

(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 2024/230646 A1

(43) 国际公布日

2024 年 11 月 14 日 (14.11.2024)

(51) 国际专利分类号:

C07D 491/22 (2006.01) **A61P 35/00** (2006.01)
A61K 31/4745 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/091220

(22) 国际申请日: 2024 年 5 月 6 日 (06.05.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202310506357.6	2023 年 5 月 6 日 (06.05.2023)	CN
202311533730.3	2023 年 11 月 16 日 (16.11.2023)	CN
202410535444.9	2024 年 4 月 29 日 (29.04.2024)	CN

(71) 申请人: 上海齐鲁制药研究中心有限公司 (SHANGHAI QILU PHARMACEUTICAL RESEARCH AND DEVELOPMENT CENTRE LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 吕伟 (LV, Wei); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。金嵇煜 (JIN, Jiyu); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。金沉 (JIN, Chen); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。杨阳 (YANG, Yang); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。黄颖 (HUANG, Ying); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。陶维康 (TAO, Weikang); 中国上海市浦东新

区中国 (上海) 自由贸易试验区法拉第路 56 号李冰路 576 号 1 幢, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 北京英赛嘉华知识产权代理有限公司 (INSIGHT INTELLECTUAL PROPERTY LIMITED); 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, Beijing 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。

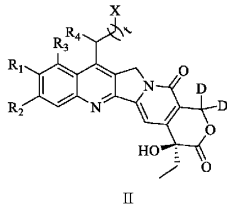
(84) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI,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

(54) Title: DEUTERATED CAMPTOTHECIN COMPOUND, AND PREPARATION THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种氘代喜树碱化合物及其制备和应用



(57) Abstract: Disclosed are a deuterated camptothecin compound as represented by formula II and a pharmaceutically acceptable salt thereof, a preparation method therefor, a pharmaceutical composition containing the deuterated camptothecin compound or a pharmaceutically acceptable salt thereof, and the use thereof in the treatment of tumor-related diseases. Such deuterated camptothecin compound has excellent drug activity and pharmacokinetic properties, and has reduced in-vivo toxicity and improved in-vivo safety.

(57) 摘要: 公开了一类由式 II 所示的氘代喜树碱化合物及其药学上可接受的盐、其制备方法、含有所述氘代喜树碱化合物或其药学上可接受的盐的药物组合物、以及它们在治疗肿瘤相关疾病中的用途。该类氘代喜树碱化合物具有优良的药物活性和药代动力学特性, 具有降低的体内毒性和改善的体内安全性。

WO 2024/230646 A1