(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

(43) 国际公布日
2011 年 5 月 5 日 (05.05.2011)

PCT

(10) 国际公布号
WO 2011/050739 A1

(51) 国际专利分类号:
A61K 9/107 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2010/078209

(22) 国际申请日: 2010 年 10 月 28 日 (28.10.2010)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
200910236959.4 2009 年 10 月 29 日 (29.10.2009) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): **中国医学科学院药物研究所 (INSTITUTE OF MATARIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF MEDICAL SCIENCES)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。

(72) 发明人; 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): **刘玉玲 (LIU, Yuling)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **夏学军 (Xia, Xuejun)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **郭瑞芳 (GUO, Ruifang)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **张鹏霄 (ZHANG, Pengxiao)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **韩锐 (HAN, Rui)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **付招娣 (FU, Zhaodi)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **周翠萍 (ZHOU, Cuiping)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **汪仁芸 (WANG, Renyun)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。 **金笃嘉 (JIN, Dujia)** [CN/CN]; 中国北京市宣武区先农坛街 1 号, Beijing 100050 (CN)。

(74) 代理人: **北京三高永信知识产权代理有限责任公司 (BEIJING SAN GAO YONG XIN INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY CO., LTD.)**; 中国北京市海淀区学院路蓟门里和景园 A-1-102, Beijing 100088 (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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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, 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: SUBMICRO EMULSION OF PACLITAXEL USING STEROID COMPLEX AS INTERMEDIATE CARRIER

(54) 发明名称 : 以类固醇复合物为中间载体的紫杉醇亚微乳

(57) Abstract: A submicro emulsion of paclitaxel, the preparation method and the use thereof are disclosed. Said submicro emulsion comprises a paclitaxel-steroid complex, oil for injection, water for injection, an emulsifier, a co-emulsifier and a isotonizing agent, wherein the mole ratio of paclitaxel to steroid in the complex is 1: 0.2-4, preferably 1: 0.25-2. Said submicro emulsion is useful for the treatment of malignant tumor. The particle size of the emulsion is less than 400 nm and the pH value is 3.5-6.

(57) 摘要:

一种紫杉醇亚微乳剂、其制备方法和用途。所述亚微乳剂包含紫杉醇类固醇复合物、注射用油、注射用水、乳化剂、助乳化剂和等渗剂，其中所述的紫杉醇类固醇复合物中紫杉醇与类固醇摩尔比为 1：0.2-4，优选 1：0.25-2。所述亚微乳剂用于恶性肿瘤治疗，其平均粒径在 400 nm 以下，pH 值为 3.5-6。

WO 2011/050739 A1