

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局

(43) 国际公布日
2023 年 8 月 3 日 (03.08.2023)



(10) 国际公布号
WO 2023/143365 A1

(51) 国际专利分类号:

A61K 47/68 (2017.01) *A61K 47/65* (2017.01)
C07K 16/28 (2006.01) *A61K 35/00* (2006.01)
A61K 31/4745 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2023/073130

(22) 国际申请日: 2023 年 1 月 19 日 (19.01.2023)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202210107800.8 2022 年 1 月 28 日 (28.01.2022) CN
202310015113.8 2023 年 1 月 5 日 (05.01.2023) CN

(71) 申请人: 映恩生物制药(苏州)有限公司
(**DUALITY BIOLOGICS (SUZHOU) CO., LTD.**) [CN/
CN]; 中国上海市浦东新区樱花路 868 号
1106 室, Shanghai 201204 (CN)。

(72) 发明人: 朱忠远(**ZHU, Zhongyuan**); 中国上海市
浦东新区樱花路 868 号 1106 室, Shanghai 201204
(CN)。 张禹(**ZHANG, Yu**); 中国上海市浦东新
区樱花路 868 号 1106 室, Shanghai 201204 (CN)。
李曦(**LI, Xi**); 中国上海市浦东新区樱花路 868
号 1106 室, Shanghai 201204 (CN)。

(74) 代理人: 北京市中咨律师事务所(**ZHONGZI LAW
OFFICE**); 中国北京市西城区平安里西大街 26
号新时代大厦 7 层, Beijing 100034 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家
保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,
BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU,
CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ,
IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ,
LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN,
MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE,
PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW。

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区
保护): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW,
MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚
(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR,
HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO,
PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF,
CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN,
TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第 21 条 (3))。

(54) **Title:** HER3 ANTIBODY-DRUG CONJUGATE AND USE THEREOF

(54) 发明名称: Her3 抗体药物偶联物及其用途

(57) **Abstract:** Disclosed is an anti-Her3 antibody-drug conjugate, having a structure of Ab-(L-M-D)_p represented by formula (I), wherein L and M are linker units, D is a cytotoxic drug, P represents an average linking number, and Ab is an anti-Her3 antibody or an antigen-binding fragment thereof, comprising a heavy chain variable region and a light chain variable region. The heavy chain variable region comprises HCDR1, HCDR2, and HCDR3 having amino acid sequences as shown in SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, and SEQ ID NO: 3, respectively, and the light chain variable region comprises LCDR1, LCDR2, and LCDR3 having amino acid sequences as shown in SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 5, and SEQ ID NO: 6, respectively. Further disclosed is a pharmaceutical composition, comprising the anti-Her3 antibody-drug conjugate represented by formula (I) or an isomer, pharmaceutically acceptable salt or mixture thereof, and a pharmaceutically acceptable carrier or excipient. The described antibody-drug conjugate or composition can be used for preparing a drug for treating and/or preventing a Her3-mediated disease or condition.

(57) 摘要: 一种抗 Her3 抗体药物偶联物具有 Ab-(L-M-D)_p (I) 结构, 其中, L 和 M 是接头单元, D 是细胞毒性药物, P 表示平均连接数, Ab 为抗 Her3 抗体或其抗原结合片段, 其包含重链可变区和轻链可变区, 所述重链可变区包含氨基酸序列分别如 SEQ ID NO:1、SEQ ID NO:2 和 SEQ ID NO:3 所示的 HCDR1、HCDR2 和 HCDR3, 所述轻链可变区包含氨基酸序列分别如 SEQ ID NO:4、SEQ ID NO:5 和 SEQ ID NO:6 所示的 LCDR1、LCDR2 和 LCDR3。一种药物组合物, 包含式 (I) 结构抗 Her3 抗体药物偶联物、其异构体、其药学上可接受的盐或其混合物, 和药学上可接受的载体或赋形剂。上述抗体药物偶联物或组合物可用于制备治疗和/或预防 Her3 介导的疾病或病症的药物。

WO 2023/143365 A1