

(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
2022 年 9 月 9 日 (09.09.2022)

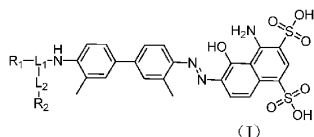


(10) 国际公布号
WO 2022/183993 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07K 5/062 (2006.01) *C07K 1/13* (2006.01)
C07K 7/02 (2006.01) *A61K 51/08* (2006.01)
C07K 1/06 (2006.01) *A61K 45/06* (2006.01)
C07K 1/107 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2022/078129
- (22) 国际申请日: 2022 年 2 月 27 日 (27.02.2022)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
202110225558.X 2021 年 3 月 1 日 (01.03.2021) 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
- (72) 发明人: 陈小元 (CHEN, Xiaoyuan); 中国上海市自由贸易试验区临港新片区新杨公路 860 号 10 幢, Shanghai 201208 (CN)。徐鹏飞 (XU, Pengfei); 中国上海市自由贸易试验区临港新片区新杨公路 860 号 10 幢, Shanghai 201208 (CN)。
- (74) 代理人: 北京兆君联合知识产权代理有限公司 (普通合伙) (BEIJING ZHAOJUN UNION INTELLECTUAL PROPERTY LAW FIRM); 中国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, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,

(54) Title: COMPOUND TARGETING PROSTATE SPECIFIC MEMBRANE ANTIGEN, AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种前列腺特异性膜抗原靶向化合物及其制备方法和应用



(57) Abstract: Provided is a compound targeting a prostate specific membrane antigen (PSMA). The compound has a structure as represented by formula (I), wherein R_1 is a compound targeting a prostate specific membrane antigen; L_1 is $-(X)_n-(CH_2)_m-(Y)_q-$, wherein X and Y are independently selected from lysine, glutamic acid or a derivative structure containing lysine and glutamic acid, n is an integer from 0 to 12, m is an integer from 0 to 60, q is an integer from 0 to 12, and each CH_2 can be individually replaced with $-O-$, $-NH(CO)-$ or $-(CO)-NH-$; L_2 is $-(CH_2)_p-$, wherein p is an integer from 0 to 30, each CH_2 can be individually replaced with $-O-$, $-NH(CO)-$, or $-(CO)-NH-$; and R_2 is a nuclide chelating group. Further provided is a radioactive marker on the basis of the structure of the compound. The compound and the radioactive marker have a suitable blood circulation time and relatively high tumor assimilation and retention time, and are suitable for use in nuclide treatment and imaging of tumors with high expression of PSMA.

(57) 摘要: 一种前列腺特异性膜抗原(PSMA)靶向化合物, 其结构如式(I); R_1 为前列腺特异性膜抗原靶向化合物; L_1 为 $-(X)_n-(CH_2)_m-(Y)_q-$, 其中 X 和 Y 独立的选自赖氨酸、谷氨酸或者含有赖氨酸及谷氨酸的衍生结构, n 是 0 至 12 的整数, m 是 0 至 60 的整数, q 是 0 至 12 的整数, 其中每个 CH_2 可以单独地用 $-O-$ 、 $-NH(CO)-$ 或 $-(CO)-NH-$ 替换; L_2 是 $-(CH_2)_p-$, 其中 p 是 0 至 30 的整数, 其中每个 CH_2 可以单独地用 $-O-$ 、 $-NH(CO)-$ 或 $-(CO)-NH-$ 替换; R_2 是核素螯合基团。还提供基于所述化合物结构的放射性标记物, 所述的化合物及放射性标记物具有适宜的血液循环时间、较高的肿瘤摄取和保留时间, 适合用作 PSMA 高表达肿瘤的核素治疗和显像。

WO 2022/183993 A1

[见续页]

GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, 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, 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, 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, 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:

- 关于申请人有权要求在先申请的优先权 (细则4.17(iii))
- 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))。