

(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 2024/114531 A1

(43) 国际公布日
2024 年 6 月 6 日 (06.06.2024)

(51) 国际专利分类号:

C07D 403/14 (2006.01) **A61K 47/68** (2017.01)

C07D 239/24 (2006.01) **A61K 35/00** (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2023/134038

(22) 国际申请日: 2023 年 11 月 24 日 (24.11.2023)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202211510297.7 2022 年 11 月 29 日 (29.11.2022) CN

202211573191.1 2022 年 12 月 8 日 (08.12.2022) CN

(71) 申请人: 四川科伦博泰生物医药股份有限公司 (**SICHUAN KELUN-BIOTECH BIOPHARMACEUTICAL CO., LTD.**) [CN/CN]; 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技产业开发园区新华大道二段666号, Sichuan 611138 (CN)。

(72) 发明人: 田强(**TIAN, Qiang**); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技产业开发园区新华大道二段666号, Sichuan 611138 (CN)。袁晓曦(**YUAN, Xiaoxi**); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技产业开发园区新华大道二段666号, Sichuan 611138 (CN)。张毅涛(**ZHANG, Yitao**); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技产业开发园区新华大道二段666号, Sichuan 611138 (CN)。宋宏梅(**SONG, Hongmei**); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技产业开发园区新华大道二段666号, Sichuan 611138 (CN)。葛均友(**GE, Junyou**); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技产业开发园区新华大道二段666号, Sichuan 611138 (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**); 中国北京市西城区复兴门内大街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, 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:** HETEROCYCLIC COMPOUND, AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 杂环化合物及其制备方法和用途

(57) **Abstract:** The present application relates to the field of medicine, and particularly relates to a drug linker compound. The drug may comprise a DNA topoisomerase inhibitor. A conjugate prepared from the drug linker compound, such as an antibody drug conjugate, has a better drug antibody coupling ratio, and has a good targeted killing effect on tumors such as lung cancer, melanoma, breast cancer, gastric cancer and colon cancer. In addition, further provided in the present application are a method for preparing the antibody drug-linker molecule, and the use thereof.

(57) 摘要: 本申请涉及医药领域, 具体涉及一种药物连接子化合物, 所述药物可以包括DNA拓扑异构酶抑制剂, 通过药物连接子化合物制得的偶联物, 例如抗体药物偶联物具有较优的药物抗体偶联比, 对肺癌、黑色素瘤、乳腺癌、胃癌、结肠癌等肿瘤具有很好的靶向杀伤效果。此外, 本申请进一步提供所述抗体药物-连接体分子的制备方法及其用途。

WO 2024/114531 A1