(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
2008 年7 月10 日 (10.07.2008)

PCT

(10) 国际公布号
WO 2008/080367 A1

(51) 国际专利分类号:
A61K 9/127 (2006.01) *A61K 31/4375* (2006.01)
A61K 31/136 (2006.01) *A61K 47/24* (2006.01)
A61K 31/475 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2007/071403

(22) 国际申请日: 2007 年12 月29 日 (29.12.2007)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
200610102339.8
2006 年12 月29 日 (29.12.2006) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): **石药集团中奇制药技术 (石家庄) 有限公司(SHIJIAZHUANG PHARMA. GROUP ZHONGQI PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY (SHIJIAZHUANG) CO., LTD.)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。

(72) 发明人; 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): **李春雷(LI, Chunlei)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **王金戌(WANG, Jinxu)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **王彩霞(WANG, Caixia)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **李彦辉(LI, Yanhui)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **申东民(SHEN, Dongmin)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **郭文敏(GUO, Wenmin)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **张莉(ZHANG, Li)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。 **张兰(ZHANG, Lan)** [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。

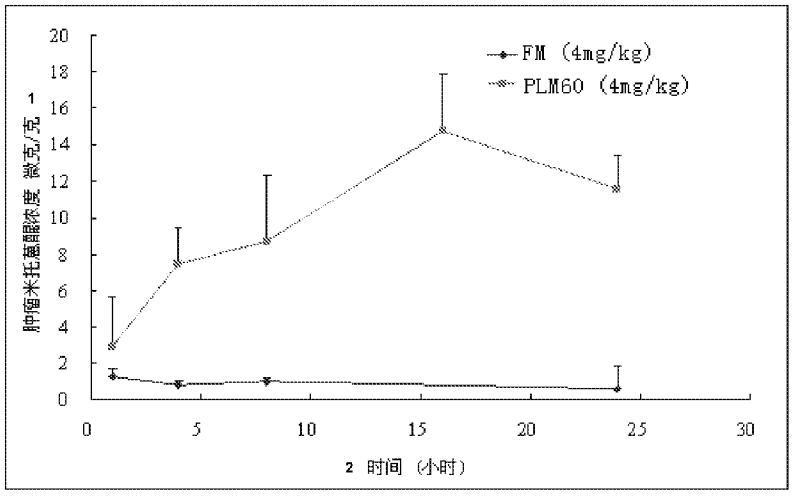
(74) 代理人: **北京集佳知识产权代理有限公司(UNITALEN ATTORNEYS AT LAW)**; 中国北京市朝阳区建国门外大街22号赛特广场7层, Beijing 100004 (CN)。

(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, 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,

[见续页]

(54) **Title:** LIPOSOME FORMULATION AND PROCESS FOR PREPARATION THEREOF

(54) **发明名称:** 一种脂质体药物制剂及其制备方法



1 ... PLASMA CONCENTRATION OF MITOXANTRONE (µg/ml)
2 ... TIME (h)

(57) **Abstract:** A liposomal pharmaceutical formulation comprising multivalent ionic drug, a process for the preparation thereof, and the use thereof in the treatment of diseases, wherein the particle size of the liposome is about 30-80 nm, and the phospholipid bilayer contains a phospholipid with Tm > body temperature thereby the phase transition of the liposome is above body temperature.

[见续页]

WO 2008/080367 A1

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, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, 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, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, 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。

(57) 摘要：

一种包含多价离子药物的脂质体药物制剂、所述脂质体药物制剂的制备方法及其在疾病治疗中的应用，其中脂质体的粒度为约 30－80nm，并且磷脂双分子层中含有 Tm 高于体温的磷脂，从而使脂质体的相转变温度高于体温。