

(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
2025 年 4 月 3 日 (03.04.2025)



(10) 国际公布号
WO 2025/067221 A1

(51) 国际专利分类号:
C07K 5/02 (2006.01) **A61K 47/68** (2017.01)
C07K 7/02 (2006.01) **A61P 35/00** (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/121050

(22) 国际申请日: 2024 年 9 月 25 日 (25.09.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202311256590.X 2023年9月26日 (26.09.2023) CN
202410109076.1 2024年1月25日 (25.01.2024) CN
202410806735.7 2024年6月20日 (20.06.2024) CN
202411124033.7 2024年8月15日 (15.08.2024) CN
202411296153.5 2024年9月14日 (14.09.2024) CN

(71) 申请人: 上海齐鲁制药研究中心有限公司 (SHANGHAI QILU PHARMACEUTICAL RESEARCH AND DEVELOPMENT CENTRE LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。

(72) 发明人: 王军飞(WANG, Junfei); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。黄颖(HUANG, Ying); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。闭潇扬(BI, Xiaoyang); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。崔昌义(CUI, Changyi); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。秦文武(QIN, Wenwu); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。韩凤莹(HAN, Fengying); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。李梦佳(LI, Mengjia); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。黄文淑(HUANG, Wenshu); 中国

上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。马翠翠(MA, Cuicui); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。马丽娜(MA, Lina); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。张美娟(ZHANG, Meijuan); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。陈冬(CHEN, Dong); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。王新美(WANG, Xinmei); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。艾现伟(AI, Xianwei); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。杨阳(YANG, Yang); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。孙大庆(SUN, Daqing); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。陶维康(TAO, Weikang); 中国上海市浦东新区中国(上海)自由贸易试验区法拉第路56号, 李冰路576号3幢 201203 (CN)。

(74) 代理人: 北京信诺创成知识产权代理有限公司 (SINO-CREATIVITY INTELLECTUAL PROPERTY LAW FIRM); 中国北京市朝阳区光华路9号4号楼天阶大厦24层23A03室 100020 (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, MU, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD,

(54) Title: AURISTATIN DERIVATIVE AND ANTIBODY-DRUG CONJUGATE THEREOF

(54) 发明名称: 奥瑞他汀衍生物及其抗体药物偶联物

(57) Abstract: The present invention relates to a cytotoxic compound and an antibody-drug conjugate thereof, and relates in particular to an auristatin derivative, a preparation method for an antibody-drug conjugate thereof, and a use.

(57) 摘要: 一种细胞毒化合物及其抗体药物偶联物, 具体涉及奥瑞他汀衍生物及其抗体药物偶联物的制备方法和用途。

[续页]

WO 2025/067221 A1

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, SC, 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))。
- 包括说明书序列表部分(细则5.2(a))。