

(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



(10) 国际公布号
WO 2025/060375 A1

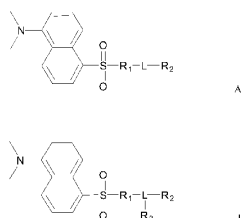
(43) 国际公布日
2025 年 3 月 27 日 (27.03.2025)

- (51) 国际专利分类号:
C07K 7/06 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07C 311/42 (2006.01) *A61K 31/198* (2006.01)
C07C 303/40 (2006.01) *C07K 1/13* (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2024/083379
- (22) 国际申请日: 2024 年 3 月 22 日 (22.03.2024)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
202311212336.X 2023年9月20日 (20.09.2023) 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)。

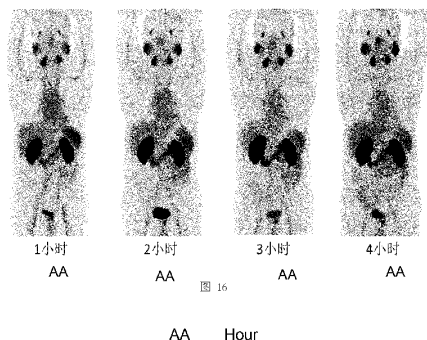
(72) 发明人: 陈小元 (CHEN, Xiaoyuan); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路500号52号楼101号, Shandong 264199 (CN)。杨鸿章 (YANG, Hongzhang); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路500号52号楼101号, Shandong 264199 (CN)。周子健 (ZHOU, Zijian); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路500号52号楼101号, Shandong 264199 (CN)。舒林林 (SHU, Linlin); 中国山东省烟台市牟平区滨海东路500号52号楼101号, Shandong 264199 (CN)。文雪君 (WEN, 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)。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)。张静静 (ZHANG, Jingjing); 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)。

(54) Title: DANSYLAMIDE-MODIFIED COMPOUNDS TARGETING PSMA, PREPARATION METHOD THEREFOR, AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 丹磺酰胺修饰的PSMA靶向化合物及其制备方法和应用



(57) Abstract: Provided are dansylamide-modified compounds targeting PSMA, of which the structure is represented by formula A or formula I, wherein R_1 is an amino acid analogue structure, R_2 is a compound structure targeting the prostate-specific membrane antigen, R_3 is a nuclide chelating group, and L is $-(X)_n-(CH_2)_m-(Y)_q-$, X and Y being independently selected from lysine, glutamic acid or derivative structures containing lysine or glutamic acid, n being an integer from 0 to 10, m being an integer from 0 to 20, q being an integer from 0 to 6, and each CH_2 being independently replaceable with $-OCH_2-$, $-NH(CO)-$, or $-(CO)-NH-$. Also provided is a radionuclide marker based on the compound structure. The compounds and the radionuclide marker have high tumor uptake and retention times and therefore are suitable for radionuclide therapy and imaging of tumors highly-expressing PSMA.



(57) 摘要: 提供一种丹磺酰胺修饰的PSMA靶向化合物, 其结构如式A或式I所示; 其中 R_1 为氨基酸类似物结构; R_2 为前列腺特异性膜抗原靶向化合物结构; R_3 是核素螯合基团; L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或谷氨酸的衍生结构, n是0至10的整数, m是0至20的整数, q是0至6的整数, 其中每个 CH_2 可单独地用 $-OCH_2-$ 、 $-NH(CO)-$ 或 $-(CO)-NH-$ 替换。还提供基于所述化合物结构的放射性核素标记物。所述的化合物及放射性核素标记物具有较高的肿瘤摄取和保留时间, 适合作为PSMA高表达肿瘤的核素治疗和显像。

[见续页]

(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, MU, 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, SC, 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))。