

(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 2024/260425 A1

(43) 国际公布日
2024 年 12 月 26 日 (26.12.2024) **WIPO | PCT**

(51) 国际专利分类号:
C07K 5/097 (2006.01) *A61K 51/04* (2006.01)
C07K 5/117 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07K 5/078 (2006.01) *C07K 1/06* (2006.01)
C07K 5/033 (2006.01) *C07K 1/13* (2006.01)
A61K 51/08 (2006.01) *A61K 103/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/100415

(22) 国际申请日: 2024 年 6 月 20 日 (20.06.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202310747044.X 2023年6月21日 (21.06.2023) CN

(71) 申请人: 中国科学院上海药物研究所(SHANGHAI INSTITUTE OF MATERIAL MEDICA, CHINESE ACADEMY OF SCIENCES) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 程震(CHENG, Zhen); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。瞿春容(QU, Chunrong); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。赖超权(LAI, Chaoquan); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。曹蕊(CAO, Rui); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 北京金信知识产权代理有限公司(KINGSOUND & PARTNERS); 中国北京市海

淀区紫竹院路 116 号嘉豪国际中心 B 座 11 层, Beijing 100097 (CN)。

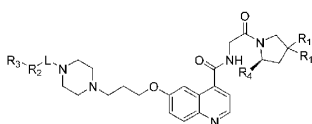
(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, 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)。

本国际公布:
— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。

(54) **Title:** FAP-TARGETING COMPOUND, AND RADIONUCLIDE-LABELED COMPLEX BASED THEREON, AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 靶向FAP的化合物、基于其的放射性核素标记配合物以及其制备方法和应用



(I)

(57) **Abstract:** Disclosed in the present invention are a FAP-targeting compound, and a radionuclide-labeled complex based thereon and a preparation method therefor and the use thereof. The FAP-targeting compound has a structure as shown in formula (I), and has high affinity for a FAP target. A radiopharmaceutical obtained by means of labeling the FAP-targeting compound with a radionuclide such as ⁶⁸Ga shows higher tumor uptake and longer tumor retention time, and can be used for the application and further development of FAP-targeting drugs.

(57) 摘要: 本发明公开一种靶向FAP的化合物、基于其的放射性核素标记配合物以及其制备方法和应用。所述靶向FAP的化合物具有式(I)所示结构, 其对于FAP靶点具有高亲和力。基于所述靶向FAP化合物经放射性核素如⁶⁸Ga标记后所获得放射性药物, 表现出更高的肿瘤摄取和更长的肿瘤滞留时间, 可用于FAP靶向药物中的应用和进一步开发。

WO 2024/260425 A1