有意投資者於買賣本公司證券時務請審慎行事，不應過分依賴本公告所披露的資料。如有疑問，股東或有意投資者應諮詢專業顧問的意見。

承董事會命
基石藥業
李偉博士
主席

中華人民共和國，蘇州，2024年06月04日

於本公告刊發日期，本公司董事會包括主席兼非執行董事李偉博士、執行董事楊建新博士、非執行董事Kenneth Walton Hitchner III先生、林向紅先生及胡正國先生以及獨立非執行董事Paul Herbert Chew博士、胡定旭先生及孫洪斌先生。