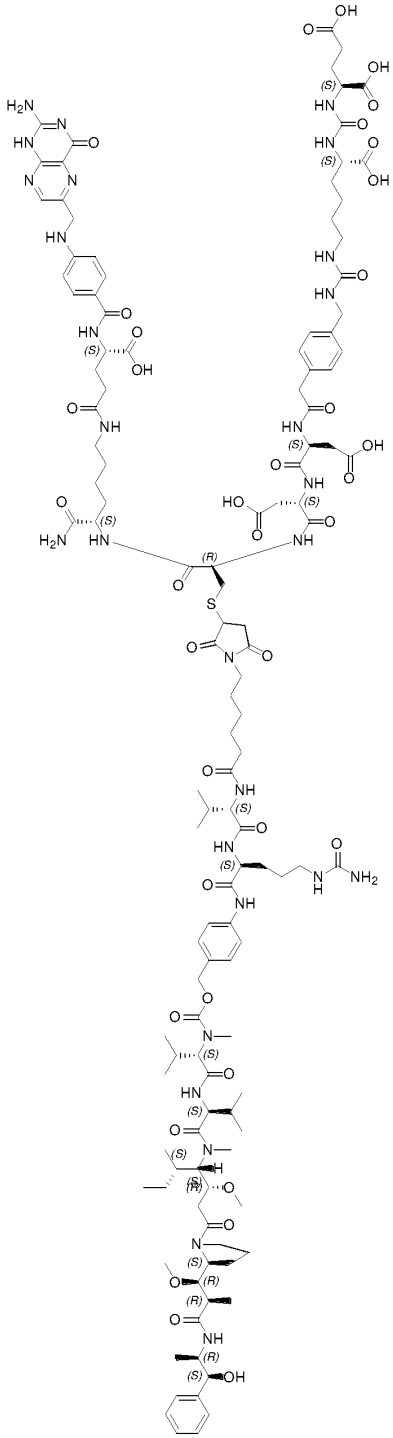
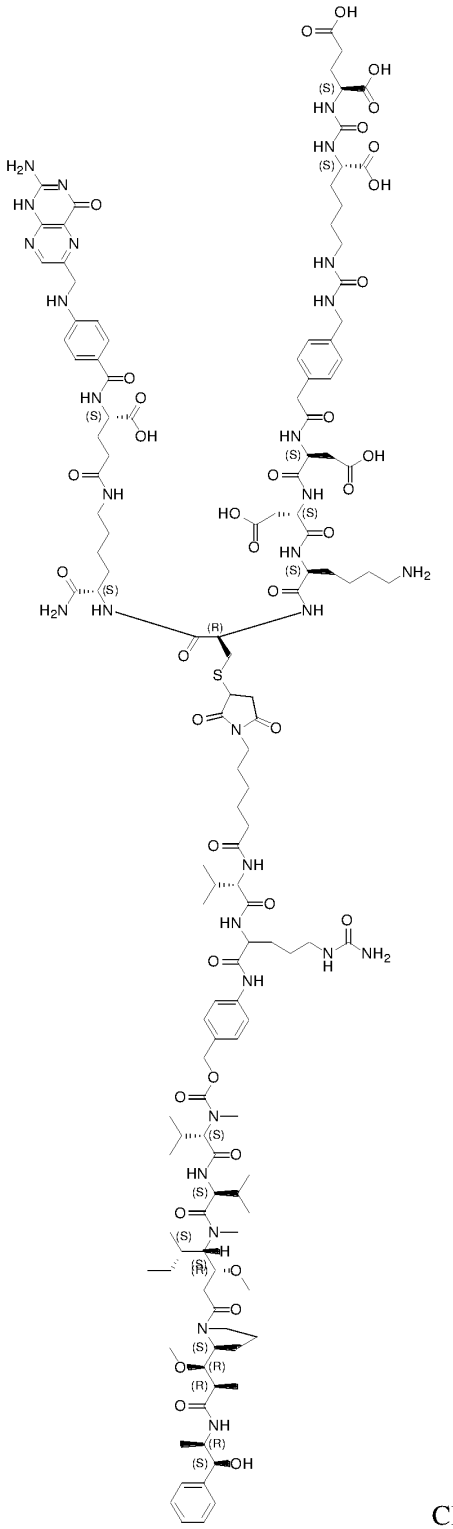


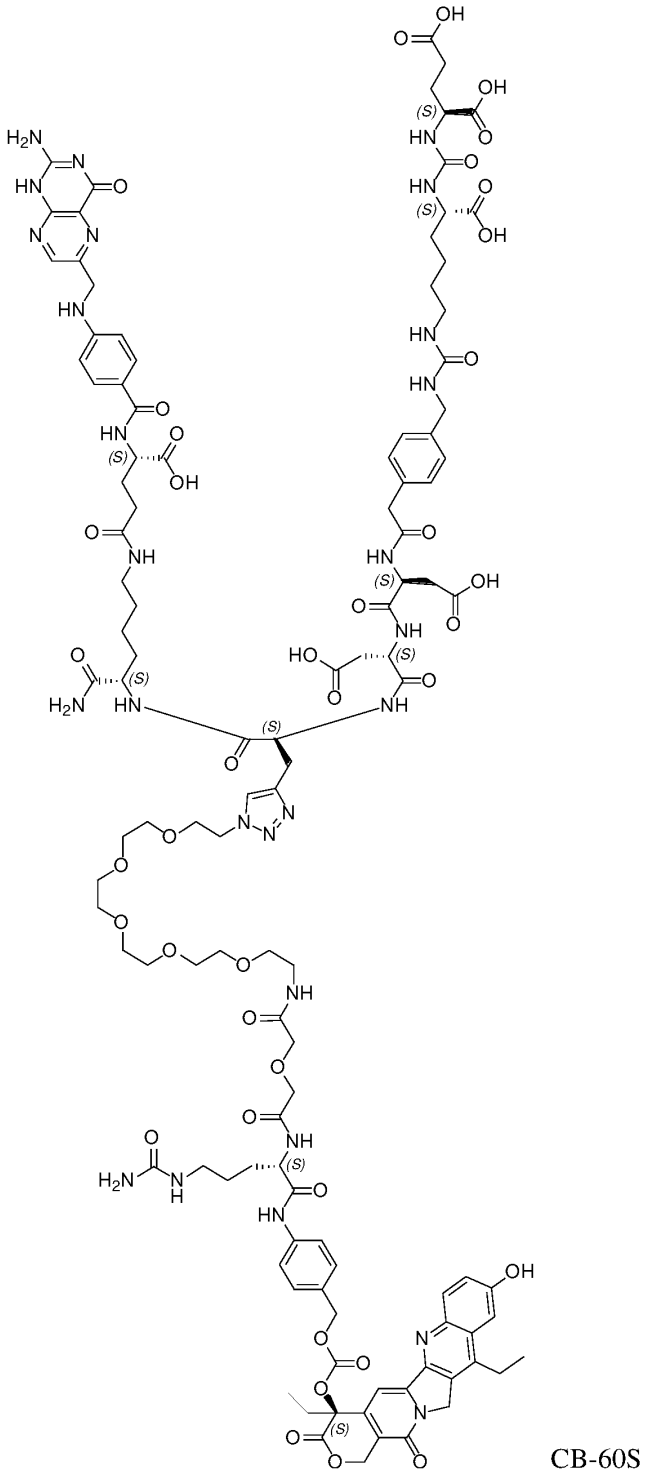
CB-20B

图 1



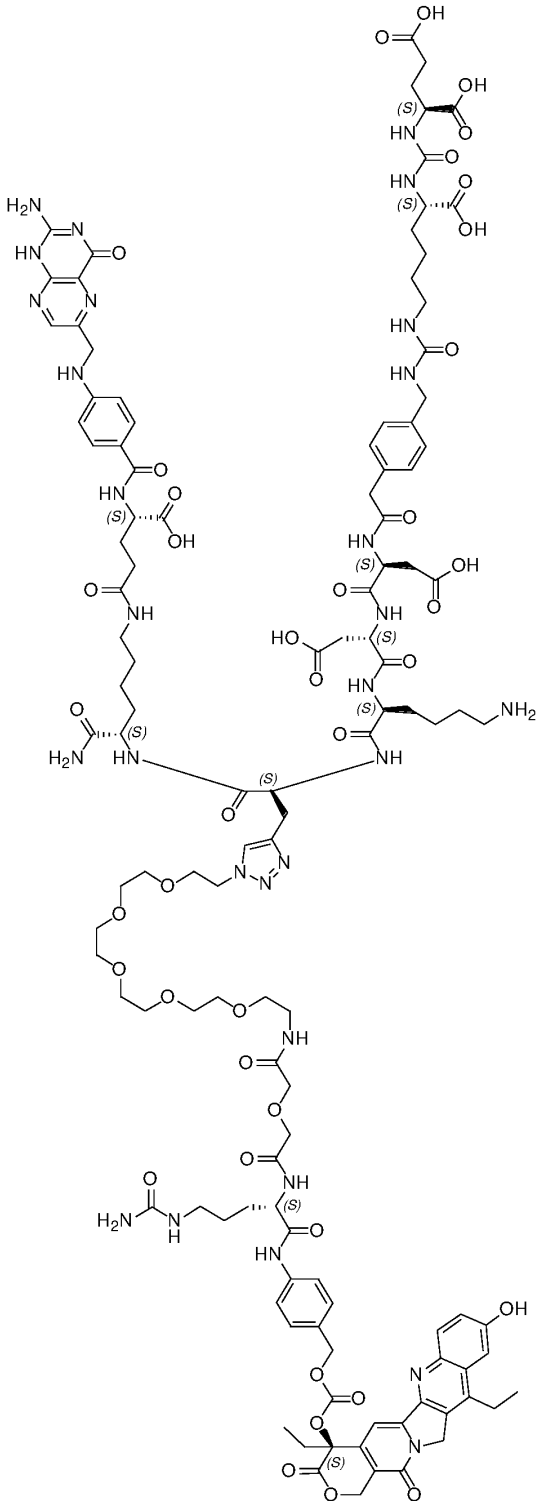
CB-20BK

图 1（续）



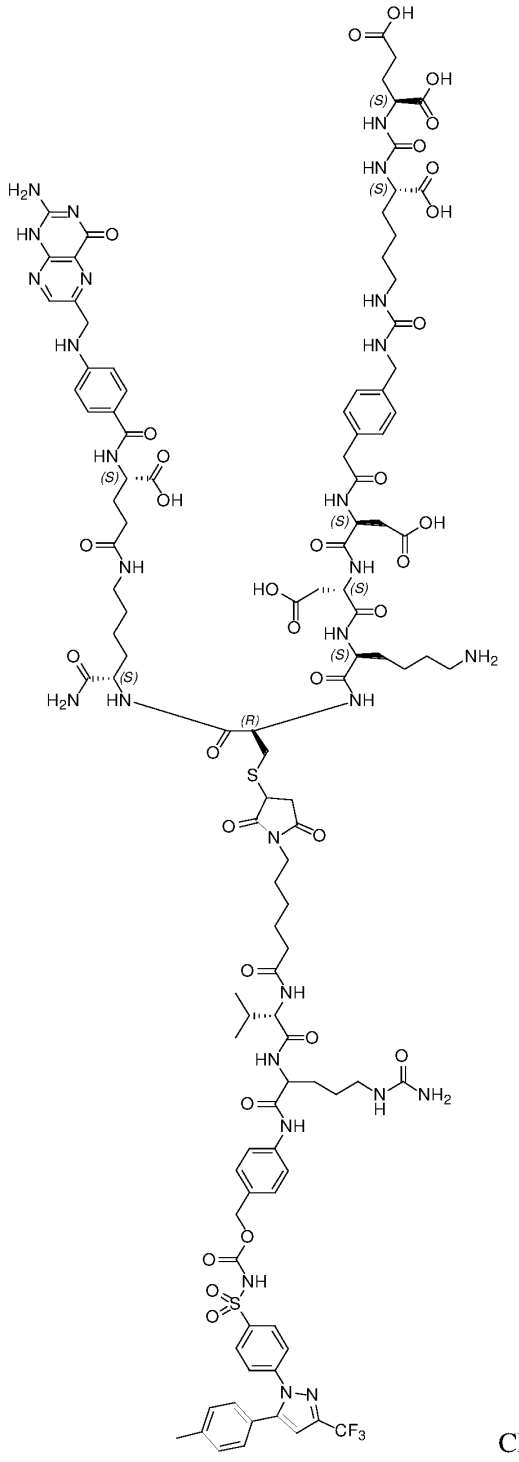
CB-60S

图 1（续）



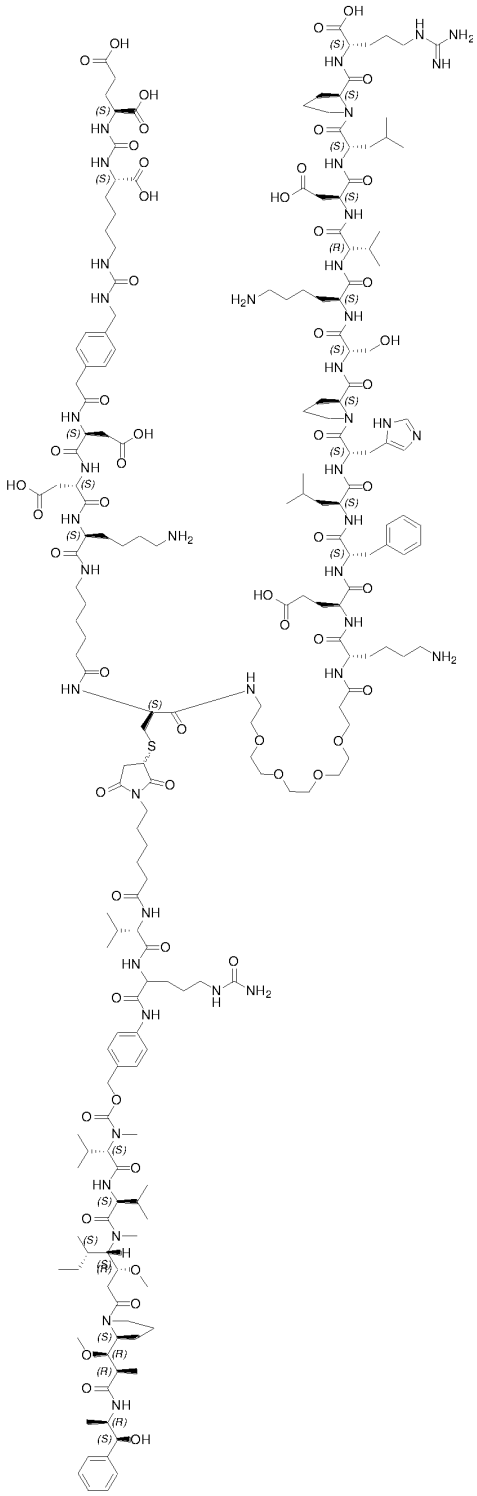
CB-60SK

图 1（续）



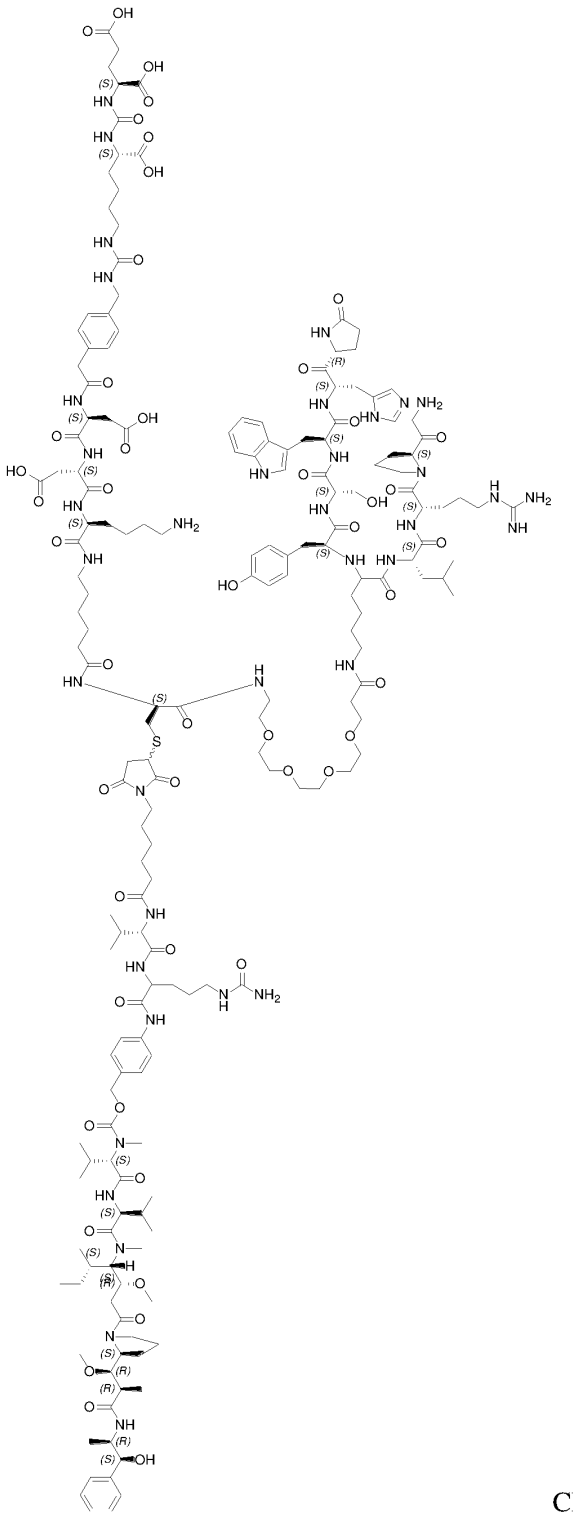
CB-20C

图 1（续）



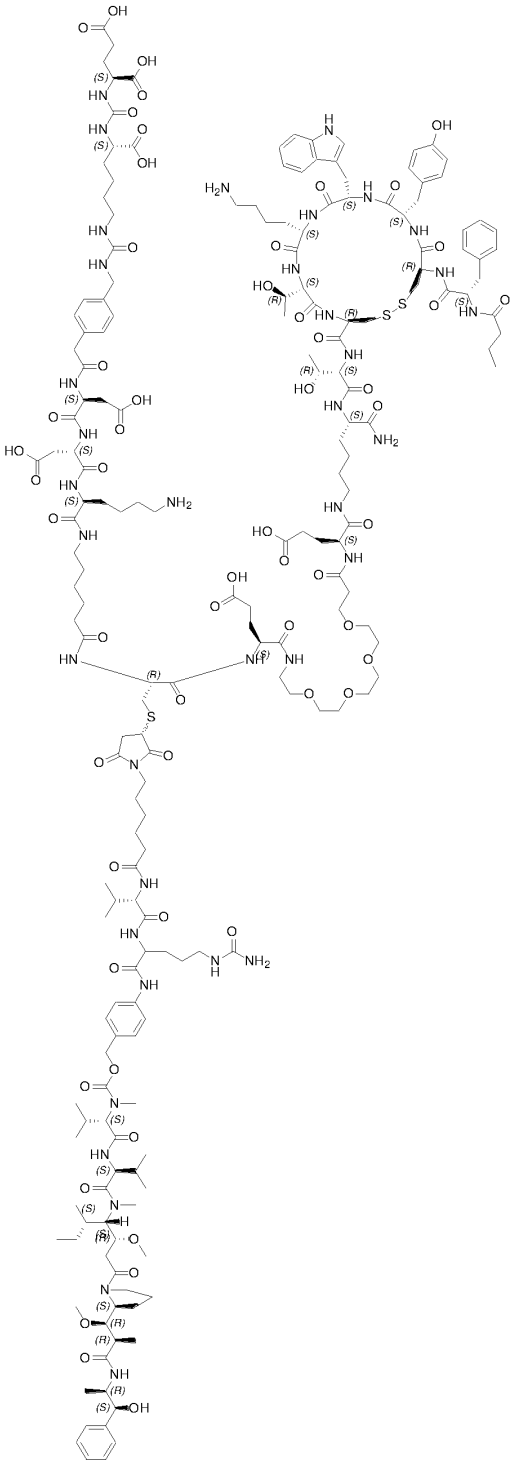
CB-1020

图 1（续）



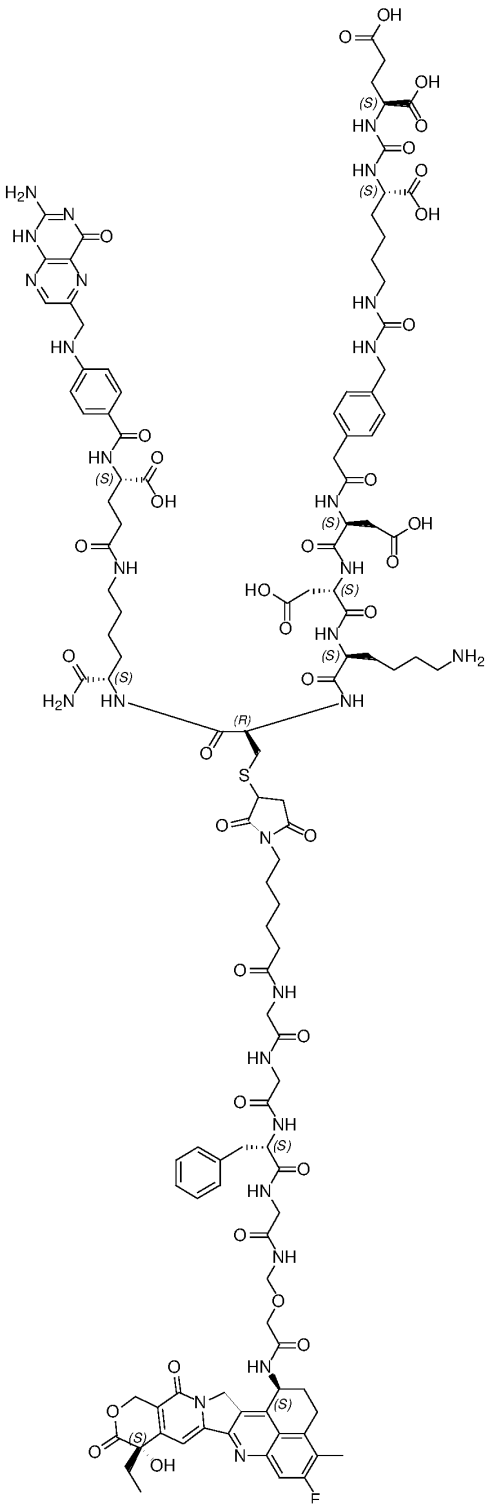
CB-1320

图 1（续）



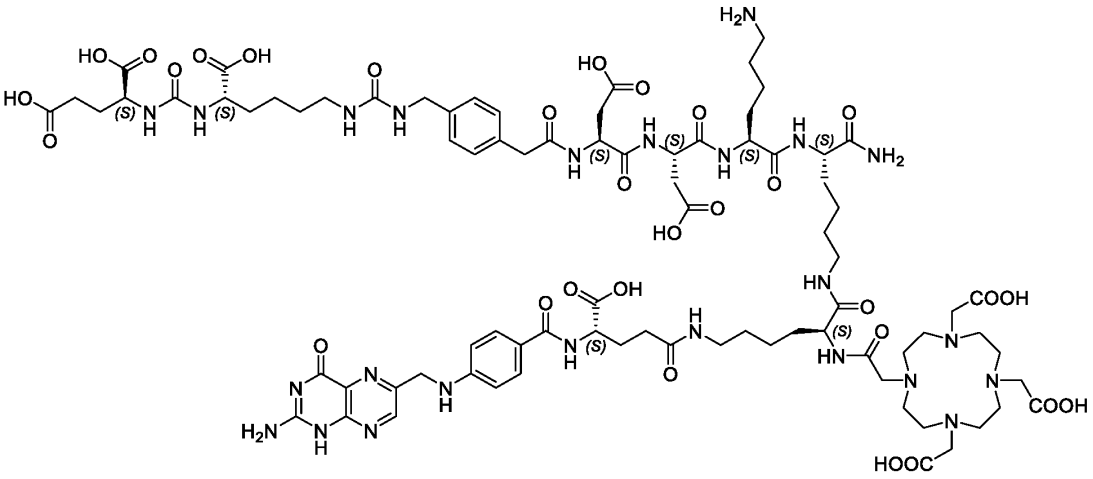
CB-1820

图 1（续）

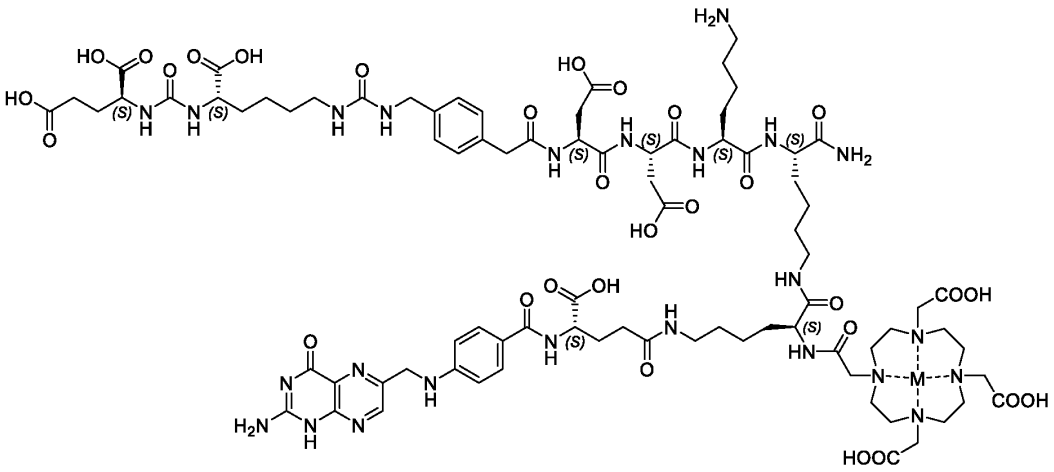


CR19428

图 1（续）

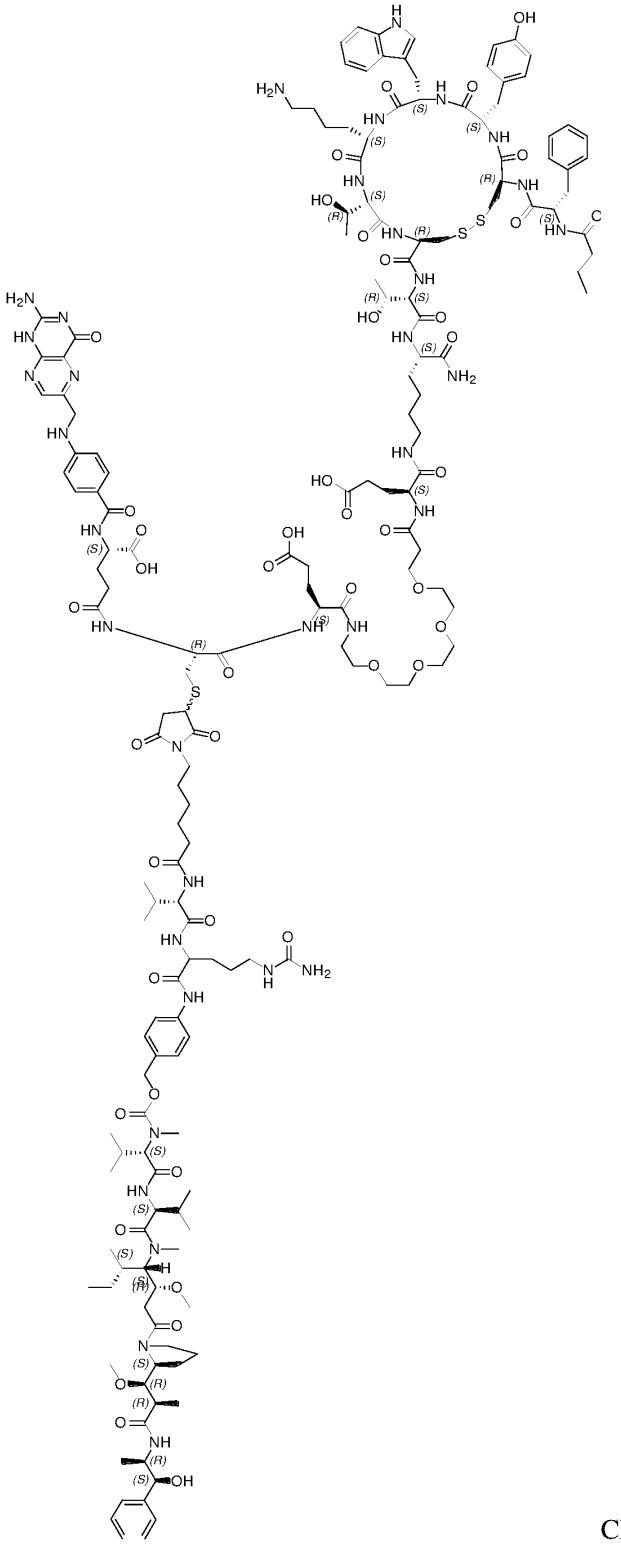


20R-SM09



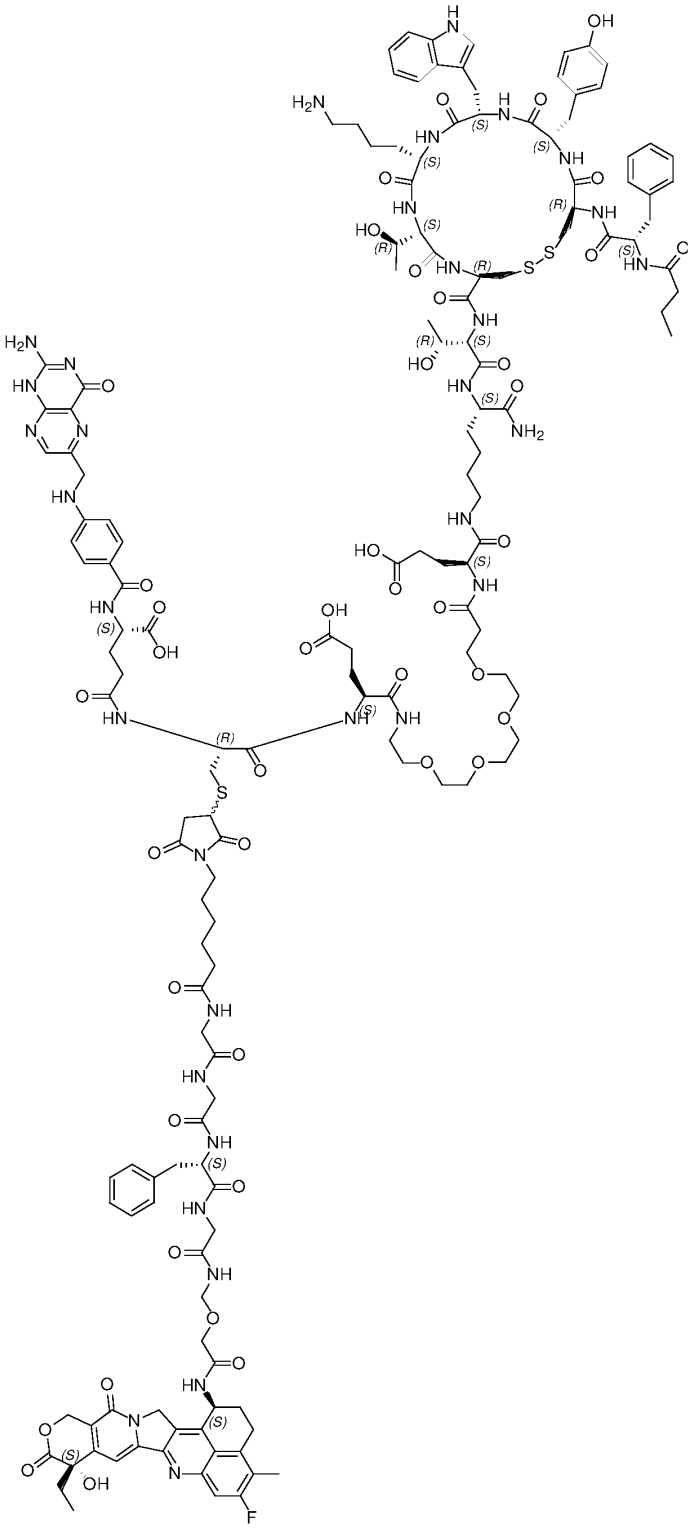
CB-20R

图 1（续）



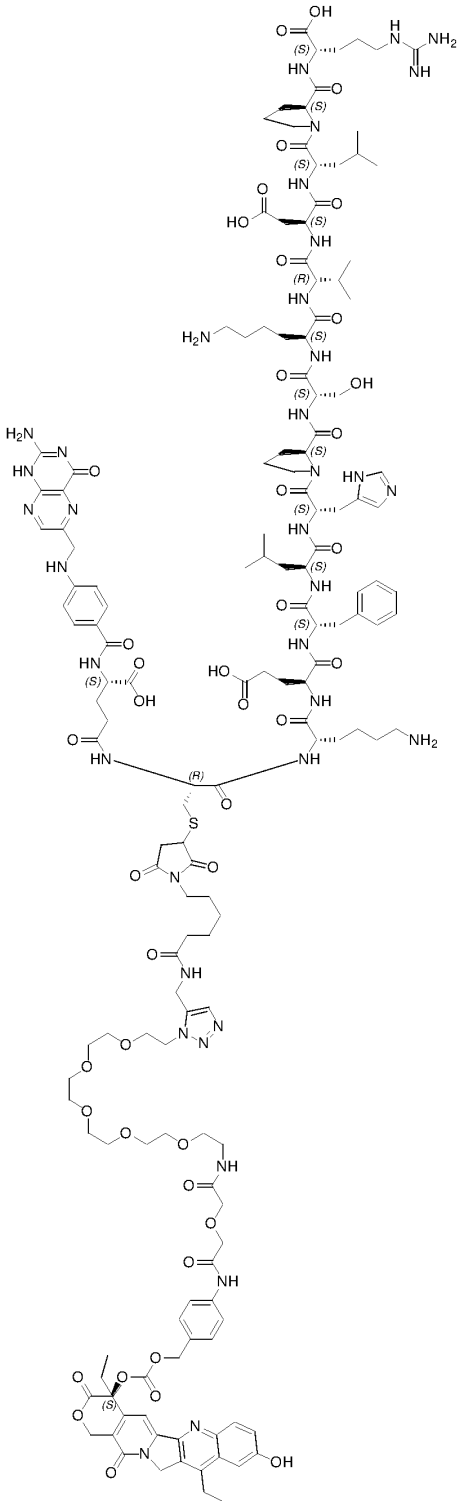
CB-18G

图 1（续）



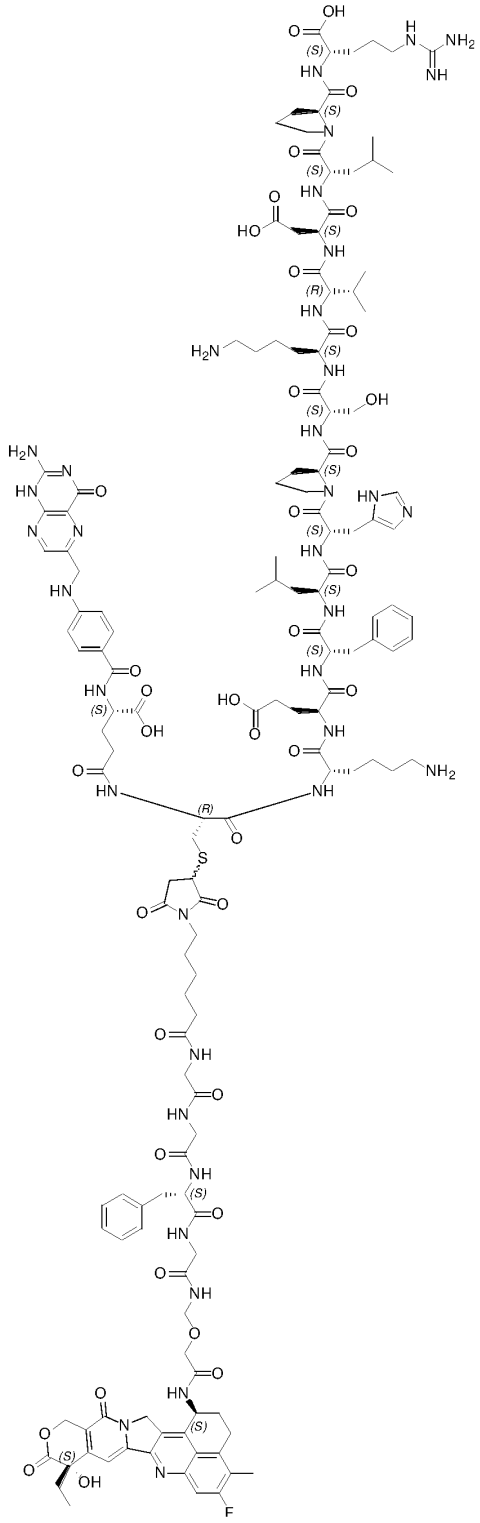
CR19426

图 1（续）



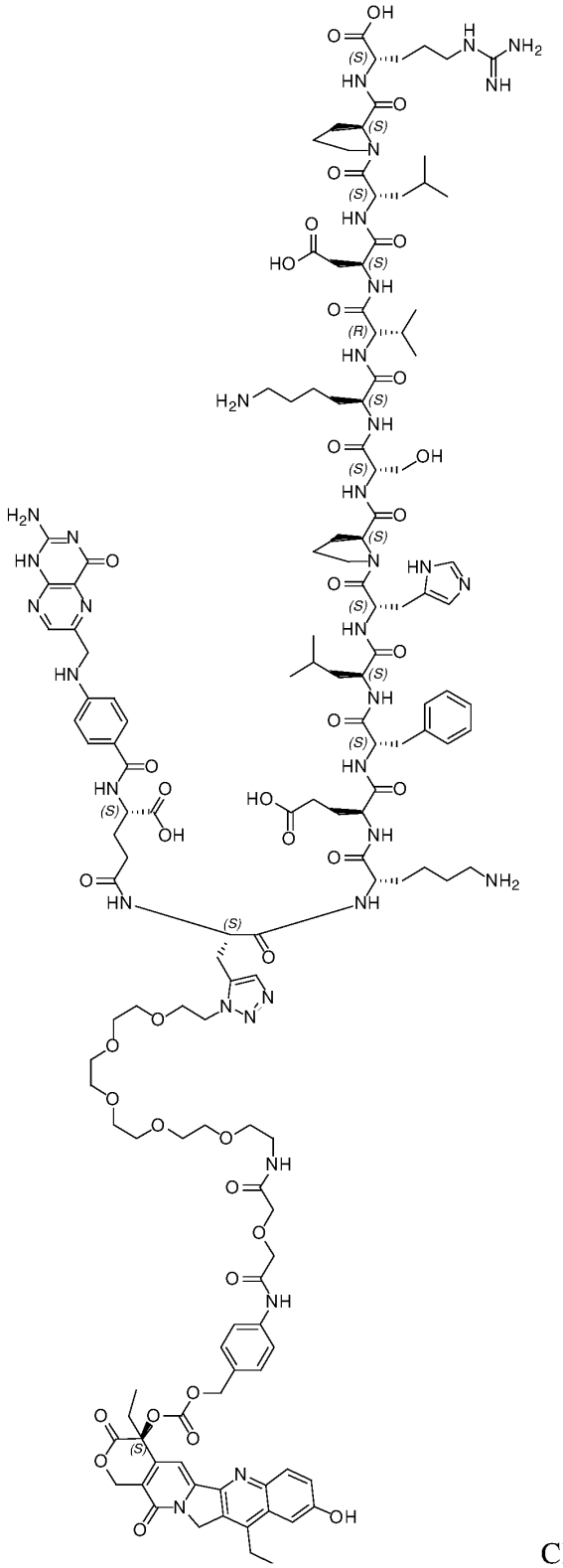
CB-10S

图 1（续）



CR19425

图 1（续）



CB-50S

图 1（续）

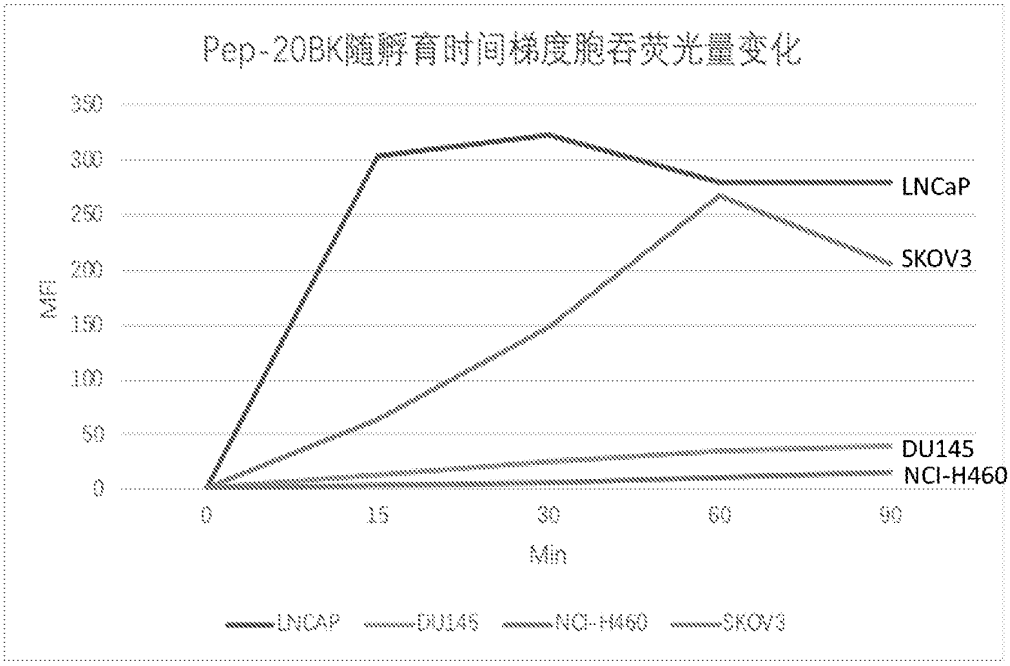

Pep-20BK随孵育时间梯度胞吞荧光量变化
350
300
250
200
150
100
50
0
MFI
0
15
30
60
90
Min
LNCaP
SKOV3
DU145
NCI-H460
LNCAP
DU145
NCI-H460
SKOV3

图 2A

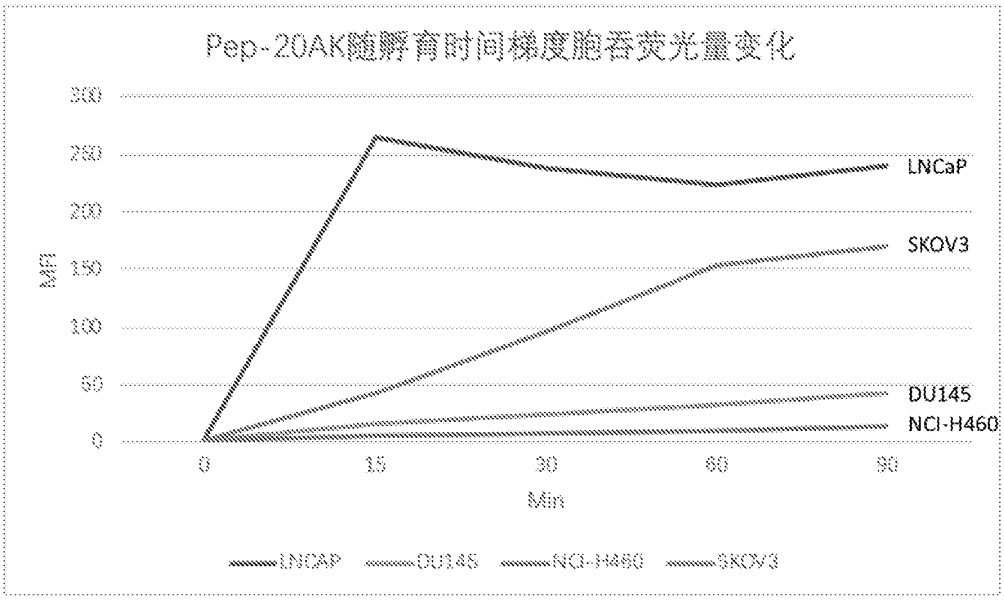

Pep-20AK随孵育时间梯度胞吞荧光量变化
300
250
200
150
100
50
0
MFI
0
15
30
60
90
Min
LNCaP
SKOV3
DU145
NCI-H460
LNCAP
DU145
NCI-H460
SKOV3

图 2B

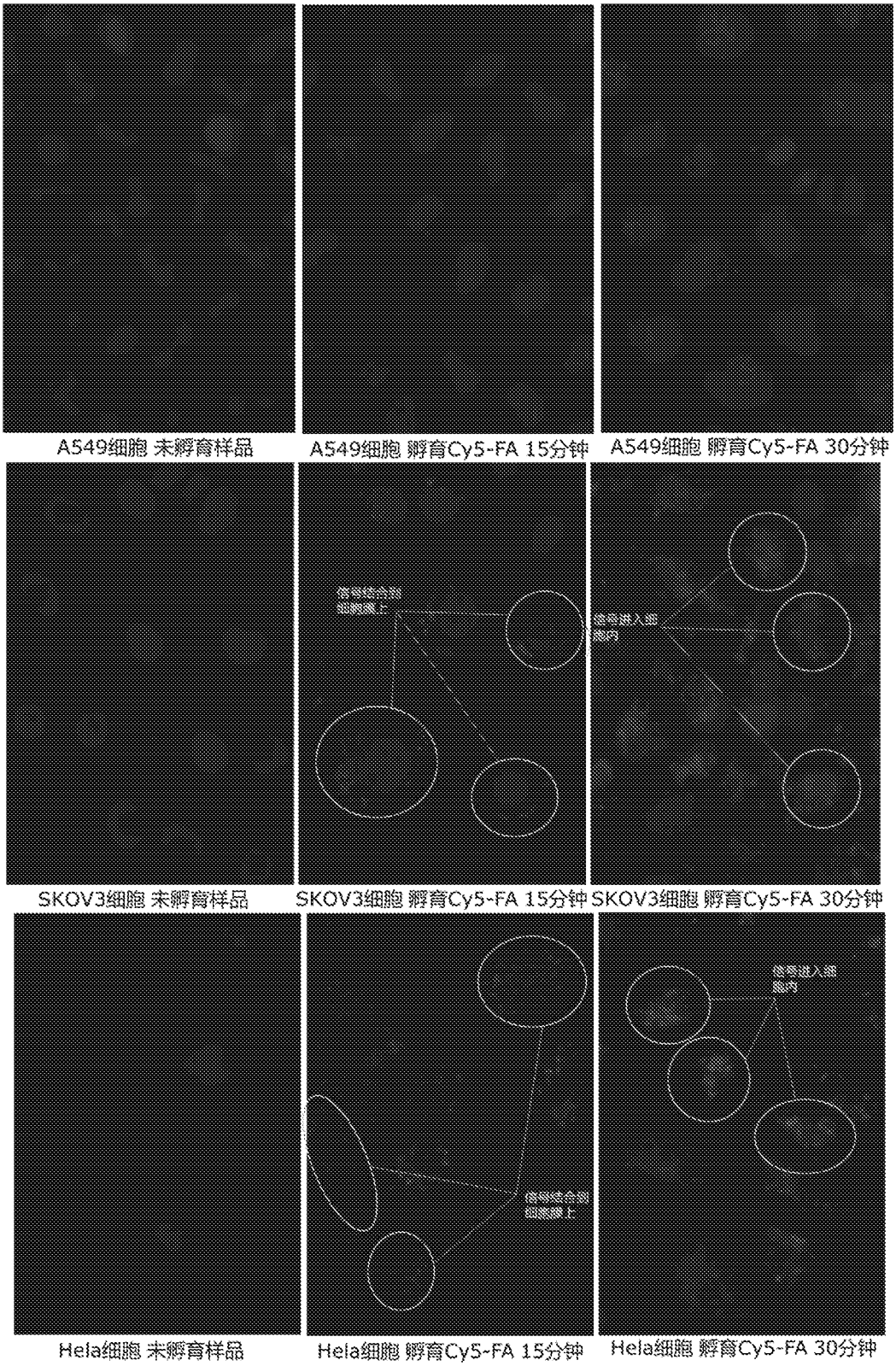
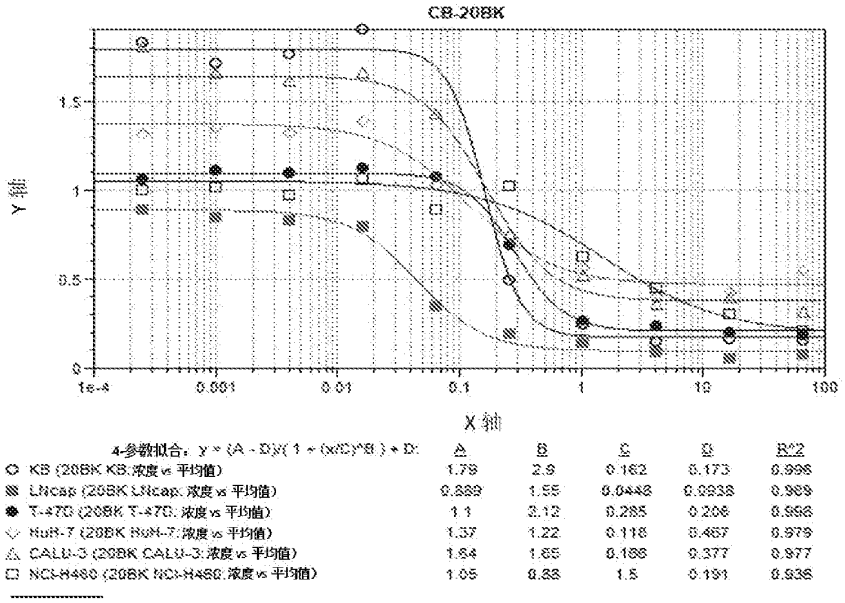
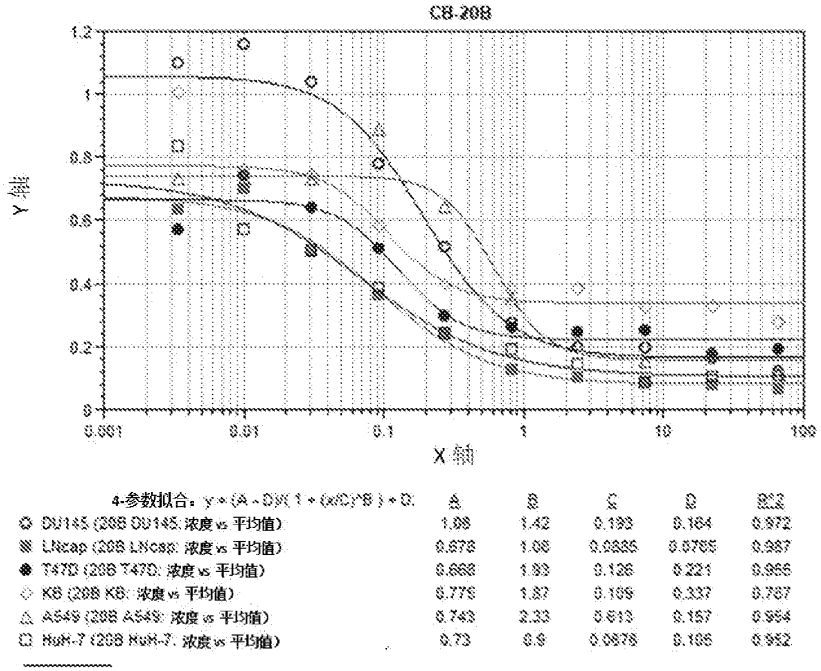

A549细胞 未孵育样品
A549细胞 孵育Cy5-FA 15分钟
A549细胞 孵育Cy5-FA 30分钟
SKOV3细胞 未孵育样品
SKOV3细胞 孵育Cy5-FA 15分钟
SKOV3细胞 孵育Cy5-FA 30分钟
Hela细胞 未孵育样品
Hela细胞 孵育Cy5-FA 15分钟
Hela细胞 孵育Cy5-FA 30分钟

图 3



4-参数拟合：Y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D:	A	B	C	D	R^2
KB (20BK KB.浓度 vs 平均值)	1.79	2.9	0.162	0.173	0.996
LNcap (20BK LNcap.浓度 vs 平均值)	0.889	1.55	0.0448	0.0938	0.989
T-47D (20BK T-47D.浓度 vs 平均值)	1.1	3.12	0.285	0.206	0.996
NuM-7 (20BK NuM-7.浓度 vs 平均值)	1.37	1.22	0.118	0.467	0.979
CALU-3 (20BK CALU-3.浓度 vs 平均值)	1.64	1.65	0.186	0.377	0.977
NCI-H460 (20BK NCI-H460.浓度 vs 平均值)	1.05	0.88	1.5	0.191	0.936

图 4A



4-参数拟合：y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D:	A	B	C	D	R^2
DU145 (208 DU145: 浓度 vs 平均值)	1.08	1.42	0.193	0.164	0.972
LNcap (208 LNcap: 浓度 vs 平均值)	0.878	1.06	0.0835	0.0765	0.987
T47D (208 T47D: 浓度 vs 平均值)	0.668	1.03	0.126	0.221	0.966
KB (208 KB: 浓度 vs 平均值)	0.778	1.87	0.109	0.337	0.767
A549 (208 A549: 浓度 vs 平均值)	0.743	2.33	0.613	0.157	0.964
HuH-7 (208 HuH-7: 浓度 vs 平均值)	0.73	0.9	0.0878	0.106	0.952

图 4B

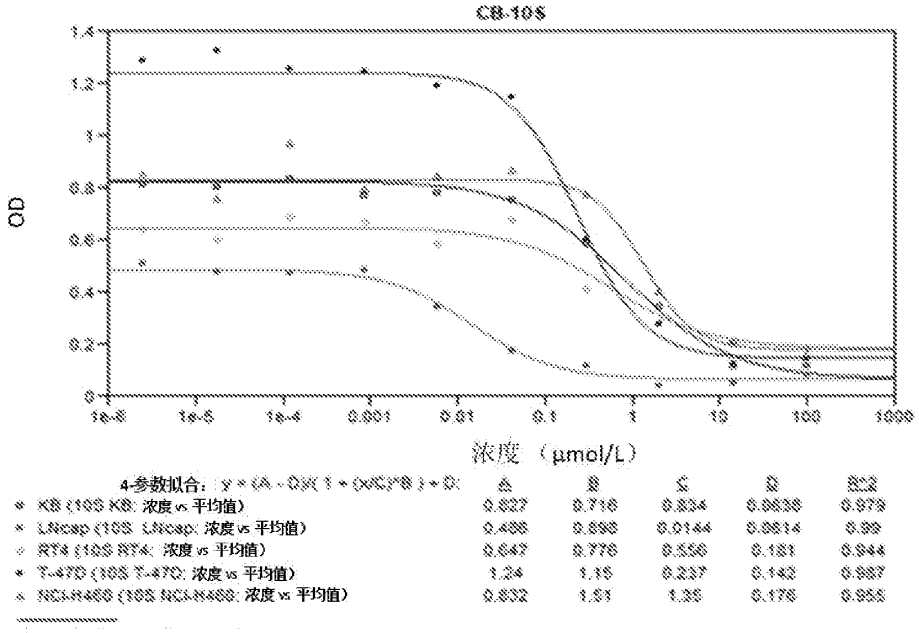

CB-10S
OD
浓度 （μmol/L）
4-参数拟合：y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D:
KB (10S KB: 浓度 vs 平均值)
LNcap (10S LNcap: 浓度 vs 平均值)
RT4 (10S RT4: 浓度 vs 平均值)
T-47D (10S T-47D: 浓度 vs 平均值)
NCI-H460 (10S NCI-H460: 浓度 vs 平均值)

图 4C

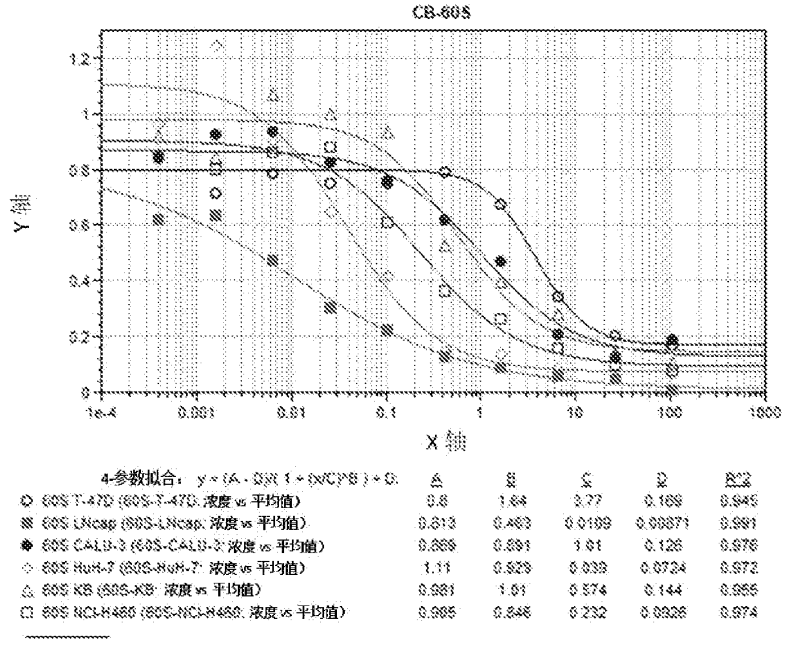

CB-608
Y 轴
X 轴
4-参数拟合： y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D
A B C D 相关
608 T-47D (608-T-47D, 浓度 vs 平均值) 0.8 1.64 0.77 0.169 0.945
608 LNcap (608-LNcap, 浓度 vs 平均值) 0.813 0.463 0.0169 0.00871 0.991
608 CALU-3 (608-CALU-3, 浓度 vs 平均值) 0.865 0.891 1.01 0.126 0.976
608 HuH-7 (608-HuH-7, 浓度 vs 平均值) 1.11 0.929 0.033 0.0724 0.973
608 KB (608-KB, 浓度 vs 平均值) 0.981 1.61 0.574 0.144 0.986
608 NCI-H460 (608-NCI-H460, 浓度 vs 平均值) 0.985 0.846 0.232 0.0926 0.974

图 4D

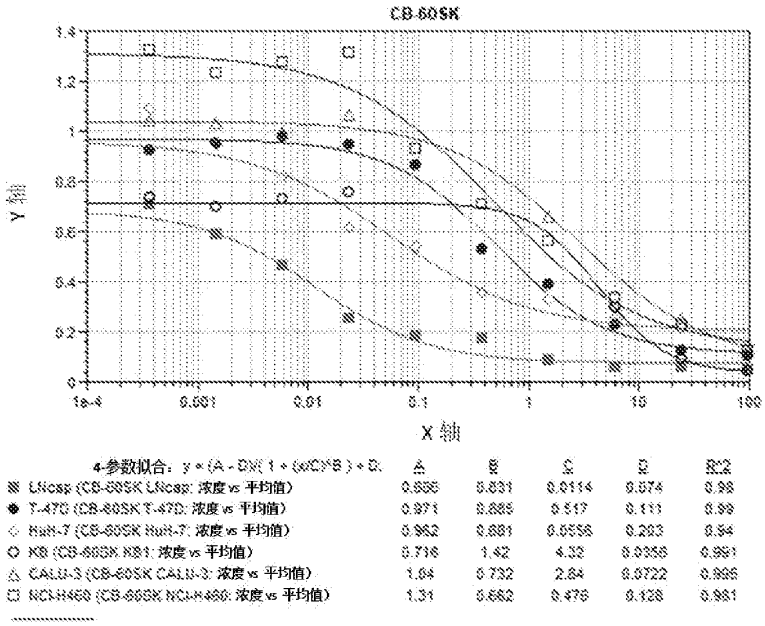

CB-60SK
Y 轴
X 轴
1e-4
0.001
0.01
0.1
1
10
100
4-参数拟合：y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D;
A
B
C
D
R^2
LNcap (CB-60SK LNcap: 浓度 vs 平均值)
0.8536
0.831
0.0114
0.074
0.98
T-47D (CB-60SK T-47D: 浓度 vs 平均值)
0.971
0.885
0.517
0.111
0.99
HuH-7 (CB-60SK HuH-7: 浓度 vs 平均值)
0.962
0.881
0.0558
0.203
0.94
KB (CB-60SK KB1: 浓度 vs 平均值)
0.716
1.42
4.33
0.0356
0.991
CALU-3 (CB-60SK CALU-3: 浓度 vs 平均值)
1.04
0.732
2.84
0.0722
0.995
NCI-H460 (CB-60SK NCI-H460: 浓度 vs 平均值)
1.31
0.662
0.476
0.138
0.981

图 4E

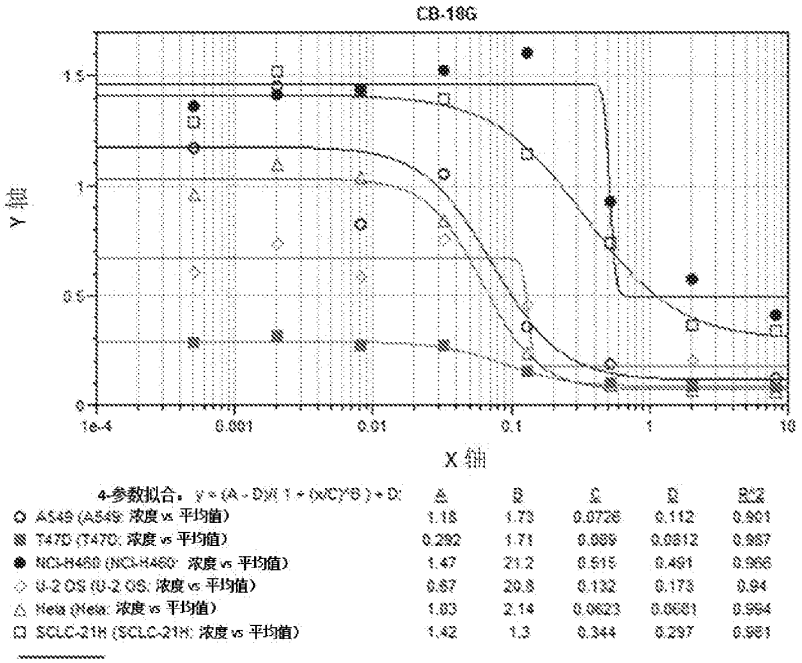

CB-186
Y 轴
X 轴
1.5
1
0.5
0
1e-4
0.001
0.01
0.1
1
10
4-参数拟合。y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D
A
B
C
D
R^2
A549 (A549: 浓度 vs 平均值) 1.18 1.73 0.0726 0.112 0.991
T47D (T47D: 浓度 vs 平均值) 0.292 1.71 0.889 0.0812 0.987
NCI-H460 (NCI-H460: 浓度 vs 平均值) 1.47 21.2 0.515 0.491 0.986
U-2 OS (U-2 OS: 浓度 vs 平均值) 0.87 20.8 0.132 0.173 0.94
Hela (Hela: 浓度 vs 平均值) 1.83 2.14 0.0623 0.0581 0.994
SCLC-21H (SCLC-21H: 浓度 vs 平均值) 1.42 1.3 0.344 0.297 0.981

图 4F

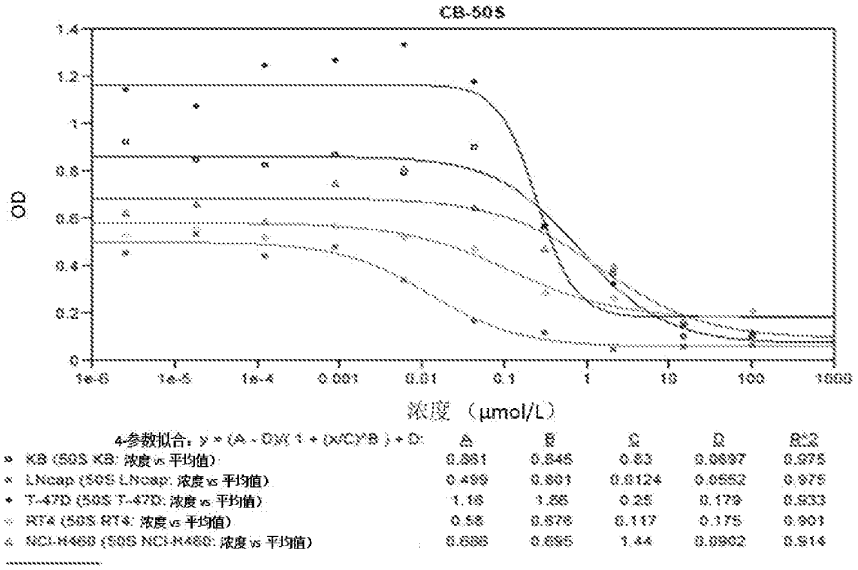

CB-505
OD
浓度 (μmol/L)
4-参数拟合: y = (A - D)/(1 + (x/C)^B) + D
A
B
C
D
R^2
KB (505 KB: 浓度 vs 平均值) 0.881 0.846 0.83 0.0887 0.975
LNcap (505 LNcap: 浓度 vs 平均值) 0.499 0.801 0.0124 0.0562 0.975
T-47D (505 T-47D: 浓度 vs 平均值) 1.18 1.86 0.28 0.179 0.933
RT4 (505 RT4: 浓度 vs 平均值) 0.58 0.878 0.117 0.175 0.901
NCI-H460 (505 NCI-H460: 浓度 vs 平均值) 0.688 0.895 1.44 0.0902 0.914

图 4G

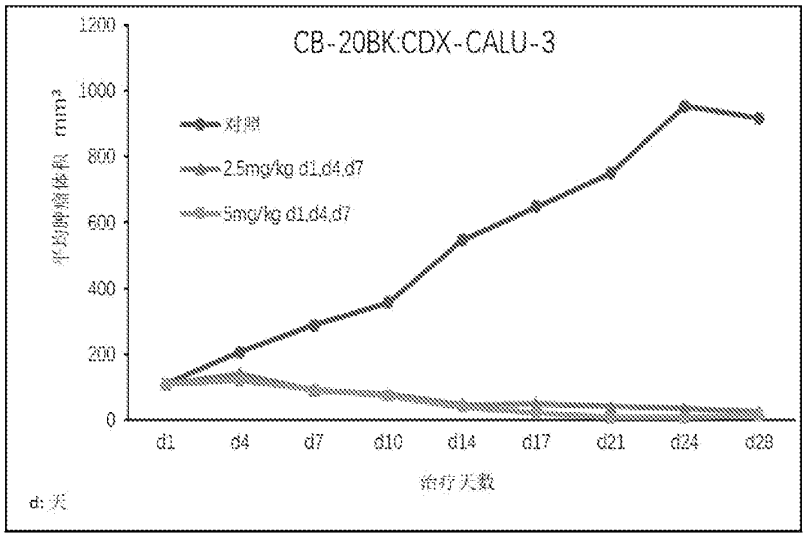

CB-20BK:CDX-CALU-3
对照
2.5mg/kg d1,d4,d7
5mg/kg d1,d4,d7
平均肿瘤体积 mm³
1200
1000
800
600
400
200
0
d1
d4
d7
d10
d14
d17
d21
d24
d28
治疗天数
d: 天

图 5A

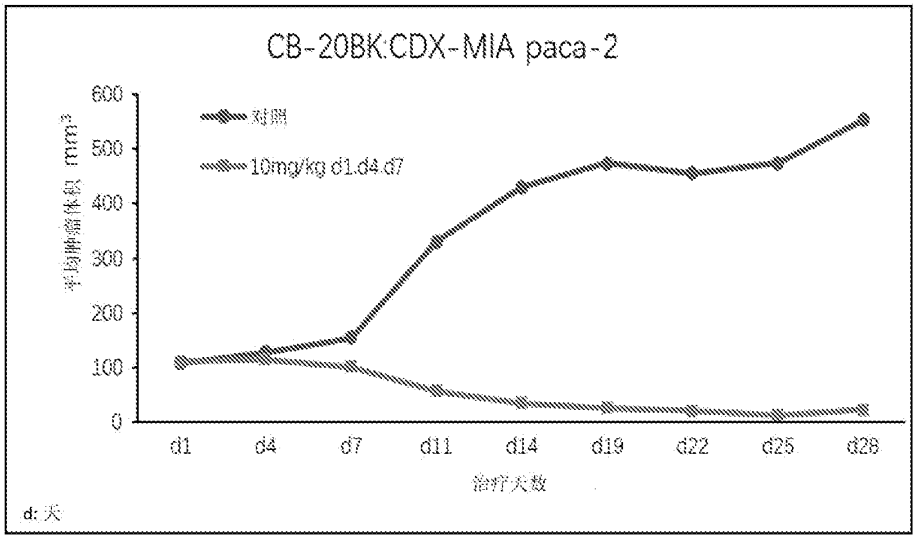

CB-20BK:CDX-MIA paca-2
对照
10mg/kg d1,d4,d7
平均肿瘤体积 mm³
600
500
400
300
200
100
0
d1
d4
d7
d11
d14
d19
d22
d25
d28
治疗天数
d: 天

图 5B

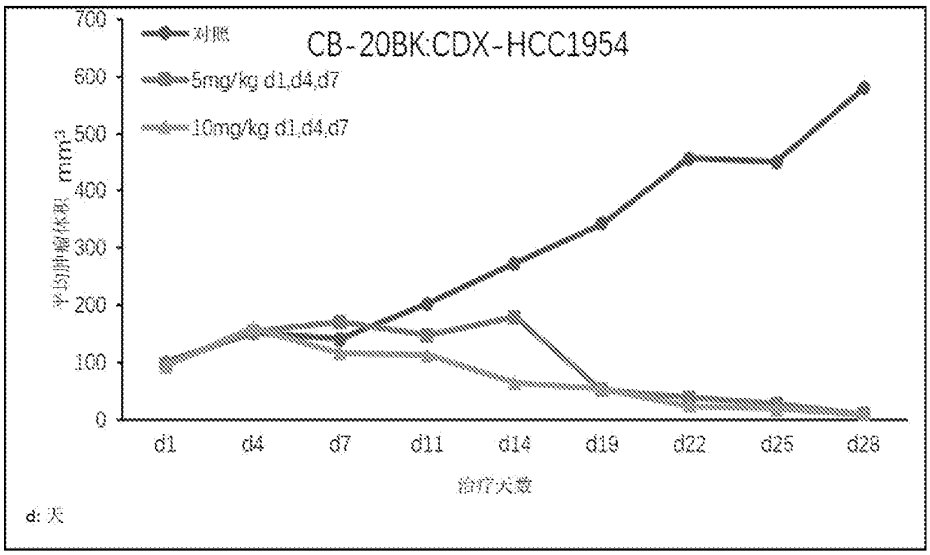

CB-20BK:CDX-HCC1954
对照
5mg/kg d1,d4,d7
10mg/kg d1,d4,d7
平均肿瘤体积 mm3
700
600
500
400
300
200
100
0
d1
d4
d7
d11
d14
d19
d22
d25
d28
治疗天数
d: 天

图 5C

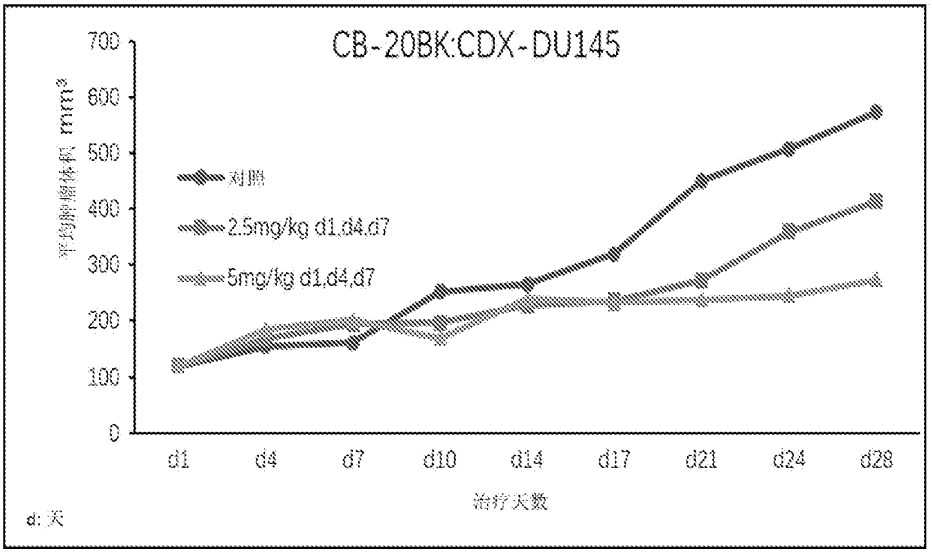

CB-20BK:CDX-DU145
对照
2.5mg/kg d1,d4,d7
5mg/kg d1,d4,d7
平均肿瘤体积 mm3
700
600
500
400
300
200
100
0
d1
d4
d7
d10
d14
d17
d21
d24
d28
治疗天数
d: 天

图 5D

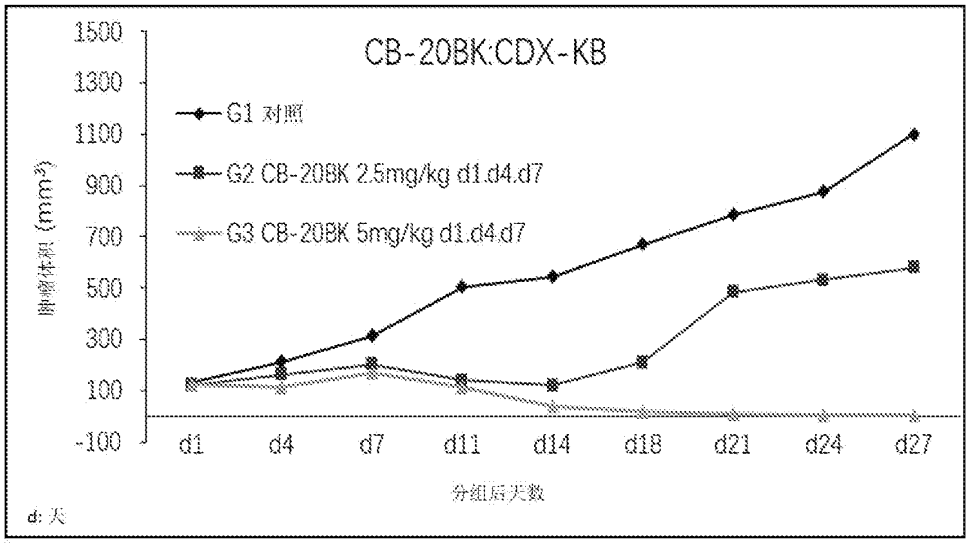

CB-20BK:CDX-KB
G1 对照
G2 CB-20BK 2.5mg/kg d1.d4.d7
G3 CB-20BK 5mg/kg d1.d4.d7
肿瘤体积 (mm³)
1500
1300
1100
900
700
500
300
100
-100
d1
d4
d7
d11
d14
d18
d21
d24
d27
分组后天数
d: 天

图 5E

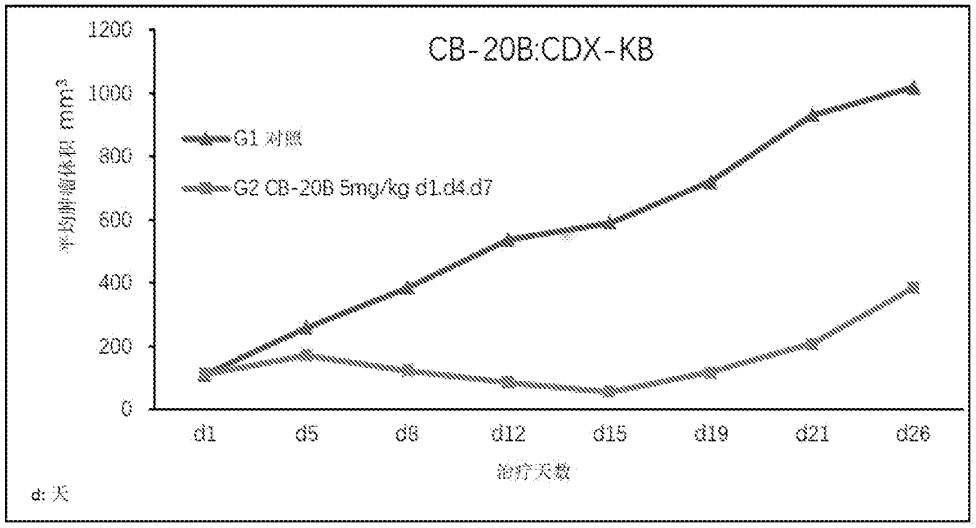

CB-20B:CDX-KB
平均肿瘤体积 mm³
1200
1000
800
600
400
200
0
G1 对照
G2 CB-20B 5mg/kg d1,d4,d7
d1
d5
d8
d12
d15
d19
d21
d26
治疗天数
d: 天

图 6A

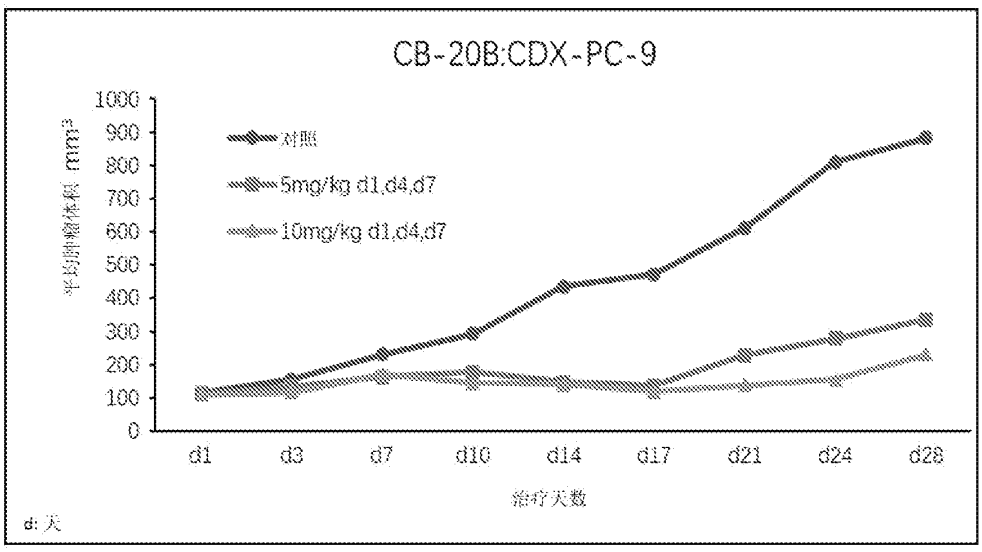

CB-20B:CDX-PC-9
平均肿瘤体积 mm³
1000
900
800
700
600
500
400
300
200
100
0
对照
5mg/kg d1,d4,d7
10mg/kg d1,d4,d7
d1
d3
d7
d10
d14
d17
d21
d24
d28
治疗天数
d: 天

图 6B

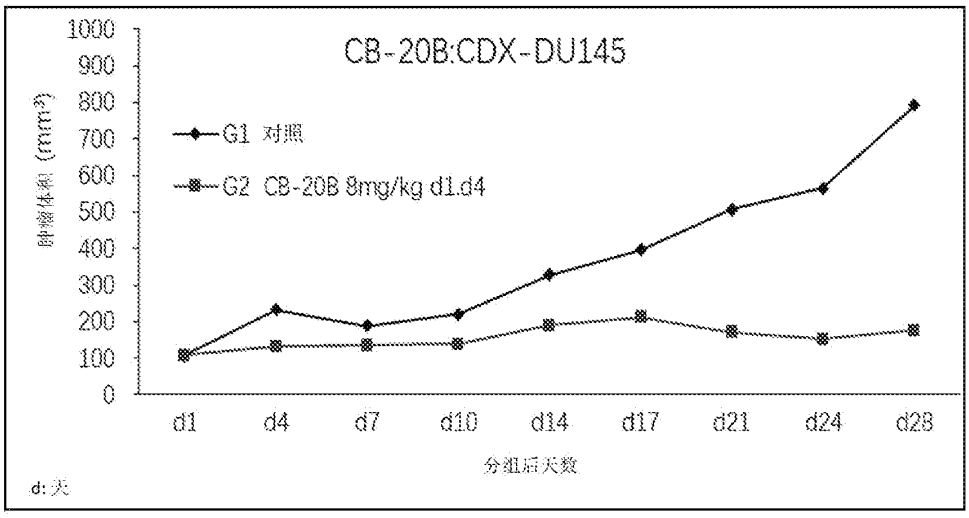

CB-20B:CDX-DU145
G1 对照
G2 CB-20B 8mg/kg d1,d4
肿瘤体积 (mm³)
1000
900
800
700
600
500
400
300
200
100
0
d1
d4
d7
d10
d14
d17
d21
d24
d28
分组后天数
d: 天

图 6C

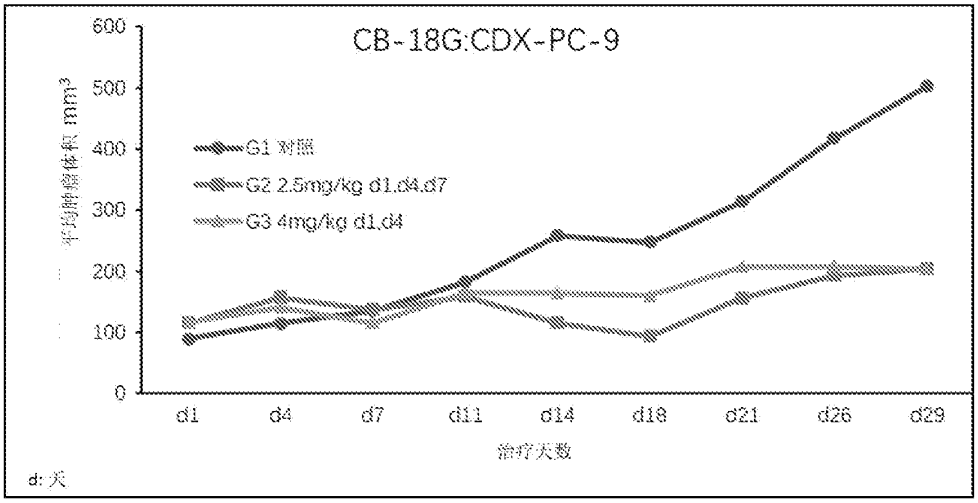

CB-18G:CDX-PC-9
600
500
400
300
200
100
0
G1 对照
G2 2.5mg/kg d1,d4,d7
G3 4mg/kg d1,d4
d1
d4
d7
d11
d14
d18
d21
d26
d29
治疗天数
d: 天

图 7A

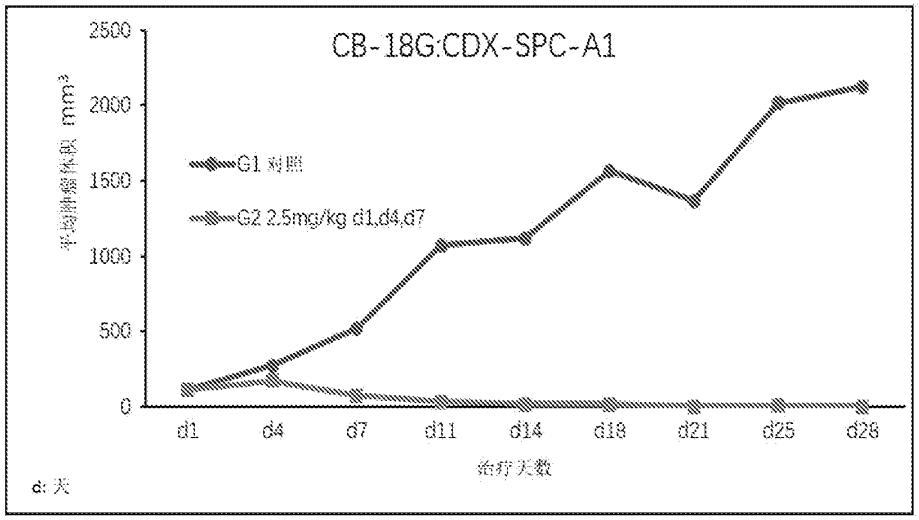

CB-18G:CDX-SPC-A1
2500
2000
1500
1000
500
0
G1 对照
G2 2.5mg/kg d1,d4,d7
d1
d4
d7
d11
d14
d18
d21
d25
d28
治疗天数
d: 天

图 7B

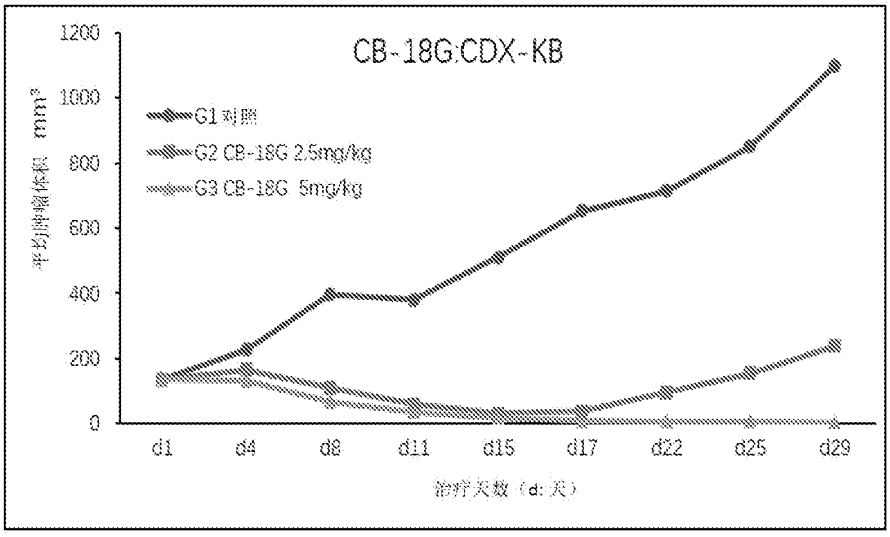

CB-18G:CDX-KB
平均肿瘤体积 mm³
1200
1000
800
600
400
200
0
G1 对照
G2 CB-18G 2.5mg/kg
G3 CB-18G 5mg/kg
d1
d4
d8
d11
d15
d17
d22
d25
d29
治疗天数（d: 天）

图 7C

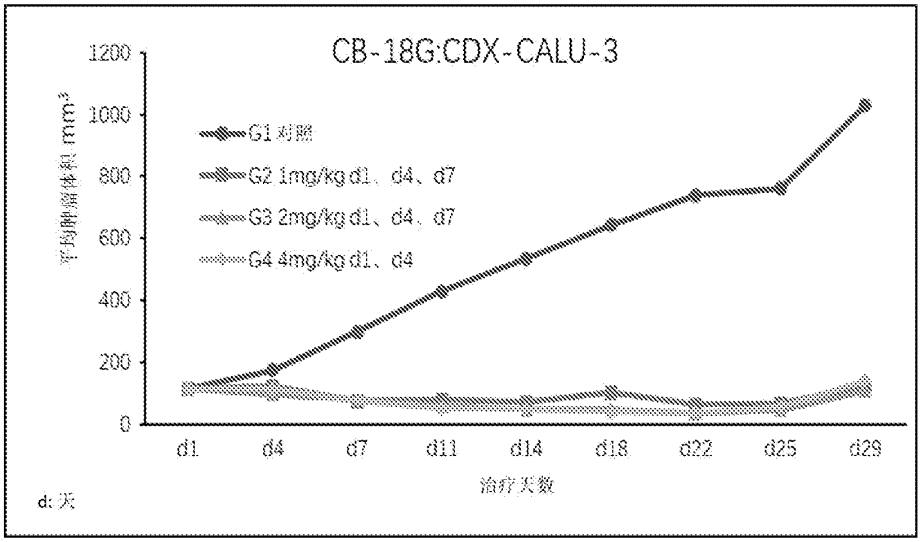

CB-18G:CDX-CALU-3
平均肿瘤体积 mm³
1200
1000
800
600
400
200
0
G1 对照
G2 1mg/kg d1、d4、d7
G3 2mg/kg d1、d4、d7
G4 4mg/kg d1、d4
d1
d4
d7
d11
d14
d18
d22
d25
d29
治疗天数
d: 天

图 7D

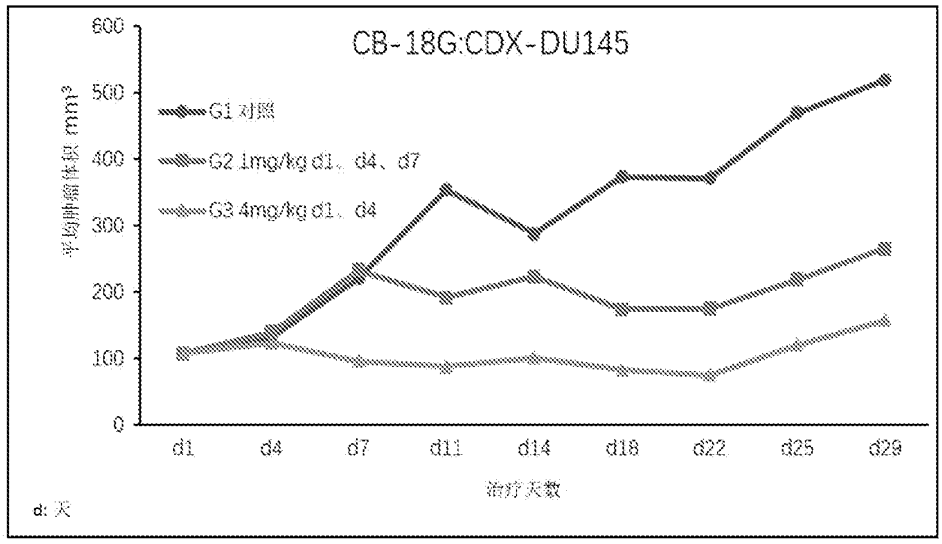

CB-18G:CDX-DU145
G1 对照
G2 1mg/kg d1、d4、d7
G3 4mg/kg d1、d4
平均肿瘤体积 mm³
600
500
400
300
200
100
0
d1
d4
d7
d11
d14
d18
d22
d25
d29
治疗天数
d: 天

图 7E

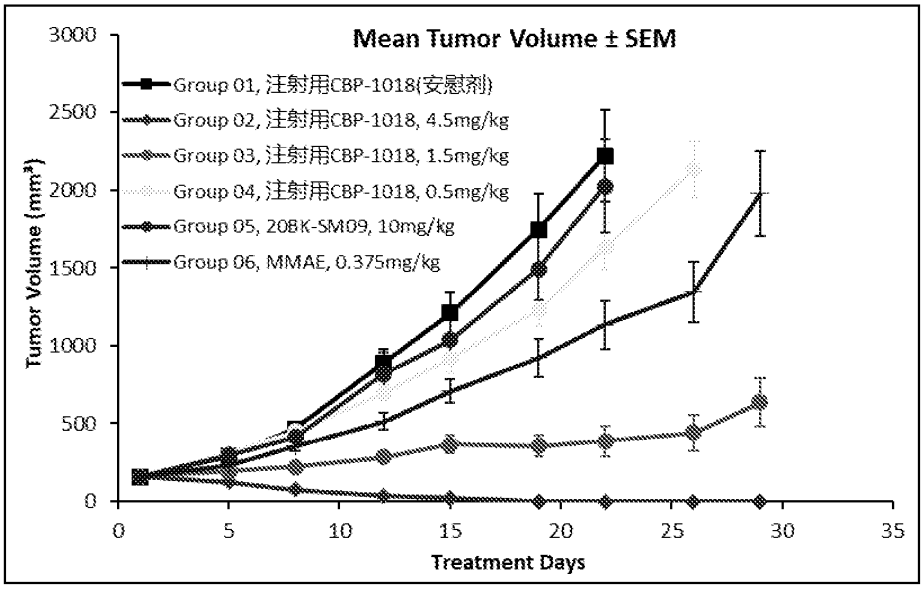

Mean Tumor Volume ± SEM
Group 01, 注射用CBP-1018(安慰剂)
Group 02, 注射用CBP-1018, 4.5mg/kg
Group 03, 注射用CBP-1018, 1.5mg/kg
Group 04, 注射用CBP-1018, 0.5mg/kg
Group 05, 208K-SM09, 10mg/kg
Group 06, MMAE, 0.375mg/kg
Tumor Volume (mm³)
Treatment Days
0
500
1000
1500
2000
2500
3000
0
5
10
15
20
25
30
35

图 8A

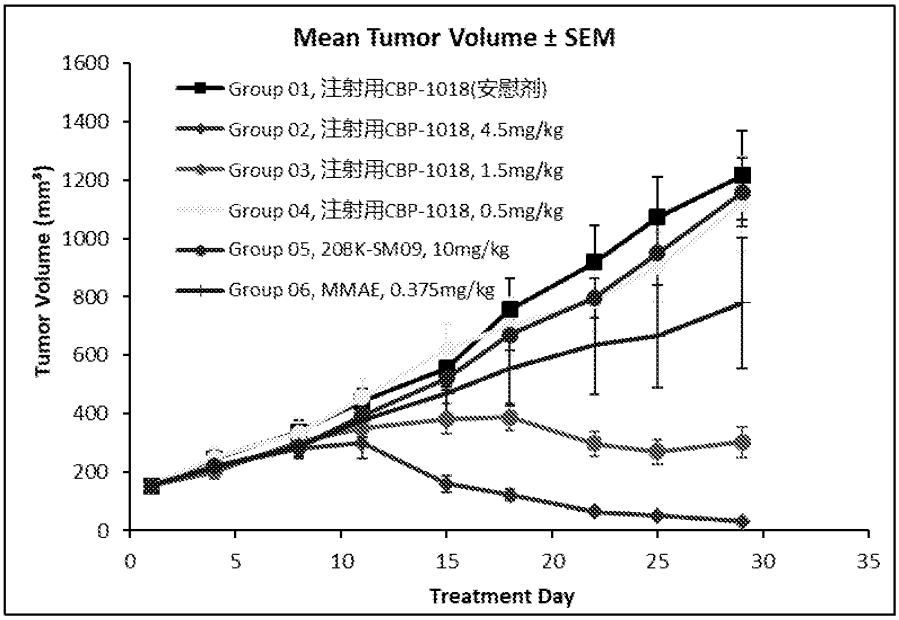

Mean Tumor Volume ± SEM
Group 01, 注射用CBP-1018(安慰剂)
Group 02, 注射用CBP-1018, 4.5mg/kg
Group 03, 注射用CBP-1018, 1.5mg/kg
Group 04, 注射用CBP-1018, 0.5mg/kg
Group 05, 208K-SM09, 10mg/kg
Group 06, MMAE, 0.375mg/kg
Tumor Volume (mm³)
Treatment Day
0
200
400
600
800
1000
1200
1400
1600
0
5
10
15
20
25
30
35

图 8B