

(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



(10) 国际公布号
WO 2025/228172 A1

(43) 国际公布日
2025 年 11 月 6 日 (06.11.2025)

(51) 国际专利分类号:

C07D 493/22 (2006.01) **A61K 47/68** (2017.01)
C07K 16/28 (2006.01) **A61K 47/64** (2017.01)
C07K 16/30 (2006.01) **A61P 35/00** (2006.01)

SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UY, 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)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2025/090154

(22) 国际申请日: 2025 年 4 月 21 日 (21.04.2025)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202410530458.1 2024年4月28日 (28.04.2024) CN

(71) 申请人:上海拓济医药有限责任公司(SHANGHAI
PHRONTLINE BIOPHARMA CO., LTD) [CN/CN]; 中
国上海市浦东新区高科中路 1976 号 1 幢
B座502室 201210 (CN)。

本国际公布:
— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。

(72) 发明人:毛彦利(MAO, Yanli); 中国上海市浦东新区
高科中路1976号1幢B座502室 201210 (CN)。 陈
兆远(CHEN, Zhaoyuan); 中国上海市浦东新区高科
中路1976号1幢B座502室 201210 (CN)。

(74) 代理人:北京市中伦律师事务所(ZHONGLUN LAW
FIRM); 中国北京市朝阳区金和东路20号院正
大中心南塔22-31层 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: ERIBULIN DERIVATIVE AND ANTIBODY-DRUG CONJUGATE THEREOF, AND MEDICAL USE THEREOF

(54) 发明名称: 艾日布林衍生物及其抗体药物偶联物和医药用途

(57) Abstract: The present application relates to the technical field of medicines, and in particular to an eribulin derivative and an antibody-drug conjugate (ADC) thereof, and a medical use thereof. In the present application, a series of derivatives with good tumor suppression effects are synthesized by modifying eribulin, and have lower toxicity and a larger therapeutic window than that of eribulin; and then the eribulin derivative and an antibody are made into an ADC by means of an appropriate linker, and the therapeutic efficiency of the eribulin derivative is improved using the targeting specificity of the antibody.

(57) 摘要: 本申请涉及医药技术领域, 具体涉及艾日布林衍生物及其抗体药物偶联物和医药用途。本申请通过改造艾日布林合成一系列具有良好的肿瘤抑制效果的衍生物, 毒性更低、治疗窗相对于艾日布林更大; 再通过合适的连接子把艾日布林衍生物与抗体做成ADC, 利用抗体的靶向特异性提高艾日布林衍生物的治疗效率。

WO 2025/228172 A1