

(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
2022 年 2 月 17 日 (17.02.2022)



(10) 国际公布号
WO 2022/033578 A1

- (51) 国际专利分类号:
A61K 47/68 (2017.01) *C07K 16/32* (2006.01)
A61K 47/54 (2017.01) *A61P 35/00* (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2021/112462
- (22) 国际申请日: 2021 年 8 月 13 日 (13.08.2021)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
202010814877.X 2020 年 8 月 13 日 (13.08.2020) CN
- (71) 申请人: 正大天晴药业集团股份有限公司 (CHIA TAI TIANQING PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省连云港市郁州南路 369 号, Jiangsu 222062 (CN)。正大天晴药业集团南京顺欣制药有限公司 (NANJING SHUNXIN PHARMACEUTICALS CO., LTD. OF CHIATAI TIANQING PHARMACEUTICAL GROUP) [CN/CN]; 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。
- (72) 发明人: 张喜全 (ZHANG, Xiquan); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。陈天玺 (CHEN, Tianxi); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。丰巍伟 (FENG,

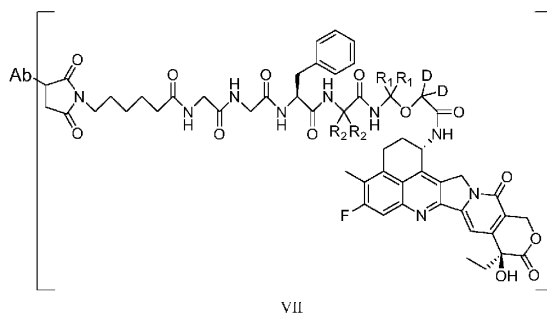
Weiwei); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。张兵 (ZHANG, Bing); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。唐小齐 (TANG, Xiaoqi); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。徐同杰 (XU, Tongjie); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。王晓金 (WANG, Xiaojin); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。盛化策 (SHENG, Huace); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。张正平 (ZHANG, Zhengping); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。王华 (WANG, Hua); 中国江苏省连云港市郁州南路 369 号, Jiangsu 222062 (CN)。高勇 (GAO, Yong); 中国江苏省南京市江宁区福英路 1099 号 (江宁高新园), Jiangsu 211100 (CN)。

(74) 代理人: 北京信慧永光知识产权代理有限公司 (BEIJING SUNHOPE INTELLECTUAL PROPERTY LTD.); 中国北京市海淀区知春路 9 号坤讯大厦 1106 室, Beijing 100191 (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,

(54) Title: ANTIBODY DRUG CONJUGATE

(54) 发明名称: 抗体药物偶联物



(57) Abstract: Provided is an antibody drug conjugate, specifically comprising a therapeutic antibody moiety, an intermediate linker moiety and a cytotoxic drug moiety which are linked. The therapeutic antibody moiety is an antibody against a HER2 target. The cytotoxic drug moiety is a camptothecin topoisomerase I inhibitor. The cytotoxic drug moiety or the linker-cytotoxic drug moiety is modified by means of deuterium substitution. The antibody drug conjugate can be used for the prevention or treatment of cancers.

(57) 摘要: 提供了一种抗体药物偶联物, 具体包含相连接的治疗性抗体部分、中间接头部分和细胞毒药物部分, 其中, 治疗性抗体部分为针对 HER2 靶点的抗体, 细胞毒药物部分为喜树碱类拓扑异构酶 I 抑制剂, 对于细胞毒药物部分或者接头-细胞毒药物部分进行了氘取代的修饰。所述抗体药物偶联物可以用于癌症的预防或治疗。

[见续页]

CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, 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, 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, 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:

- 关于申请人有权要求在先申请的优先权(细则4.17(iii))

本国际公布:

- 包括国际检索报告(条约第21条(3))。
- 包括说明书序列表部分(细则5.2(a))。