(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 5 月 11 日 (11.05.2023)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2023/078230 A1

(51) 国际专利分类号:
A61K 47/64 (2017.01) *A61K 38/06* (2006.01)
A61K 47/68 (2017.01) *A61P 35/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/128912

(22) 国际申请日: 2022 年 11 月 1 日 (01.11.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202111285580.X 2021年11月2日 (02.11.2021) CN

(71) 申请人: 烟台迈百瑞国际生物医药股份有限公司 (MABPLEX INTERNATIONAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国山东省烟台市中国（山东）自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路60号, Shandong 264006 (CN)。

(72) 发明人: 黄长江 (HUANG, Changjiang); 中国山东省烟台市中国（山东）自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路60号, Shandong 264006 (CN)。 熊就凯 (XIONG, Jiukai); 中国山东省烟台市中国（山东）自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路60号, Shandong 264006 (CN)。 闫新新 (YAN, Xinxin); 中国山东省烟台市中国（山东）自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路60号, Shandong 264006 (CN)。 于红霞 (YU, Hongxia); 中国山东省烟台市中国（山东）自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路60号, Shandong 264006 (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,

(54) **Title:** ANTIBODY-DRUG CONJUGATE INTERMEDIATE COMPRISING SN38 AND PREPARATION METHOD THEREFOR

(54) 发明名称: 一种包含SN38的抗体药物偶联物中间体及其制备方法

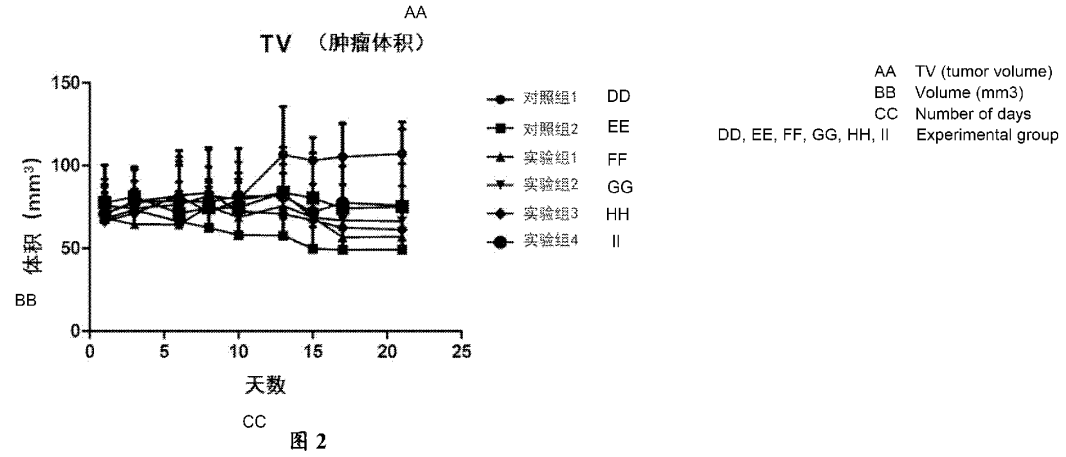

图 2

(57) **Abstract:** An antibody-drug conjugate intermediate comprising SN38 and a preparation method therefor. A water-soluble group PEG having biological activity is introduced into a linker structure, and structural modification is carried out on the PEG. The preparation method has simple steps and is cost-saving. The present invention is more environmentally friendly as no heavy metal ions are introduced into a reaction; moreover, compared to antibody-drug conjugate intermediates in which SN38 is a toxin in the existing technology, using the antibody-drug conjugate intermediate synthesized by said preparation method provides higher stability and efficacy.

(57) 摘要: 一种包含SN38的抗体药物偶联物中间体及其制备方法，在其连接子结构上引入具有生物活性的水溶性基团PEG并在PEG上进行结构修饰，该制备方法步骤简单，节约成本，在反应中不会引入重金属离子，具有更高的环境友好性，并且采用该制备方法合成的抗体药物偶联物中间体与现有技术中毒物为SN38的抗体药物偶联物中间体相比具有更高的稳定性和药效。

[见续页]

WO 2023/078230 A1

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)。

根据细则4.17的声明：

— 发明人资格(细则4.17(iv))

本国际公布：

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。