(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
20. Juni 2013 (20.06.2013)

WIPO | PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2013/087716 A2

(51) Internationale Patentklassifikation:
A61K 47/48 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2012/075277

(22) Internationales Anmeldedatum:
12. Dezember 2012 (12.12.2012)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
11193617.5 14. Dezember 2011 (14.12.2011) EP
12189467.9 22. Oktober 2012 (22.10.2012) EP

(71) Anmelder: **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; Müllerstr. 178, 13353 Berlin (DE). **BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH** [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim (DE). **SEATTLE GENETICS, INC.** [US/US]; 21823 30th Drive S.E., Bothell, Washington 98021 (US).

(72) Erfinder: **LERCHEN, Hans-Georg**; Sürderstr.3, 51375 Leverkusen (DE). **HAMMER, Stefanie**; Neue Welt 12, 10247 Berlin (DE). **HARRENGA, Axel**; Sadowastr. 17, 42115 Wuppertal (DE). **KOPITZ, Charlotte Christine**; Brahestraße 21, 10589 Berlin (DE). **NISING, Carl Friedrich**; Hüscheider Strasse 38c, 51381 Leverkusen (DE). **SOMMER, Anette**; Chodowiecki Str. 28, 10405 Berlin (DE). **STELTE-LUDWIG, Beatrix**; Görtzheide 10f, 42489 Wülfrath (DE). **MAHLERT, Christoph**; Kranichweg 11, 42111 Wuppertal (DE). **SCHUHMACHER, Joachim**; Lipkenskothen 31, 42113 Wuppertal (DE). **GOLFIER, Sven**; Stölpchenweg 12E, 14109 Berlin (DE). **GREVEN, Simone**; Am Schneckenacker 45, 41541 Dormagen (DE). **BRUDER, Sandra**; Beethovenstr. 33, 53175 Leverkusen (DE).

(74) Anwalt: **BIP Patents**; c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Creative Campus Monheim, Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: 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, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, 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, 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) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (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, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)*

Veröffentlicht:

— *ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts (Regel 48 Absatz 2 Buchstabe g)*

— *mit dem Sequenzprotokollteil der Beschreibung (Regel 5 Absatz 2 Buchstabe a)*

(54) Title: NEW ANTIBODY DRUG CONJUGATES (ADCS) AND THE USE THEREOF

(54) Bezeichnung : NEUE BINDER-WIRKSTOFF KONJUGATE (ADCS) UND IHRE VERWENDUNG

(57) Abstract: The present application relates to new antibody drug conjugates (ADCs) of N,N dialkylauristatins directed against the target FGFR2, drug metabolites of said ADCs, a method for producing said ADCs, the use of said ADCs for the treatment and/or prevention of illnesses as well as the use of said ADCs for producing pharmaceuticals for the treatment and/or prevention of illnesses, particularly of hyperproliferative and/or angiogenic diseases such as carcinosis. Such treatments can be carried out as monotherapy or in combination with other pharmaceuticals or additional therapeutic measures.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Anmeldung betrifft neue, gegen das Target FGFR2 gerichtete Binder-Wirkstoff-Konjugate (ADCs) von N,N-Dialkylauristatinen, wirksamer Metabolite dieser ADCs, Verfahren zur Herstellung dieser ADCs, die Verwendung dieser ADCs zur Behandlung und/oder Prävention von Krankheiten sowie die Verwendung dieser ADCs zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prävention von Krankheiten, insbesondere von hyperproliferativen und/oder angiogenen Erkrankungen wie beispielsweise Krebserkrankungen. Solche Behandlungen können als Monotherapie oder auch in Kombination mit anderen Arzneimitteln oder weiteren therapeutischen Maßnahmen erfolgen.

WO 2013/087716 A2