

(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 2022/078523 A1

(43) 国际公布日
2022 年 4 月 21 日 (21.04.2022)

(51) 国际专利分类号:

A61K 47/68 (2017.01) *C07K 16/30* (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07K 16/18 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/124698

(22) 国际申请日: 2021 年 10 月 19 日 (19.10.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202011105383.0 2020 年 10 月 15 日 (15.10.2020) CN

(71) 申请人: 上海美雅珂生物技术有限责任公司 (SHANGHAI MIRACOGEN INC.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区张江路 1238 弄 3 号 4E, Shanghai 201203 (CN)。康诺亚生物医药科技(成都)有限公司(KEYMED BIOSCIENCES CO., LTD) [CN/CN]; 中国四川省成都市双流区成都天府国际生物城中路 18 号 D2 号楼, Sichuan 610219 (CN)。

(72) 发明人: 胡朝红(HU, Chaohong); 中国上海市浦东新区张江路 1238 弄 3 号 4E, Shanghai 201203 (CN)。李虎(LI, Hu); 中国上海市浦东新区张江路 1238 弄 3 号 4E, Shanghai 201203 (CN)。陈博(CHEN, Bo); 中国四川省成都市双流区成都天

府国际生物城中路 18 号 D2 号楼, Sichuan 610219 (CN)。徐刚(XU, Gang); 中国四川省成都市双流区成都天府国际生物城中路 18 号 D2 号楼, Sichuan 610219 (CN)。王莹(WANG, Ying); 中国四川省成都市双流区成都天府国际生物城中路 18 号 D2 号楼, Sichuan 610219 (CN)。

(74) 代理人: 中国贸促会专利商标事务所有限公司 (CCPIT PATENT AND TRADEMARK LAW OFFICE); 中国北京市复兴门内大街 158 号远洋大厦 F10 层, Beijing 100031 (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, 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,

(54) Title: ANTIBODY-DRUG CONJUGATE AND APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 抗体药物偶联物及其应用

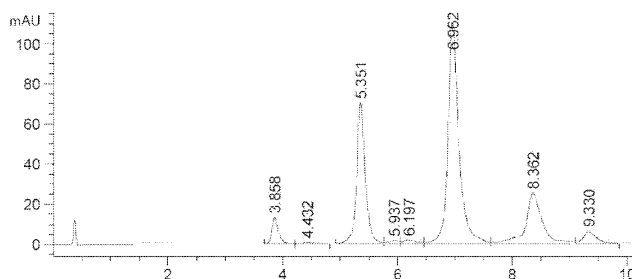


图 6

(57) Abstract: The present invention relates to an antibody-drug conjugate and an application thereof, and specifically provides the antibody-drug conjugate, a pharmaceutically acceptable salt and solvate thereof, or a solvate of the salt. The antibody-drug conjugate has the structure represented by formula I, wherein Ab is an anti-Claudin 18.2 antibody. The antibody-drug conjugate of the present invention has good tumor cell growth inhibition activity in vivo and in vitro, low cytotoxicity, and good application prospects.

(57) 摘要: 本发明涉及抗体药物偶联物及其应用, 具体提供了抗体药物偶联物, 其药学上可接受的盐、溶剂合物或所述盐的溶剂合物, 所述抗体药物偶联物具有式 I 所示的结构, 其中, Ab 为抗Claudin 18.2 抗体。本发明的抗体药物偶联物在体内和体外都具有良好的抑制肿瘤细胞生长活性, 且细胞毒性低, 具有良好的应用前景。Ab-(L-D)_p 式 I

[见续页]



WO 2022/078523 A1

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))。
- 包括关于请求恢复一项或多项优先权要求的信息 (细则26之二. 3和48. 2(b) (vii))。
- 包括说明书序列表部分 (细则5. 2(a))。