



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 102428093 A

(43) 申请公布日 2012. 04. 25

(21) 申请号 201080017964. 7

(22) 申请日 2010. 03. 25

(66) 本国优先权数据

200910020716. 7 2009. 04. 21 CN

(85) PCT申请进入国家阶段日

2011. 10. 21

(86) PCT申请的申请数据

PCT/CN2010/000372 2010. 03. 25

(87) PCT申请的公布数据

W02010/121486 ZH 2010. 10. 28

(71) 申请人 济南圣鲁金药物技术开发有限公司

地址 250100 中国山东省济南市经十路

18877 号综合楼 5 层

(72) 发明人 薛晓霞 李刚 孙昌俊 李文保

(74) 专利代理机构 北京万慧达知识产权代理有限公司 11111

代理人 杨颖 张一军

(51) Int. Cl.

C07H 19/073 (2006. 01)

A61P 35/00 (2006. 01)

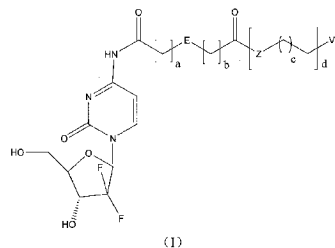
A61K 31/7068 (2006. 01)

(54) 发明名称

基于吉西他滨结构的前药及其合成方法及应用

(57) 摘要

本发明公开如式 (I) 所示的基于吉西他滨结构的前药及其合成方法和应用, 其中 a、b、c、d、E、Z、V 基团定义如本申请说明书中所定义。本发明通过 N⁴位修饰增加前药的溶解度、生物利用度以及器官特异性, 所生成的前药化合物可以克服代谢快的问题, 降低吉西他滨引发的肠毒性, 使之在临床上能用于口服, 以及能更好地改善抗肿瘤、抗癌、抗感染和防扩散能力, 并能够特异性地作用于肝脏或结肠。合成方法步骤简单, 适宜工业化生



(I)