

(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 2022/048640 A1

(43) 国际公布日
2022 年 3 月 10 日 (10.03.2022)

(51) 国际专利分类号:

C07K 14/55 (2006.01) *A61K 47/68* (2017.01)
C07K 14/52 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07K 19/00 (2006.01) *A61P 31/12* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/116463

(22) 国际申请日: 2021 年 9 月 3 日 (03.09.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010918842.0 2020 年 9 月 4 日 (04.09.2020) CN
202110932286.7 2021 年 8 月 13 日 (13.08.2021) CN

(71) 申请人: 江苏先声药业有限公司 (JIANGSU SIMCERE PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省南京市玄武区玄武大道 699 号-18, Jiangsu 210042 (CN)。

(72) 发明人: 胡颖莹 (HU, Yingying); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄, Shanghai 201318 (CN)。曹卓晓 (CAO, Zhuoxiao); 中国上海市浦东新区芙蓉花

路 118 弄, Shanghai 201318 (CN)。唐任宏 (TANG, Renhong); 中国江苏省南京市玄武区玄武大道 699 号-18, Jiangsu 210042 (CN)。葛虎 (GE, Hu); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄, Shanghai 201318 (CN)。付雅媛 (FU, Yayuan); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄, Shanghai 201318 (CN)。任晋生 (REN, Jinsheng); 中国江苏省南京市玄武区玄武大道 699 号-18, Jiangsu 210042 (CN)。

(74) 代理人: 北京汇铮律师事务所 (BEIJING HUIZHENG LAW OFFICE); 中国北京市海淀区知春路 63 号 51 号楼十五层 1510 室, Beijing 100190 (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, IT, 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, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL,

(54) Title: IL-2 MUTANT AND APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: IL-2 突变体及其应用

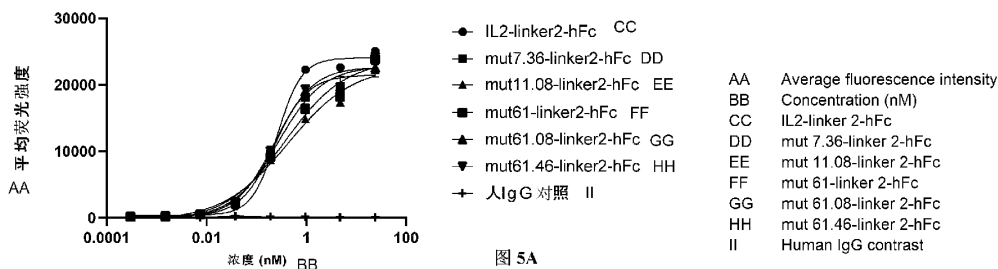


图 5A

(57) Abstract: Provided are an IL-2 mutant and an application thereof. Specifically disclosed are the IL-2 mutant, a corresponding fusion protein, conjugate, nucleic acid fragment, carrier and host cell, a preparation method for the mutant or the fusion protein, the IL-2 mutant or the fusion protein prepared according to the method, a pharmaceutical composition, a pharmaceutical use, a disease treatment method, and a method for preferentially stimulating a regulatory T cell. Compared with wild-type IL-2, the IL-2 mutant increases the Tm value and improves the stability of an IL-2 protein; or compared with a wild type, the IL-2 mutant increases the yield, or changes the binding activity to an IL-2R $\beta\gamma$ compound.

(57) 摘要: 提供了 IL-2 突变体及其应用, 具体公开 IL-2 突变体及相应的融合蛋白、缀合物、核酸片段、载体、宿主细胞、所述突变体或融合蛋白的制备方法、根据所述方法制备而成的 IL-2 突变体或融合蛋白、药物组合物、制药用途、疾病治疗方法和优先刺激调节性 T 细胞的方法; 所述 IL-2 突变体与野生型 IL-2 相比, Tm 值升高, 改善了 IL-2 蛋白的稳定性; 或与野生型相比, 所述 IL-2 突变体产量升高, 或者其与 IL-2R $\beta\gamma$ 复合物的结合活性改变。

[见续页]

PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, 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, 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))。
- 包括说明书序列表部分 (细则5.2(a))。