

(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 2021/249352 A1

(43) 国际公布日
2021 年 12 月 16 日 (16.12.2021) WIPO | PCT

(51) 国际专利分类号:

A61K 31/713 (2006.01) C12N 15/113 (2010.01)
A61P 31/20 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/098682

(22) 国际申请日: 2021 年 6 月 7 日 (07.06.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010524584.8 2020 年 6 月 10 日 (10.06.2020) CN
202010522407.6 2020 年 6 月 10 日 (10.06.2020) CN
202010529520.7 2020 年 6 月 11 日 (11.06.2020) CN
PCT/CN2020/133982

2020 年 12 月 4 日 (04.12.2020) CN
202011524835.9 2020 年 12 月 21 日 (21.12.2020) CN
202011524307.3 2020 年 12 月 21 日 (21.12.2020) CN

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)。

根据细则 4.17 的声明:

- 关于申请人有权申请并被授予专利(细则 4.17(ii))
- 关于申请人有权要求在先申请的优先权(细则 4.17(iii))
- 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))。
- 包括说明书序列表部分(细则 5.2(a))。

(71) 申请人: 正大天晴药业集团股份有限公司 (CHIA TAI TIANQING PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省连云港市郁州南路 369 号, Jiangsu 222062 (CN)。南京明德新药研发有限公司(MEDSHINE DISCOVERY INC.) [CN/CN]; 中国江苏省南京市江北新区高新路 9 号商务办公楼 218 室, Jiangsu 210032 (CN)。

(72) 发明人: 安可 (AN, Ke); 中国上海市浦东新区富特中路 288 号, Shanghai 200131 (CN)。孙飞 (SUN, Fei); 中国上海市浦东新区富特中路 288 号, Shanghai 200131 (CN)。丁照中 (DING, Charles Z.); 中国上海市浦东新区富特中路 288 号, Shanghai 200131 (CN)。陈曙辉 (CHEN, Shuhui); 中国上海市浦东新区富特中路 288 号, Shanghai 200131 (CN)。

(74) 代理人: 上海弼兴律师事务所 (SHANGHAI BESHINING LAW OFFICE); 中国上海市小木桥路 681 号外经大厦 21 楼, Shanghai 200032 (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,

(54) Title: CONJUGATE OF DOUBLE-STRANDED siRNA ANALOGUE

(54) 发明名称: 双链 siRNA 类似物的缀合物

(57) Abstract: Provided are a double-stranded siRNA analogue embedded with a ribavirin derivative, a conjugate containing same, and a salt and the use thereof. The provided double-stranded siRNA analogue, the conjugate containing same and the salt thereof can effectively inhibit multiple viral indicators such as hepatitis B virus DNA, pgRNA, S antigen, and E antigen, which provide an effective and feasible method for treating hepatitis B.

(57) 摘要: 提供了一种利巴韦林衍生物嵌入的双链 siRNA 类似物、包含其的缀合物, 以及其盐和用途。提供的双链 siRNA 类似物、包含其的缀合物以及其盐可以有效抑制乙型肝炎病毒 DNA、pgRNA、S 抗原、E 抗原等多项病毒指标, 为乙型肝炎的治疗提供了有效可行的方法。

WO 2021/249352 A1