

(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 2021/249228 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 47/50 (2017.01) C07K 7/06 (2006.01)
C07K 16/30 (2006.01) A61K 31/4745 (2006.01)
C07K 16/32 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/097302

(22) 国际申请日: 2021 年 5 月 31 日 (31.05.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010510363.5 2020 年 6 月 8 日 (08.06.2020) CN

(71) 申请人: 四川百利药业有限责任公司(SICHUAN BAILI PHARM CO., LTD.) [CN/CN]; 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。成都多特抗体药物有限责任公司(CHENGDU DUOTE ANTIBODY PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区百利路161号1栋胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。

(72) 发明人: 朱义(ZHU, Yi); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan

611130 (CN)。万维李(WAN, Weili); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。卓识(ZHUO, Shi); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区百利路161号1栋胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。张勇(ZHANG, Yong); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。张宜英(ZHANG, Yiyang); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。于天姿(YU, Tianzi); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。李刚锐(LI, Gangrui); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (CN)。杨秀娟(YANG, Xiujuan); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园区胡常娜, Sichuan 611130 (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,

(54) Title: CAMPTOTHECIN DRUG HAVING HIGH-STABILITY HYDROPHILIC CONNECTING UNIT AND CONJUGATE THEREOF

(54) 发明名称: 一种带有高稳定性亲水连接单元的喜树碱类药物及其偶联物

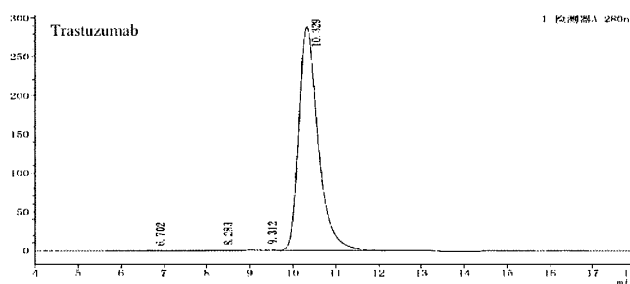


图 1A.

(57) Abstract: A camptothecin drug having a high-stability hydrophilic connecting unit, and a conjugate or pharmaceutically acceptable salt thereof, and a preparation method therefor and an application thereof in the prevention or treatment of cancer. The conjugate can specifically bind to a receptor highly expressed in tumor cells. The camptothecin drug has good water solubility, stability and uniformity, and can be used for preventing or treating diseases such as tumors.

(57) 摘要: 一种带有高稳定性亲水连接单元的喜树碱类药物及其偶联物或其药学上可接受的盐, 包括其制备方法和在预防或治疗癌症中的作用。所述偶联物能够特异性地结合肿瘤细胞中高表达的受体。具有良好的水溶性, 稳定性及均一性, 可用于预防或治疗肿瘤等疾病。

[见续页]

WO 2021/249228 A1

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))。