

(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 2025/103367 A1

(43) 国际公布日
2025 年 5 月 22 日 (22.05.2025)

(51) 国际专利分类号:

A61K 47/68 (2017.01) **C07K 5/062** (2006.01)
A61K 47/64 (2017.01) **A61P 35/00** (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/131800

(22) 国际申请日: 2024 年 11 月 13 日 (13.11.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202311515509.5 2023 年 11 月 14 日 (14.11.2023) CN
202410173706.1 2024 年 2 月 6 日 (06.02.2024) CN

(71) 申请人: 海南先声再明医药股份有限公司 (**HAINAN SIMCERE ZAIMING PHARMACEUTICAL CO., LTD.**) [CN/CN]; 中国海南省海口市秀英区药谷一横路 20 号 570311 (CN)。

(72) 发明人: 李桢 (**LI, Zhen**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。王雪枫 (**WANG, Xuefeng**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。陈常艳 (**CHEN, Changyan**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。付雅媛 (**FU, Yayuan**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。魏梦浩 (**WEI, Menghao**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。李正涛 (**LI, Zhengtao**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。岑超超 (**CEN, Chaochao**); 中国上海市浦东新区芙蓉花路 118 弄 201318 (CN)。

(74) 代理人: 北京英赛嘉华知识产权代理有限公司 (**INSIGHT INTELLECTUAL PROPERTY LTD.**); 中国北京市朝阳区建外街道光华东里 8 号院中海广场中楼 7 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, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW。

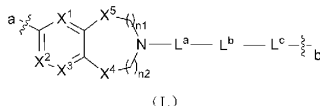
(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

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))。

(54) **Title:** LIGAND-DRUG CONJUGATE, LINKER FOR CONJUGATION, AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 配体-药物偶联物、偶联连接子及其用途



(57) **Abstract:** Provided are a ligand-drug conjugate represented by general formula $Pc-(L-D)_n$ or a pharmaceutically acceptable salt thereof, and further provided is a linker for conjugation represented by formula (L). The linker can efficiently and highly selectively perform chemical conjugation with a thiol group on cysteine, and the antibody-drug conjugate formed has good stability.

(57) 摘要: 提供了由通式 $Pc-(L-D)_n$ 表示的一类配体-药物偶联物或其药学上可接受的盐, 还提供了如式 (L) 所示的偶联连接子, 该类连接子可以高效且高选择性地与半胱氨酸上的巯基进行化学偶联, 形成的抗体偶联药物具有良好的稳定性。

WO 2025/103367 A1