

## 開拓藥業新型 C-Myc/GSPT1 雙靶點降解劑 GT19715 最新數據以口頭報告亮相 ASH 2022

北京時間 2022 年 11 月 10 日，開拓藥業（股票代碼：9939.HK），一家專注於潛在同類首創和同類最佳創新藥物研發及產業化的生物製藥公司，宣佈其自主研發的新型 C-Myc/GSPT1 雙靶點降解劑 GT19715 的最新研究結果已獲選 2022 年美國血液學會年會（American Society of Hematology, ASH 2022）的口頭報告，相關摘要可在 ASH 官網上查閱。

美國血液學會年會是全球血液學領域最大的國際盛會，每年吸引彙集了血液學的基礎、轉化和臨床研究人員。ASH 2022 將於 2022 年 12 月 10 日（週六）至 12 月 13 日（週二）在美國路易斯安那州新奧爾良舉行。

在 70% 的人類癌症中存在癌蛋白 Myc 失調，主要表現為表達水準增加和活性增強，以促進癌症（包括白血病和淋巴瘤）的進展。MYC 基因重排在 Burkitt 淋巴瘤（BL）中的易位最為常見（100%）。在急性髓系白血病（AML）中也觀察到 MYC 的高表達，包括帶有 TP53 突變或 venetoclax（ven）耐藥的 AML 患者。儘管最近 AML 的治療手段取得了很大的進展，這兩種 AML 患者都有非常差的臨床預後。

開拓藥業聯合美國德克薩斯大學 MD 安德森癌症中心白血病學教授 Michael Andreeff 團隊，研究了同類首創的新型 C-Myc/GSPT1 雙靶點降解劑 GT19715 在耐藥 AML 模型中的臨床前活性。

研究人員利用單細胞質譜流式技術，發現與正常骨髓 CD34+ 細胞相比，低分化的 CD34+ AML 細胞中的 c-Myc 蛋白水準增加。GT19715 在具有 TP53 突變的 AML 細胞中，特別是在低分化的 CD34+ 細胞中，顯示出很好的抗白血病效果；以及在 Daudi Burkitt 淋巴瘤和 venetoclax 耐藥 AML 模型小鼠中，GT19715 治療消除了淋巴瘤和白血病細胞。該研究結果將由 Michael Andreeff 團隊的 Yuki Nishida 博士於 2022 年 12 月 10 日進行口頭報告。

開拓藥業創始人、董事長兼首席執行官童友之博士表示，“我們非常高興新型 c-Myc/GSPT1 雙靶點降解劑 GT19715 的最新研究結果被選為今年 ASH 年會的口頭報告，這表明國際血液學界對 GT19715 治療潛力的認可。我們將加快推動 GT19715 進入臨床階段的進程，希望為未滿足需求的患者帶來更多創新的治療選擇。”

Andreeff 博士表示，“我們非常高興在今年 ASH 年會上展示 GT19715 的臨床前活性數據，特別是在 MYC 驅動的白血病和淋巴瘤中。MYC 控制著各種癌症起始和進展的致癌程式，儘管有許多針對 MYC 或其通路的嘗試，長期以來其一直是癌症治療中“不可成藥”的靶點之一。我們去年在 ASH 年會中報告了 p53 重新啟動對 MYC 的抑制作用，但現在有了第一個成功降解 MYC 本身的化合物，顯示出非常有潛力的早期活性，應該也適用於其他 MYC 驅動的惡性腫瘤。”

口頭報告

**摘要標題: C-MYC Targeting By Degradation: Novel Dual c-Myc/GSPT1 Degradator GT19715 Induces TP53-Independent Cell Death in Acute Myeloid Leukemia and Lymphomas**

降解靶向 C-MYC: 新型 C-MYC/GSPT1 雙靶點降解劑 GT19715 誘導急性髓系白血病和淋巴瘤中 TP53 非依賴性細胞死亡

摘要編號: 199

分會場: 604, Molecular Pharmacology and Drug Resistance: Myeloid Neoplasms: Targeted Protein Degradation and Emerging Small

Molecule Inhibitors in Myeloid Neoplasms 分子藥理學和耐藥性: 髓系腫瘤: 靶向蛋白降解和髓系腫瘤中新出現的小分子抑制劑

報告形式: 口頭報告

報告時間: 美國東部時間 2022 年 12 月 10 日下午 2 點

摘要鏈接: <https://ash.confex.com/ash/2022/webprogram/Paper164968.html>

## 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/TGF β 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，多個項目被列為國家十二五、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板掛牌上市，股票代碼：9939.HK。歡迎訪問公司網站：[www.kintor.com.cn](http://www.kintor.com.cn)