

(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국



(10) 국제공개번호

WO 2019/190266 A1

2019 년 10 월 3 일 (03.10.2019) WIPO | PCT

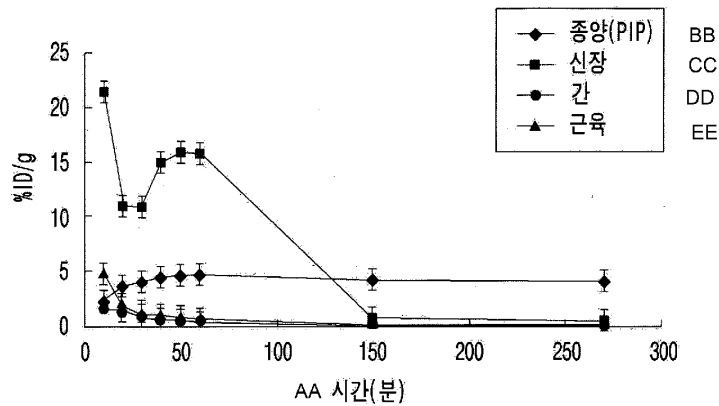
- (51) 국제특허분류:
C07D 403/12 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 51/04 (2006.01)
- (21) 국제출원번호: PCT/KR2019/003716
- (22) 국제출원일: 2019 년 3 월 29 일 (29.03.2019)
- (25) 출원언어: 한국어
- (26) 공개언어: 한국어
- (30) 우선권정보:
10-2018-0037226 2018 년 3 월 30 일 (30.03.2018) KR
- (71) 출원인: (주)퓨처켄 (FUTURECHEM CO., LTD) [KR/
KR]; 04782 서울시 성동구 연무장3길 21, Seoul (KR).
- (72) 발명자: 지대윤 (CHI, Dae Yoon); 04782 서울시 성동구
연무장3길 21, 2층, Seoul (KR). 이병세 (LEE, Byoung
Se); 04782 서울시 성동구 연무장3길 21, 2층, Seoul (KR).

추소영 (CHU, So Young); 04782 서울시 성동구 연무장
3길 21, 2층, Seoul (KR). 정운정 (JUNG, Woon Jung);
04782 서울시 성동구 연무장3길 21, 2층, Seoul (KR). 정
현진 (JEONG, Hyeon Jin); 04782 서울시 성동구 연무
장3길 21, 2층, Seoul (KR). 문희정 (MOON, Hee Jung);
04782 서울시 성동구 연무장3길 21, 2층, Seoul (KR). 김
현석 (KIM, Hyeon Seok); 04782 서울시 성동구 연무장3
길 21, 2층, Seoul (KR). 김민환 (KIM, Min Hwan); 04782
서울시 성동구 연무장3길 21, 2층, Seoul (KR). 김미현
(KIM, Mi Hyun); 04782 서울시 성동구 연무장3길 21,
2층, Seoul (KR). 김재성 (KIM, Jae Seong); 04782 서울
시 성동구 연무장3길 21, 2층, Seoul (KR). 이교철 (LEE,
Kyo Chul); 01812 서울시 노원구 노원로 75, Seoul (KR).
이용진 (LEE, Yong Jin); 01812 서울시 노원구 노원로
75, Seoul (KR).

(54) Title: PSMA-TARGETED RADIOPHARMACEUTICAL FOR DIAGNOSING AND TREATING PROSTATE CANCER

(54) 발명의 명칭: 전립선암 진단 및 치료를 위한 PSMA-표적 방사성의약품

[도 1]



AA ... Time (min)
BB ... Tumor
CC ... Kidney
DD ... Liver
EE ... Muscle

(57) Abstract: The present invention relates to a pharmaceutical composition for diagnosing and treating prostate cancer, capable of targeting PSMA, and a compound provided by one aspect of the present invention has a glutamine-urea-lysine compound to which a radioactive metal-coupled chelator is structurally coupled and to which an aryl group that can additionally bind to PSMA protein is coupled. Coupling between the glutamine-urea-lysine compound and the chelator includes a polar spacer so as to serve the role of reducing in vivo nonspecific coupling and exhibit an effect of being rapidly removed from vital organs, but not from prostate cancer. These characteristics lower the radiation exposure, which is caused by a therapeutic radioisotope-coupled compound, to normal tissue and organs, and thus reduce side effects. In addition, a compound that contains a phenyl group having a coupling force with albumin

[다음 쪽 계속]

(74) 대리인: 이원희 (LEE, Won Hee); 06132 서울시 강남구 테헤란로 147 성지하이츠 2차 8층, 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, 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, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 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).

공개:

— 국제조사보고서와 함께 (조약 제21조(3))

has an increased residence time in the blood, thereby becoming more accumulated in prostate cancer.

(57) 요약서: PSMA- 표적이 가능한 전립선암 진단 및 치료용 약학적 조성물에 관한 것으로, 본 발명의 일 측면이 제공하는 화합물은 구조적으로 글루타민-유레아-리신 화합물에 방사성금속이 결합된 킬레이터가 결합되어 있고, PSMA 단백질과의 추가적인 결합을 할 수 있는 아릴기가 결합되어 있는 특징이 있다. 글루타민산-유레아-리신 화합물과 킬레이터간의 결합은 극성의 스페이서로 되어 있어 생체내 비특이적 결합을 감소시키는 역할을 하고, 전립선암 이외의 주요 장기에서 빠르게 제거되는 효과를 나타낸다. 이러한 특징은 치료용 방사성 동위원소가 결합된 화합물에 의한 정상조직 및 장기의 방사성 피폭을 낮추어 부작용을 감소시키는 장점이 있다. 또한 알부민에 결합력을 갖는 페닐기를 포함하는 화합물은 혈액 내 체류시간이 증가하여 전립선암에 보다 많이 축적되는 효과가 있다.