

【11】證書號數：I939262

【45】公告日：中華民國 115 (2026) 年 09 月 11 日

【51】Int. Cl. : *A61K31/506 (2006.01)* *A61K31/437 (2006.01)*  
*A61K31/4192(2006.01)* *A61K31/495 (2006.01)*  
*A61K31/435 (2006.01)* *A61K31/41 (2006.01)*  
*A61K31/16 (2006.01)* *A61K51/04 (2006.01)*  
*A61P3/10 (2006.01)* *A61P13/12 (2006.01)*  
*A61K101/00 (2006.01)*

發明

全 6 頁

【54】名 稱：糖尿病腎病診斷藥物及應用

【21】申請案號：114142347

【22】申請日：中華民國 113 (2024) 年 10 月 29 日

【11】公開編號：202606691

【43】公開日期：中華民國 115 (2026) 年 02 月 16 日

【30】優先權：2023/10/30

世界智慧財產權組織 PCT/CN2023/127509

【72】發明人：季斌 (CN) JI, BIN；甲斐元虎 (JP) KAI, MOTOTORA

【71】申請人：復旦大學

FUDAN UNIVERSITY

中國大陸

大陸商上海富吉醫療科技有限公 SHANGHAI CHARTWELL MEDICAL  
司 SCIENCE & TECHNOLOGY CO., LTD.

中國大陸

【74】代理人：王立成；余宗學

【56】參考文獻：

CN 109400605A

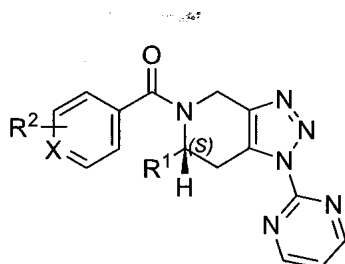
CN 113861190A

期刊 Kolb HC, et al. "Preclinical evaluation and nonhuman  
 primate receptor occupancy study of 18F-JNJ64413739, a PET  
 radioligand for P2X7 receptors" Journal of Nuclear Medicine 60  
 (8): 2019, 1154-1159

審查人員：楊婷雅

【57】申請專利範圍

1. 一種化合物或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物在製備糖尿病腎病之診斷藥物之用途，所述化合物係通式(I)所示之化合物，



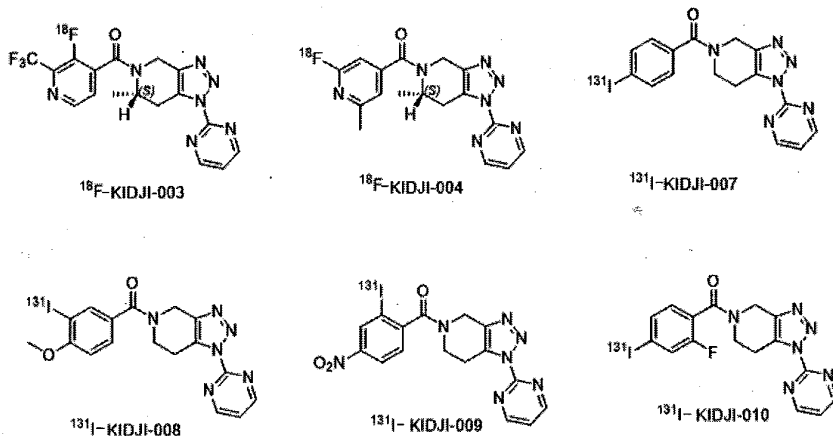
(I)

其中，X 選自碳或者氮；R<sup>1</sup> 選自氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、或叔丁基；R<sup>2</sup> 係苯環或吡啶環上之一個或多個取代基，R<sup>2</sup> 獨立地選自氫、鹵素、氰基、硝基、C1-C4 烷基、C1-C4 烷氧基、鹵代 C1-C4 烷基、鹵代 C1-C4 烷氧基中之一種

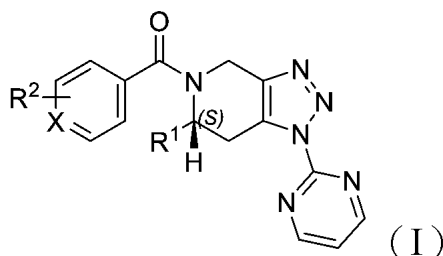
(2)

或多種，且  $R^2$  所代表之這些取代基中至少有一個原子被放射性核素取代或者  $R^2$  係放射性核素。

2. 如請求項 1 所述之用途，所述化合物選自：



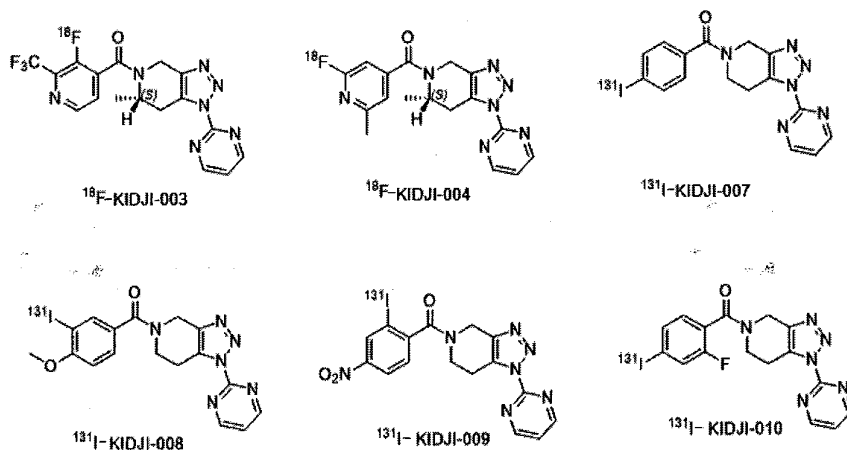
3. 如請求項 1 所述之用途，所述藥學上可接受之鹽係無機酸或有機酸之加成鹽。
4. 如請求項 4 所述之用途，所述無機酸選自鹽酸、氫溴酸、氫碘酸、硫酸、磷酸和硝酸，所述有機酸選自乙酸、酒石酸、水楊酸、甲磺酸、丁二酸、檸檬酸、蘋果酸、乳酸和富馬酸。
5. 如請求項 1 所述之用途，所述溶劑合物係水合物。
6. 如請求項 1 所述之用途，所述放射性核素選自  $^{18}\text{F}$ 、 $^{11}\text{C}$ 、 $^{131}\text{I}$ 、 $^{123}\text{I}$ 、 $^{124}\text{I}$ 、 $^{125}\text{I}$  中的一種或多種。
7. 一種用於診斷糖尿病腎病之放射性診斷套組，所述放射性診斷套組包含具有通式(I)所示結構之化合物或其藥學上可接受之鹽或溶劑合物，



其中，X 選自碳或者氮； $R^1$  選自氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、或叔丁基； $R^2$  係苯環或吡啶環上之一個或多個取代基， $R^2$  獨立地選自氫、鹵素、氰基、硝基、C1-C4 烷基、C1-C4 烷氧基、鹵代 C1-C4 烷基、鹵代 C1-C4 烷氧基中之一種或多種，且  $R^2$  所代表之這些取代基中至少有一個原子被放射性核素取代或者  $R^2$  係放射性核素。

8. 如請求項 7 所述之放射性診斷套組，所述化合物選自：

(3)



9. 如請求項 7 所述之放射性診斷套組，所述藥學上可接受之鹽係無機酸或有機酸之加成鹽。
10. 如請求項 7 所述之放射性診斷套組，所述無機酸選自鹽酸、氫溴酸、氫碘酸、硫酸、磷酸和硝酸，所述有機酸選自乙酸、酒石酸、水楊酸、甲磺酸、丁二酸、檸檬酸、蘋果酸、乳酸和富馬酸。
11. 如請求項 7 所述之放射性診斷套組，所述溶劑合物係水合物。
12. 如請求項 7 所述之放射性診斷套組，所述放射性核素選自  $^{18}\text{F}$ 、 $^{11}\text{C}$ 、 $^{131}\text{I}$ 、 $^{123}\text{I}$ 、 $^{124}\text{I}$ 、 $^{125}\text{I}$  中之一種或多種。

#### 圖式簡單說明

圖 1 為正常小鼠和糖尿病腎病模型小鼠之  $^{18}\text{F}$ -KIDJI-003 在離體放射自顯影 (ex vivo autoradiography) 影像。

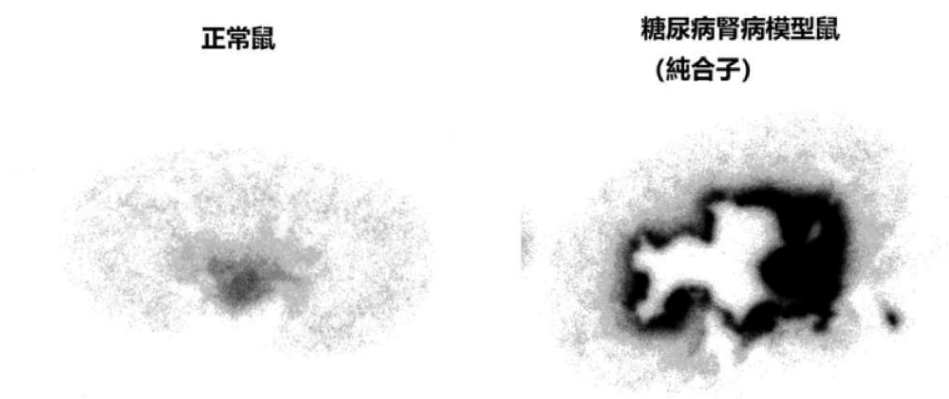
圖 2 為正常小鼠和糖尿病腎病模型小鼠之  $^{18}\text{F}$ -KIDJI-003 在離體放射自顯影之定量分析結果。

圖 3 為顯示本發明之放射性標記化合物  $^{18}\text{F}$ -KIDJI-004、 $^{131}\text{I}$ -KIDJI-007、 $^{131}\text{I}$ -KIDJI-008、 $^{131}\text{I}$ -KIDJI-009 和  $^{131}\text{I}$ -KIDJI-010 在 db/db 模型鼠和正常小鼠腎臟之 SPECT 活體成像圖。

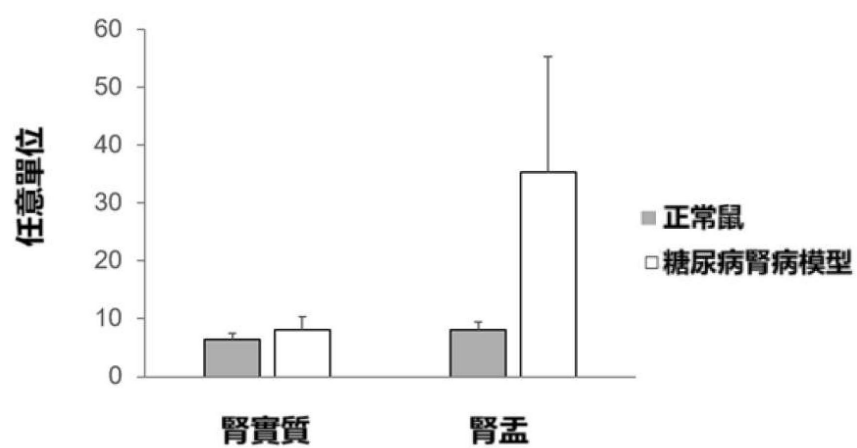
圖 4 為正常小鼠、糖尿病腎病小鼠雜合子和純合子腎臟之  $^{18}\text{F}$ -KIDJI-003 體外放射自顯影(in vitro autoradiography)影像。

圖 5 為正常小鼠、糖尿病腎病小鼠雜合子和純合子腎臟之 P2X7R 免疫染色實驗結果。

(4)

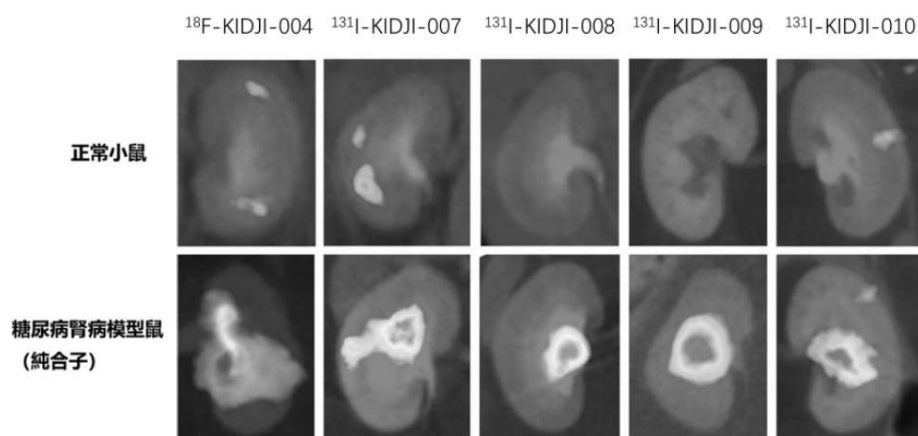


【圖1】

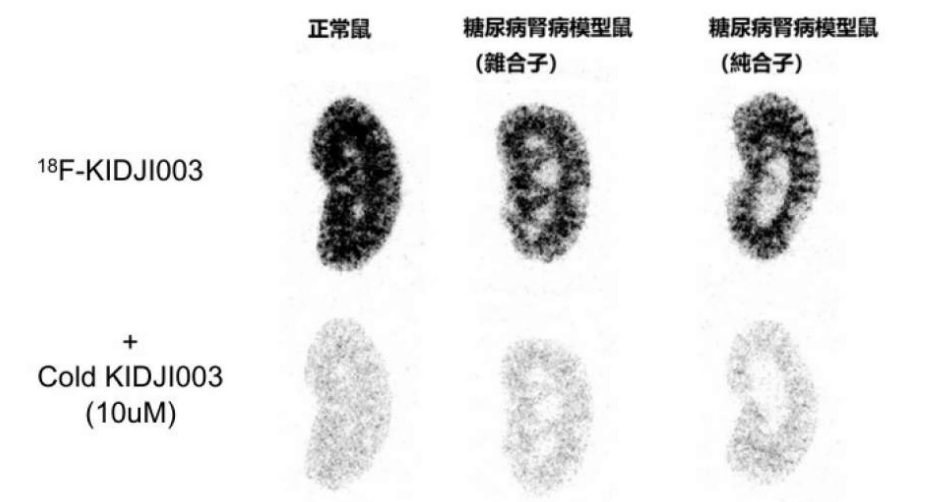


【圖2】

(5)

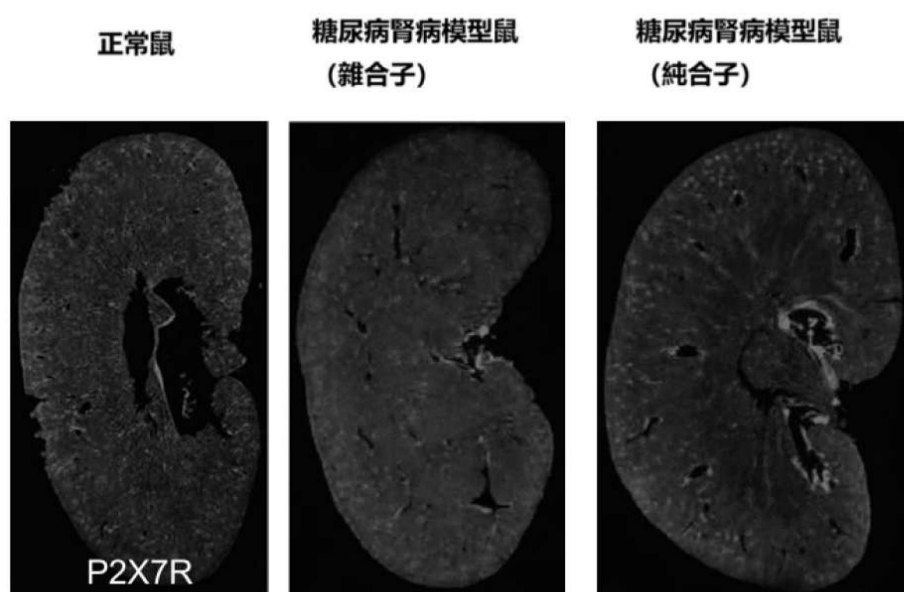


【圖3】



【圖4】

(6)



【圖5】