

(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 2021/213288 A1

(43) 国际公布日
2021 年 10 月 28 日 (28.10.2021)

(51) 国际专利分类号:

C07D 487/04 (2006.01) A61K 31/53 (2006.01)
C07F 9/6561 (2006.01) A61K 31/685 (2006.01)
A61P 31/14 (2006.01) A61K 31/675 (2006.01)
A61P 31/16 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/087928

(22) 国际申请日: 2021 年 4 月 16 日 (16.04.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010313870.X 2020 年 4 月 20 日 (20.04.2020) CN
202010568329.3 2020 年 6 月 19 日 (19.06.2020) CN
202011035065.1 2020 年 9 月 27 日 (27.09.2020) CN

(71) 申请人: 中国科学院上海药物研究所(SHANGHAI INSTITUTE OF MATERIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF SCIENCES) [CN/CN]; 中

国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。中国科学院武汉病毒研究所(WUHAN INSTITUTE OF VIROLOGY, CHINESE ACADEMY OF SCIENCE) [CN/CN]; 中国湖北省武汉市武昌区水果湖街小洪山中区 44 号, Hubei 430071 (CN)。

(72) 发明人: 谢元超(XIE, Yuanchao); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。肖庚富(XIAO, Gengfu); 中国湖北省武汉市武昌区水果湖街小洪山中区 44 号, Hubei 430071 (CN)。何洋(HE, Yang); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。张磊珂(ZHANG, Leike); 中国湖北省武汉市武昌区水果湖街小洪山中区 44 号, Hubei 430071 (CN)。蒋华良(JIANG, Hualiang); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。沈敬

(54) Title: ANTIVIRAL APPLICATION OF NUCLEOSIDE ANALOG OR COMBINATION FORMULATION CONTAINING NUCLEOSIDE ANALOG

(54) 发明名称: 核苷类似物或含有核苷类似物的组合制剂在抗病毒中的应用

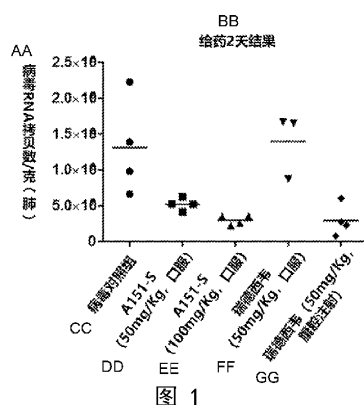


图 1

AA Viral RNA copy number/g (lung)
BB 2 day results of administration
CC Virus control group
DD A151-S (50 mg/Kg, oral administration)
EE A151-S (100 mg/Kg, oral administration)
FF Remdesivir (50 mg/Kg, oral administration)
GG Remdesivir (50 mg/Kg, intraperitoneal injection)

(57) Abstract: The present invention relates to an antiviral application of a nucleoside analog. Specifically, the present invention relates to uses of the nucleoside analog and a pharmaceutical composition thereof as: (a) inhibitors for inhibiting the replication of coronaviruses, influenza viruses, respiratory syncytial viruses, flaviviridae viruses, filoviridae viruses and/or porcine epidemic diarrhea virus (PEDV); and/or (b) medicines for treating and/or preventing and mitigating diseases caused by coronavirus, influenza virus, respiratory syncytial virus, flaviviridae virus, filoviridae virus and/or porcine epidemic diarrhea virus (PEDV) infections. The nucleoside analog according to the present invention may treat and/or prevent and mitigate respiratory infection, pneumonia (COVID-19) and other related diseases caused by the 2019 novel coronavirus infection.

(57) 摘要: 本发明涉及核苷类似物在抗病毒中的应用。具体而言, 本发明涉及核苷类似物及其药物组合物作为(a)抑制冠状病毒、流感病毒、呼吸道合胞病毒、黄病毒科病毒、丝状病毒科病毒和/或猪流行性腹泻病毒(PEDV)复制的抑制剂; 和/或(b)治疗和/或预防、缓解由冠状病毒、流感病毒、呼吸道合胞病毒、黄病毒科病毒、丝状病毒科病毒和/或猪流行性腹泻病毒(PEDV)感染引起的相关疾病的药物中的用途。本发明的核苷类似物可治疗和/或预防、缓解由2019新型冠状病毒感染引起的呼吸道感染、肺炎(COVID-19)等相关疾病。

[见续页]

WO 2021/213288 A1

山(SHEN, Jingshan): 中国上海市浦东张江祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 上海一平知识产权代理有限公司(XU & PARTNERS, LLC.); 中国上海市普陀区真北路958号天地科技广场1号楼106室, Shanghai 200333 (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, 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))。