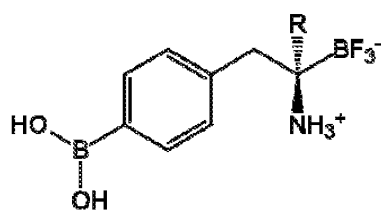


权利要求书

1. 式I的化合物:



式I,

其中R基团为氢, 或烷基, 优选甲基。

- 5 2. 权利要求1的化合物, 其中与苯环连接的硼原子是 ^{10}B 或天然硼, 优选地, 其中在 $-\text{BF}_3^-$ 中至少一个氟原子是放射性标记的; 优选地, 其中在 $-\text{BF}_3^-$ 中硼原子是天然硼。

3. 硼携带剂组合物, 其包含一种或多种权利要求1或2的化合物和药学可接受的载体。

- 10 4. 权利要求3的硼携带剂组合物, 其还包含果糖、十一氢巯基十二硼化二钠及其二聚体、硼化树枝状聚合物-EGF生物缀合物、EGFR单克隆抗体-硼酸盐缀合物、FR靶向性含硼脂质体、FR靶向性含硼纳米颗粒和硼酸盐吡啶中的一种或多种。

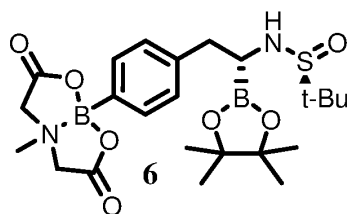
5. 权利要求1或2的化合物的制备方法, 其包括以下步骤: 通过对化合物

- 15 7 (HO) $_2\text{B}$ 添加 KHF_2 溶液, 并且添加盐酸至 $\text{pH} < 0$, 以产生含



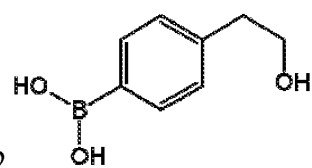
双三氟化硼的中间体 $^-\text{F}_3\text{B}$, 然后将酸度增加至 $\text{pH} 1.5-4$, 优选 $\text{pH} 2-2.5$ 以得到权利要求1或2的化合物。

6. 权利要求5的化合物的制备方法, 其中通过对化合物

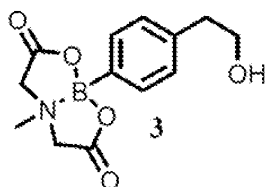


- 6 添加 NaOH 溶液至终浓度 $0.4-0.6\text{M}$, 室温搅拌 $20-40$ 分钟, 然后加入浓盐酸中和, 以得到化合物7。

7. 权利要求5的方法，其包括通过对化合物2



添加

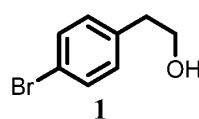


N-甲基亚氨基乙酸得到化合物3

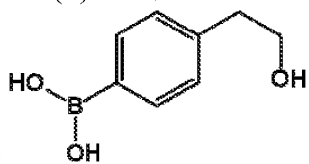
的步骤。

8. 权利要求5的方法，其包括以下步骤

(1) 将对溴苯乙醇

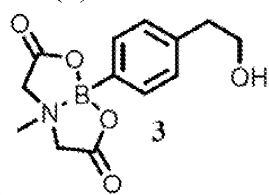


转化成化合物



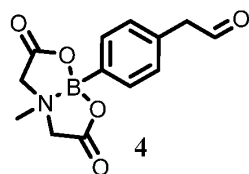
5 2 ;

(2) 在添加N-甲基亚氨基乙酸的情况下将化合物2转化成化合物



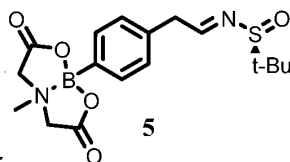
3 ;

(3) 将化合物3转化成化合物4

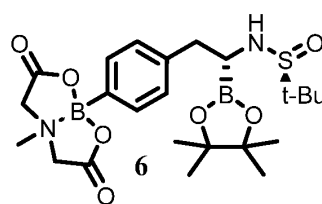


;

(4) 将化合物4转化成化合物5

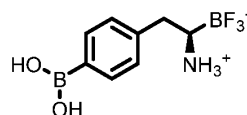


;



(5) 将化合物5转化成化合物6

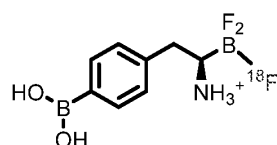
;



(6) 将化合物7转化成化合物8

8(BF₃-BPA)

; 以及



(7) 任选地将化合物8转化成

[¹⁸F]BF₃-BPA。

9. 权利要求1或2的化合物或权利要求3或4的硼携带剂组合物在制备药物中的用途, 所述药物用于治疗或诊断癌症。

10. 权利要求9的用途, 其中所述药物是用于肿瘤诊疗一体化或硼中子俘获疗法的硼携带剂。

11. 权利要求9或10的用途, 其中所述癌症选自鳞状细胞癌、肺癌、腹膜癌、肝细胞癌、胃癌、胰腺癌、黑色素瘤、成胶质细胞瘤、宫颈癌、卵巢癌、肝癌、膀胱癌、肝癌、乳腺癌、结肠癌、结肠直肠癌、子宫癌、唾液腺癌、肾癌、肝癌、前列腺癌、外阴癌、甲状腺癌、肝癌、头颈癌、B细胞淋巴瘤或白血病。