

(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 2023/004686 A1

(43) 国际公布日
2023 年 2 月 2 日 (02.02.2023)

(51) 国际专利分类号:

C07C 271/22 (2006.01) A61K 47/54 (2017.01)
C07C 235/78 (2006.01) A61K 47/60 (2017.01)
C07C 237/12 (2006.01) A61K 38/27 (2006.01)
C07C 235/20 (2006.01) A61P 5/06 (2006.01)
C07K 14/61 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/109276

(22) 国际申请日: 2021 年 7 月 29 日 (29.07.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(71) 申请人: 浙江新码生物医药有限公司 (NOVOCODEX BIOPHARMACEUTICALS CO., LTD.) [CN/CN]; 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。

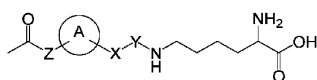
(72) 发明人: 杨金纬 (YANG, Jinwei); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。叶诚浩 (YE, Chenghao); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。夏钢 (XIA, Gang); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。霍鹏超 (HUO, Pengchao); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。丁文 (DING, Wen); 中国浙江省绍兴市越城区马欢

路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。陈龙飞 (CHEN, Longfei); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。焦琳 (JIAO, Lin); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。黄浩 (HUANG, Hao); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。衡新 (HENG, Xin); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。宫丽颖 (GONG, Liying); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。祝静静 (ZHU, Jingjing); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。应跃斌 (YING, Yuebin); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。梁学军 (LIANG, Xuejun); 中国浙江省绍兴市越城区马欢路 398 号科创园科研楼 C 幢北 5 楼 502 室, Zhejiang 312366 (CN)。

(74) 代理人: 北京信诺创成知识产权代理有限公司 (SINO-CREATIVITY INTELLECTUAL PROPERTY LAW FIRM); 中国北京市朝阳区光华路 7 号汉威大厦东区 25A3-1 室, Beijing 100020 (CN)。

(54) Title: UNNATURAL AMINO ACID, AND USE THEREOF, RECOMBINANT PROTEIN CONTAINING SAME, AND RECOMBINANT PROTEIN CONJUGATE

(54) 发明名称: 一种非天然氨基酸及其应用、包含其的重组蛋白以及重组蛋白偶联物



(57) Abstract: Provided is an unnatural amino acid, which is a compound having a structure as shown in formula (I) or an enantiomer thereof. Also provided is the use of the unnatural amino acid. Further provided is a recombinant protein containing the unnatural amino acid and a protein conjugate prepared from the recombinant protein. The unnatural amino acid is easy to prepare and has a good safety; when the unnatural amino acid is inserted into a protein, the protein is not easily inactivated; the unnatural amino acid has a high binding rate to a conjugated moiety, and the stability of the obtained conjugate is higher; and the unnatural amino acid can be used in numerous fields, especially in the preparation of recombinant proteins or recombinant protein conjugates.

(57) 摘要: 提供一种非天然氨基酸, 为具有如式 (I) 所示结构的化合物或其对映异构体。还提供了所述非天然氨基酸的应用。进一步地, 还提供了一种包含所述非天然氨基酸的重组蛋白以及由所述重组蛋白制得的蛋白偶联物。所述非天然氨基酸制备简便, 安全性好, 插入蛋白时不易失活, 与偶联部分的结合率高, 所得偶联物的稳定性也更高, 所述非天然氨基酸可应用至众多领域, 尤其是在制备重组蛋白或重组蛋白偶联物中。

[见续页]

WO 2023/004686 A1

(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, 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))。