(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
2012 年 3 月 29 日 (29.03.2012)

PCT

(10) 国际公布号
WO 2012/037834 A1

(51) 国际专利分类号:
A61K 31/565 (2006.01) *A61K 47/40* (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01) *A61P 9/00* (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01) *A61P 25/00* (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2011/076968

(22) 国际申请日: 2011 年 7 月 8 日 (08.07.2011)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201010292234.X 2010 年 9 月 21 日 (21.09.2010) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): **中山大学 (SUN YAT-SEN UNIVERSITY)** [CN/CN]; 中国广东省广州市海珠区新港西路 135 号中山大学, Guangdong 510275 (CN)。

(72) 发明人; 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): **颜光美 (YAN, Guangmei)** [CN/CN]; 中国广东省广州市越秀中山二路 74 号中山大学北校区, Guangdong 510080 (CN)。 **胡海燕 (HU, Haiyan)** [CN/CN]; 中国广东省广州市越秀中山二路 74 号中山大学北校区, Guangdong 510080 (CN)。 **张静夏 (ZHANG, Jingxia)** [CN/CN]; 中国广东省广州市越秀中山二路 74 号中山大学北校区, Guangdong 510080 (CN)。 **邱鹏新 (QIU, Pengxin)** [CN/CN]; 中国广东省广州市越秀中山二路 74 号中山大学北校区, Guangdong 510080 (CN)。 **李玲 (LI, Ling)** [CN/CN]; 中国广东省广州市越秀中山二路 74 号中山大学北校区, Guangdong 510080 (CN)。 **田宁 (TIAN, Ning)** [CN/CN]; 中国广东省广州市越秀中山二路 74 号中山大学北校区, Guangdong 510080 (CN)。

(74) 代理人: **广州粤高专利商标代理有限公司 (YOGO PATENT & TRADEMARK AGENCY LIMITED COMPANY)**; 中国广东省广州市天河体育西路 191 号中石化大厦 B 塔 3912 室, Guangdong 510620 (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)。

根据细则 4.17 的声明:
— 发明人资格(细则 4.17(iv))

本国际公布:
— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

(54) **Title**: 5α-ANDROSTANE (ALKYL)-3β,5,6β-TRIOL INJECTION AND PREPARATION METHOD THEREFOR

(54) **发明名称**: 一种 5α-雄甾（烷）-3β，5，6β-三醇注射剂及其制备方法

(57) **Abstract**: A 5α-androstane (alkyl)-3β,5,6β-triol injection and preparation method therefor, the injection whereof using hydroxypropyl-β-cyclodextrin as a solubilizer and the active ingredient whereof being present preferably in a proportion by weight of 1-20:40-500 to the cyclodextrin. The injection may also comprise 1-100 parts of an isotonic regulator, 0-200 parts of a lyophilized filler, 0-2000 parts of a solvent. The preparation method comprises separately and successively dissolving the hydroxypropyl-β-cyclodextrin solution, the active ingredient and other soluble accessory ingredients in the water for injection, then after decolorization, depyrogenation, filtering, and sterilization of the filtrate, a liquid injection solution is obtained. Drying the filtrate yields a solid for injection.

(57) **摘要**:

一种 5α-雄甾烷-3β,5,6β-三醇注射剂及其制备方法，其中所述注射剂用羟丙基-β-环糊精作为增溶剂，所述活性成分与环糊精的重量份数比优选地为 1-20:40-500。该注射剂还可包括等渗调节剂 1-100 份，冻干填充剂 0-200 份，溶剂 0-2000 份。所述制备方法包括将羟丙基-β-环糊精溶液、活性成分和其它可溶性辅料按顺序分别溶解于注射用水中，经脱色去热源，过滤，滤液灭菌后制得液态注射剂，将滤液干燥后制得固态注射剂。

WO 2012/037834 A1