

(19) 中华人民共和国

产



(12) 发明专利

(10) 公告号 CN 10766 626 B

(45) 公告 2020.04.2

(21) 号 201710782782.2

(22) 2017.09.03

(65) 同一 公 号
公 号 CN 107669626 A

(43) 公 2018.02.09

(73) 专利 人
地址 453007
46

(72) 发 人

(74) 专利代
代 人 () 41139

(54) 发 名

(57)

(51) Int.Cl.

A61K 9/107(2006.01)

A61K 47/34(2017.01)

A61K 47/10(2006.01)

A61K 31/4745(2006.01)

A61P 35/00(2006.01)

C07D 519/00(2006.01)

A61K 47/55(2017.01)

(56) 件

CN 101961494 A, 2011.02.02,

US 2013266508 A1, 2013.10.10,

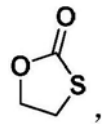
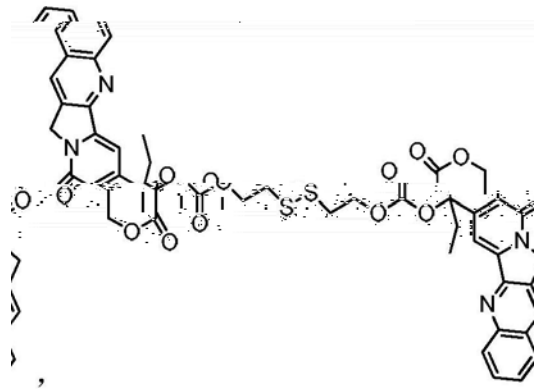
CN 107375238 A, 2017.11.24,

员

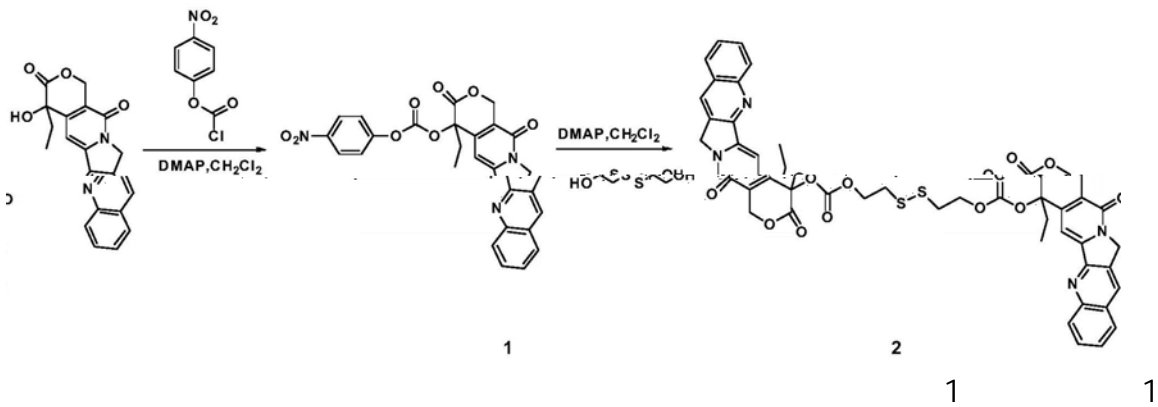
利 书2 书4 2

2,2

1.
2,2-



6000-11000



2,2-

4- 1 4- 1 2,2- 2h

1 2,2-

48h 2. 1

3. 1

mPEG

12.6wt

4.	3	
		14000
5.	1-4	

— 原 传 制备 及其

域

[0001]

[0002]

(Camptothecin CPT)

10-

Pol y(ethyl enegly col)-b-pol y(caprol actone) (PEG-b-PCL)

PEG-b-PCL

(DTT)

10

发 内

[0003]

1

12.6

[0004]

2,2-
(CPT-SS-CPT)

-

(mPEG-b-PCL)

[0005]

[0017]	1							
			1	12.6				
[0018]	2							-
[0019]	3							

图

[0020]	1	2
[0021]	2	5

具体

[0022]

[0023] 1
 [0024] 100mL 0.5g (1.44mmol) 0.29g
 0.39g DMAP 25mL CH₂Cl₂ Ar 2h 25mL 3
 MgSO₄ 1

[0025] 2
 [0026] 1 25mL CH₂Cl₂ 92.5mg
 2.5mL THF 7.5mL CH₂Cl₂ Ar 48h
 (CH₃OH/CH₂Cl₂) 0.23g 35.5

[0027] ¹H NMR(600MHz, CDCl₃) 8.39(s, 1H), 8.18(d, 1H), 7.93(d, 1H), 7.82(t, 1H), 7.66(t, 1H), 5.76(d, 1H), 5.41-5.18(m 1H), 5.46-5.14(m 1H), 4.00(d, 1H), 2.81(d, 1H), 2.23(d, 1H), 2.09(d, 1H), 0.97(t, 1H). ESI-MS for C₄₆H₃₈N₄O₁₂S₂[MH⁺] [MNa⁺] cal cd: 902.1928, found: 903.2006 925.1786

[0028] 3



[0030] 0.464g mPEG 0.204g CL2%Sn(Oct)₂ 38
 1Pa 140 70h THF
 MW 14000 48h
 mPEG-b-PCL

[0031] ¹H NMR(400MHz, CDCl₃) 4.05(t, 1H), 3.64(s, 17H), 3.37(s, 1H), 2.39-2.23(m

1H), 1.71-1.57(m, 2H), 1.45-1.30(m, 1H)

[0032] 4

[0033] 100mg 30min mPEG-b-PCL 20mg (MW 3500) 10mL DMF 24h 4h
CPT-SS-CPT

[0034] 5

[0035] 5mg 3mL 0.1M pH 7.4
(MW 3500) 20mL 10mM DTT 37
3mL

[0036]

