

(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
2023 年 6 月 8 日 (08.06.2023)



(10) 国际公布号
WO 2023/098920 A1

(51) 国际专利分类号:
C07K 7/64 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)
C07K 1/04 (2006.01) A61P 9/10 (2006.01)
A61K 38/08 (2019.01) A61P 17/02 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/137823

(22) 国际申请日: 2022 年 12 月 9 日 (09.12.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202211201081.2 2022 年 9 月 29 日 (29.09.2022) CN

(71) 申请人: 烟台蓝纳成生物技术有限公司 (YANTAI LANNACHENG BIOTECHNOLOGY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。

(72) 发明人: 陈小元 (CHEN, Xiaoyuan); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。 徐鹏飞 (XU, Pengfei); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。 吴晓明 (WU, Xiaoming); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。 郭志德 (GUO, Zhide); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。 杨清宝 (YANG, Qingbao); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。 文雪君 (WEN, Xuejun); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路 500 号 52 号楼 101 号, Shandong 264199 (CN)。

(74) 代理人: 北京兆君联合知识产权代理事务所 (普通合伙) (BEIJING ZHAOJUN UNION INTELLECTUAL PROPERTY LAW FIRM); 中国

(54) Title: DUAL-TARGETING COMPOUND, AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种双重靶向化合物及其制备方法和应用

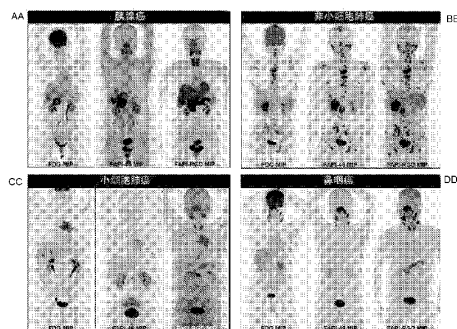
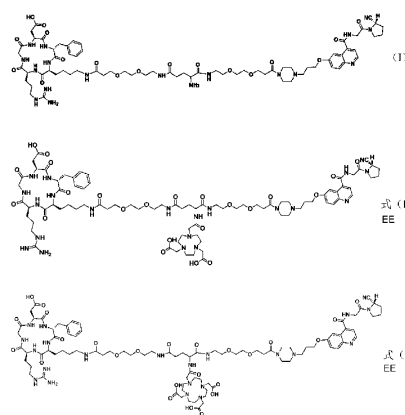


图 16

AA Pancreatic cancer
BB Non-small cell lung cancer
CC Small cell lung cancer
DD Nasopharyngeal cancer
EE Formula



(57) Abstract: A dual-targeting compound, and a preparation method therefor and the use thereof, which relate to the fields of nuclear medicine and molecular imaging. A radionuclide-labeled dual-targeting compound, having a structure as shown in formula (I-1) or formula (I-2). The dual-targeting compound has a high affinity to both an FAP target and an integrin $\alpha_v\beta_3$ target, can synergistically target the FAP target and the integrin $\alpha_v\beta_3$ target in tumors, and exhibits a high uptake and a long retention time in tumors. Provided are a radionuclide-labeled dual-targeting compound based on the dual-targeting compound, and a preparation method therefor and the use thereof in the preparation of a drug for diagnosing and treating diseases characterized by overexpression of FAP and/or integrin $\alpha_v\beta_3$.

[见续页]

北京市昌平区西环南路钰阳商业楼A单元2层, Beijing 102200 (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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, 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, CV, 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, ME, 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)。

根据细则4.17的声明:

- 发明人资格(细则4.17(iv))

本国际公布:

- 包括国际检索报告(条约第21条(3))。
- 在修改权利要求的期限届满之前进行, 在收到该修改后将重新公布(细则48.2(h))。
- 根据申请人的请求, 在条约第21条(2)(a)所规定的期限届满之前进行。

(57) 摘要: 一种双重靶向化合物及其制备方法和应用, 涉及核医学与分子影像学领域。一种被放射性核素标记的双重靶向化合物, 其结构如下式(I-1)或式(I-2)所示。所述的双重靶向化合物, 对于FAP靶点及整合素 $\alpha_v\beta_3$ 靶点均具有较高的亲和力, 能够协同靶向肿瘤中的FAP靶点及整合素 $\alpha_v\beta_3$ 靶点, 表现出较高的肿瘤摄取和肿瘤滞留时间。提供基于所述双重靶向化合物的放射性核素标记的双重靶向化合物, 及其制备方法和在制备诊断和治疗以FAP和/或整合素 $\alpha_v\beta_3$ 过度表达为特征的疾病的药物中的应用。