

(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
2018 年 3 月 1 日 (01.03.2018)



(10) 国际公布号
WO 2018/036473 A1

(51) 国际专利分类号:

C07K 16/46 (2006.01) *A61K 39/395* (2006.01)
C12N 15/13 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C12N 15/62 (2006.01) *A61P 35/02* (2006.01)
G01N 33/68 (2006.01) *A61P 7/06* (2006.01)
G01N 33/577 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2017/098466

(22) 国际申请日: 2017 年 8 月 22 日 (22.08.2017)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201610705624.2 2016 年 8 月 23 日 (23.08.2016) CN

(71) 申请人: 中山康方生物医药有限公司
(AKESO BIOPHARMA, INC.) [CN/CN]; 中国广东省中山市火炬开发区神农路 6 号, Guangdong 528437 (CN)。

(72) 发明人: 李百勇(LI, Baiyong); 中国广东省中山市火炬开发区神农路 6 号, Guangdong 528437 (CN)。夏瑜(XIA, Yu); 中国广东省中山市火炬开发区神农路 6 号, Guangdong 528437 (CN)。王忠民(WANG, Zhongmin Maxwell); 中国广东省中山市火炬开发区神农路 6 号, Guangdong 528437 (CN)。张鹏(ZHANG, Peng); 中国广东省中山市火炬开发区神农路 6 号, Guangdong 528437 (CN)。

(74) 代理人: 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所(CCPIT PATENT AND TRADEMARK LAW OFFICE); 中国北京市西城区阜成门外大街 2 号万通新世界广场 8 层, Beijing 100037 (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, 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, 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,

(54) Title: ANTI-CTLA4 AND ANTI-PD-1 BIFUNCTIONAL ANTIBODY, PHARMACEUTICAL COMPOSITION THEREOF AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 抗CTLA4-抗PD-1双功能抗体、其药物组合物及其用途

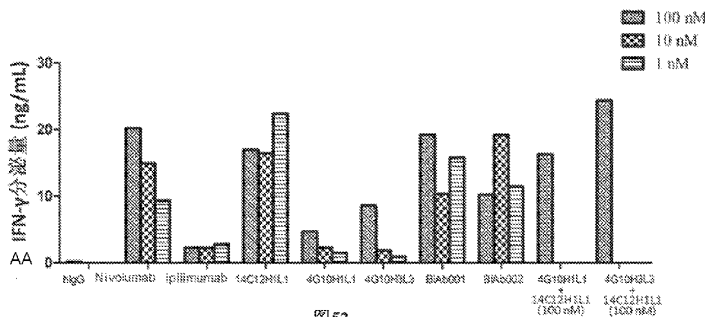


图52

AA IFN- γ SECRETION AMOUNT

(57) Abstract: An anti-CTLA4 (cytotoxic T lymphocyte associated antigen 4) and anti-PD-1 (programmed cell death 1) bifunctional antibody, a pharmaceutical composition thereof and use thereof. Particularly, the anti-CTLA4 and anti-PD-1 bifunctional antibody comprises a first protein functional domain that targets PD-I and a second protein functional domain that targets CTLA4. The bifunctional antibody can bind to CTLA4 and PD-1 specifically, relieve immunosuppression of CTLA4 and PD-1 on an organism specifically, activate T lymphocytes, and thus has good application prospects.

(57) 摘要: 一种抗CTLA4-抗PD-1双功能抗体、其药物组合物及其用途。具体地, 所述的抗CTLA4和PD-1的双功能抗体, 包括: 靶向PD-1的第一蛋白功能区, 和靶向CTLA4的第二蛋白功能区。该双功能抗体能够很好地特异性地与CTLA4和PD-1结合, 特异地解除CTLA4和PD-1对机体免疫抑制, 激活T淋巴细胞, 具有良好的应用前景。

[见续页]

WO 2018/036473 A1

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,
SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VC, VN, 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)。

本国际公布:

- 包括国际检索报告 (条约第21条(3))。
- 包括按细则13之二规定在说明书以外提交的关于
生物材料保藏的说明 (细则13之二. 4(d)(i) 和
48.2(a)(viii))。
- 包括说明书序列表部分 (细则5.2(a))。