(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2021 년 3 월 18 일 (18.03.2021)

WIPO | PCT

(10) 국제공개번호
WO 2021/049850 A3

(51) 국제특허분류:
A61K 47/54 (2017.01) *A61K 31/7068* (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) *A61K 33/243* (2019.01)
A61K 31/704 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)

(21) 국제출원번호: PCT/KR2020/012111

(22) 국제출원일: 2020 년 9 월 8 일 (08.09.2020)

(25) 출원언어: 한국어

(26) 공개언어: 한국어

(30) 우선권정보:
10-2019-0112020 2019 년 9 월 10 일 (10.09.2019) KR

(71) 출원인: 고려대학교 산학협력단 (**KOREA UNIVERSITY RESEARCH AND BUSINESS FOUNDATION**) [KR/KR]; 02841 서울시 성북구 안암로 145, Seoul (KR).

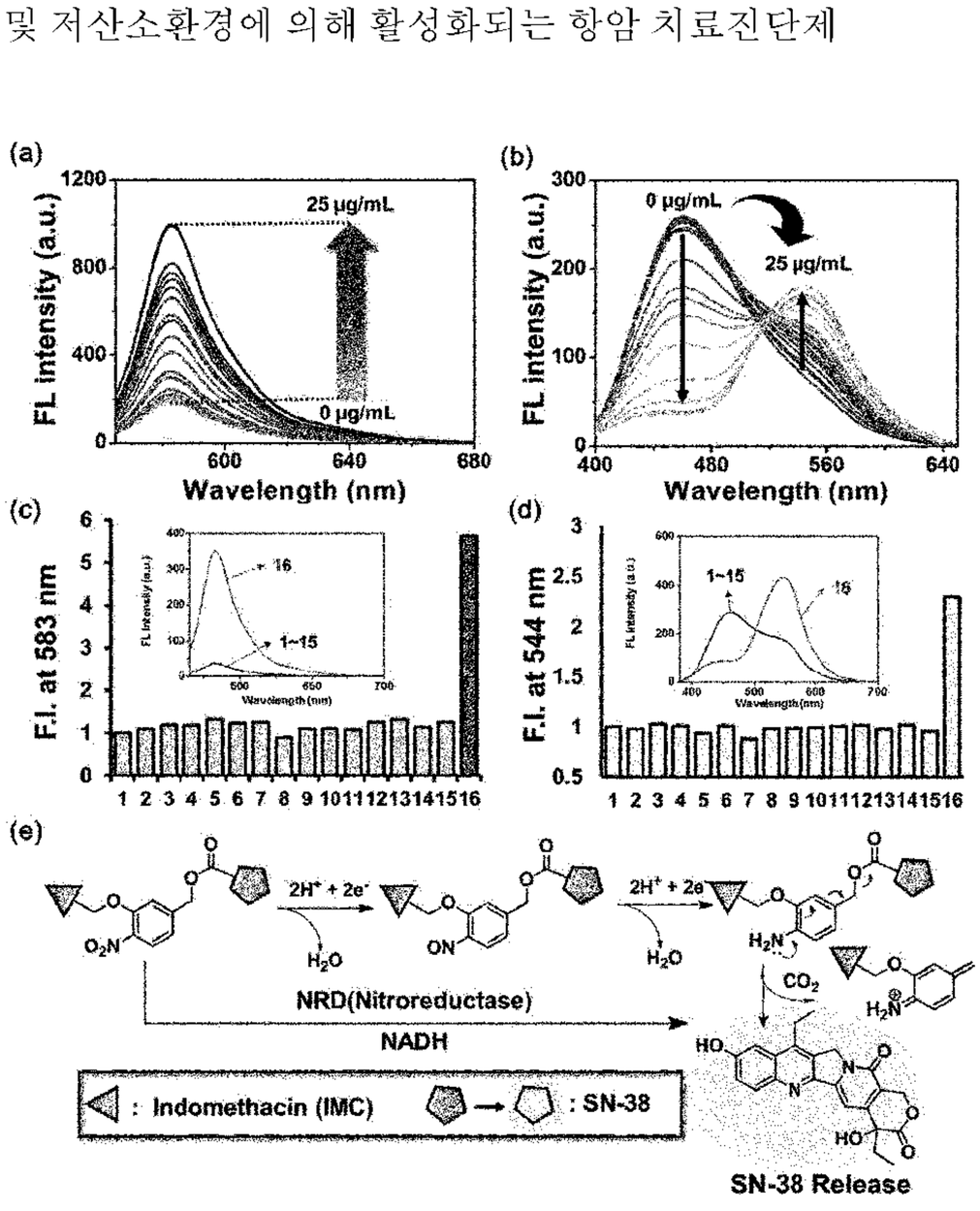
(72) 발명자: 김종승 (**KIM, Jong Seung**); 02841 서울시 성북구 안암로 145, Seoul (KR). 김형석 (**KIM, Hyeong Seok**); 02841 서울시 성북구 안암로 145, Seoul (KR). 한지유 (**HAN, Ji You**); 02841 서울시 성북구 안암로 145, Seoul (KR). 샤르마아밋 (**SHARMA, Amit**); 02843 서울시 성북구 고려대로 45, 202호, Seoul (KR). 임문수 (**REN, Wen Xiu**); 04775 서울시 성북구 둘레9나길 26-7, 102호, Seoul (KR).

(74) 대리인: 정은열 등 (**JUNG, Eun Youl** et al.); 06149 서울시 강남구 테헤란로55길 21, 402호 (정앤김 특허법률사무소), Seoul (KR).

(81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): 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, 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,

(54) **Title:** ANTICANCER THERANOSTIC AGENT ACTIVATED BY ANTI-ANGIOGENESIS AND HYPOXIC ENVIRONMENT

(54) **발명의 명칭:** 혈관신생억제 및 저산소환경에 의해 활성화되는 항암 치료진단제



(57) **Abstract:** The present invention relates to an anticancer theranostic agent that is activated by anti-angiogenesis and a hypoxic environment. The anticancer theranostic agent according to the present invention exhibits an anti-angiogenesis effect through COX-2 inhibition as well as enhanced drug activity in hypoxia and thus, can effectively achieve tumor targeting, diagnosis, and precursor drug delivery to a tumor site.

(57) **요약서:** 본 발명은 혈관신생억제 및 저산소환경에 의해 활성화되는 항암 치료진단제에 관한 것이다. 본 발명에 따른 항암 치료진단제는 COX-2 억제를 통해 항-혈관신생 효과를 나타낼 뿐만 아니라 저산소증에서 향상된 약물 활성을 나타내는바, 종양 표적화, 진단 및 종양 부위로의 전구체 약물 전달을 효과적으로 달성할 수 있다.

[다음 쪽 계속]

WO 2021/049850 A3

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) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 유럽 (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).

규칙 4.17에 의한 선언서:

— 신규성을 해치지 아니하는 개시 또는 신규성 상실의 예외에 관한 선언 (규칙 4.17(v))

공개:

— 국제조사보고서와 함께 (조약 제21조(3))

(88) 국제조사보고서 공개일:

2021 년 5 월 6 일 (06.05.2021)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/KR2020/012111

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A61K 47/54(2017.01)i; **A61K 31/437**(2006.01)i; **A61K 31/704**(2006.01)i; **A61K 31/7068**(2006.01)i; **A61K 33/243**(2019.01)i; **A61P 35/00**(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A61K 47/54(2017.01); A61K 31/192(2006.01); A61K 31/437(2006.01); A61K 47/50(2017.01)

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Korean utility models and applications for utility models: IPC as above
Japanese utility models and applications for utility models: IPC as above

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

eKOMPASS (KIPO internal) & keywords: 혈관신생억제제(angiogenesis inhibitor), COX-2 억제제(COX-2 inhibitor), 항암(anti-cancer), 저산소증(hypoxia)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	SHARMA, A. et al. Hypoxia-targeted drug delivery. Chemical Society Reviews. February 2019, vol. 48, no. 3, pp. 771-813 (HHS Public Access Author Manuscript Version inner pp. 1-90). See abstract; figure 14; and page 21.	1-8
X Y	KUMAR, R. et al. Hypoxia-directed and activated theranostic agent: Imaging and treatment of solid tumor. Biomaterials. 2016, vol. 104, pp. 119-128. See abstract; figures 1-2; and pages 123-124 and 127.	1,7 2-6
Y	KR 10-2018-0091220 A (KOREA UNIVERSITY RESEARCH AND BUSINESS FOUNDATION) 16 August 2018 (2018-08-16) See abstract; and claim 1.	2-6
Y	KR 10-1990214 B1 (KOREA UNIVERSITY RESEARCH AND BUSINESS FOUNDATION) 17 June 2019 (2019-06-17) See abstract; and claims 1-6.	2-6

☑ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☑ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"D" document cited by the applicant in the international application
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
15 February 2021	**15 February 2021**
Name and mailing address of the ISA/KR **Korean Intellectual Property Office** **Government Complex-Daejeon Building 4, 189 Cheongsa-ro, Seo-gu, Daejeon 35208** Facsimile No. **+82-42-481-8578**	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/KR2020/012111

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	ZHOU, Y. et al. Azo-based small molecular hypoxia responsive theranostic for tumor-specific imaging and therapy. Journal of Controlled Release. 2018, vol. 288, pp. 14-22. See abstract; scheme 1; and pages 16-17.	1-8
X	KIM, H. S. et al. COX-2 Inhibition mediated anti-angiogenic activatable prodrug potentiates cancer therapy in preclinical models. Biomaterials. 10 September 2018, vol. 185, pp. 63-72. See abstract; and pages 65-68 and 71. * This document is a known document declaring exceptions to lack of novelty by the applicant.	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/KR2020/012111

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
KR 10-2018-0091220 A	16 August 2018	KR 10-1949576 B1	18 February 2019
KR 10-1990214 B1	17 June 2019	None	

국 제 조 사 보 고 서

국제출원번호

PCT/KR2020/012111

A. 발명이 속하는 기술분류(국제특허분류(IPC))

A61K 47/54(2017.01)i; **A61K 31/437**(2006.01)i; **A61K 31/704**(2006.01)i; **A61K 31/7068**(2006.01)i; **A61K 33/243**(2019.01)i; **A61P 35/00**(2006.01)i

B. 조사된 분야

조사된 최소문헌(국제특허분류를 기재)

A61K 47/54(2017.01); A61K 31/192(2006.01); A61K 31/437(2006.01); A61K 47/50(2017.01)

조사된 기술분야에 속하는 최소문헌 이외의 문헌

한국등록실용신안공보 및 한국공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC
일본등록실용신안공보 및 일본공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC

국제조사에 이용된 전산 데이터베이스(데이터베이스의 명칭 및 검색어(해당하는 경우))

eKOMPASS(특허청 내부 검색시스템) & 키워드: 혈관신생억제제(angiogenesis inhibitor), COX-2 억제제(COX-2 inhibitor), 항암(anti-cancer), 저산소증(hypoxia)

C. 관련 문헌

카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
X	SHARMA, A. 등, Hypoxia-targeted drug delivery, Chemical Society Reviews, 2019.02, 48권, 3호, 페이지 771-813 (HHS Public Access Author Manuscript Version 내부 페이지 1-90) 초록; 도면 14; 페이지 21	1-8
X Y	KUMAR, R. 등, Hypoxia-directed and activated theranostic agent: Imaging and treatment of solid tumor, Biomaterials, 2016, 104권, 페이지 119-128 초록; 도면 1-2; 페이지 123-124, 127	1,7 2-6
Y	KR 10-2018-0091220 A (고려대학교 산학협력단) 2018.08.16 요약; 청구항 1	2-6
Y	KR 10-1990214 B1 (고려대학교 산학협력단) 2019.06.17 요약; 청구항 1-6	2-6
A	ZHOU, Y. 등, Azo-based small molecular hypoxia responsive theranostic for tumor-specific imaging and therapy, Journal of Controlled Release, 2018, 288권, 페이지 14-22 초록; scheme 1; 페이지 16-17	1-8

☑ 추가 문헌이 C(계속)에 기재되어 있습니다.

☑ 대응특허에 관한 별지를 참조하십시오.

* 인용된 문헌의 특별 카테고리:

"A" 특별히 관련이 없는 것으로 보이는 일반적인 기술수준을 정의한 문헌

"D" 본 국제출원에서 출원인이 인용한 문헌

"E" 국제출원일보다 빠른 출원일 또는 우선일을 가지나 국제출원일 이후에 공개된 선출원 또는 특허 문헌

"L" 우선권 주장에 의문을 제기하는 문헌 또는 다른 인용문헌의 공개일 또는 다른 특별한 이유(이유를 명시)를 밝히기 위하여 인용된 문헌

"O" 구두 개시, 사용, 전시 또는 기타 수단을 언급하고 있는 문헌

"P" 우선일 이후에 공개되었으나 국제출원일 이전에 공개된 문헌

"T" 국제출원일 또는 우선일 후에 공개된 문헌으로, 출원과 상충하지 않으며 발명의 기초가 되는 원리나 이론을 이해하기 위해 인용된 문헌

"X" 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌 하나만으로 청구된 발명의 신규성 또는 진보성이 없는 것으로 본다.

"Y" 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌이 하나 이상의 다른 문헌과 조합하는 경우로 그 조합이 당업자에게 자명한 경우 청구된 발명은 진보성이 없는 것으로 본다.

"&" 동일한 대응특허문헌에 속하는 문헌

국제조사의 실제 완료일	국제조사보고서 발송일
2021년02월15일(15.02.2021)	**2021년02월15일(15.02.2021)**

ISA/KR의 명칭 및 우편주소

대한민국 특허청
(35208) 대전광역시 서구 청사로 189, 4동 (둔산동, 정부대전청사)

팩스 번호 **+82-42-481-8578**

심사관

정다원

전화번호 **+82-42-481-5373**

국 제 조 사 보 고 서

국제출원번호

PCT/KR2020/012111

C. 관련 문헌

카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
X	KIM, H. S. 등, COX-2 Inhibition mediated anti-angiogenic activatable prodrug potentiates cancer therapy in preclinical models, Biomaterials, 2018.09.10, 185권, 페이지 63-72 초록; 페이지 65-68, 71 * 위 문헌은 출원인이 신규성 상실의 예외로서 선언한 공지문헌임.	1-8

국 제 조 사 보 고 서
대응특허에 관한 정보

국제출원번호
PCT/KR2020/012111

국제조사보고서에서 인용된 특허문헌	공개일	대응특허문헌	공개일
KR 10-2018-0091220 A	2018/08/16	KR 10-1949576 B1	2019/02/18
KR 10-1990214 B1	2019/06/17	없음	