

(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 2021/175183 A1

(43) 国际公布日
2021 年 9 月 10 日 (10.09.2021)

(51) 国际专利分类号:
C07F 5/02 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW。

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/078438

(22) 国际申请日: 2021 年 3 月 1 日 (01.03.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202010137553.7 2020 年 3 月 3 日 (03.03.2020) CN

(71) 申请人: 北京大学 (PEKING UNIVERSITY) [CN/
CN]; 中国北京市海淀区颐和园路 5 号,
Beijing 100871 (CN)。

(84) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区
保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ,
NA, RW, 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, 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))。

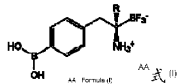
(72) 发明人: 刘志博 (LIU, Zhibo); 中国北京市海淀区
颐和园路 5 号, Beijing 100871 (CN)。 陈俊
艺 (CHEN, Junyi); 中国北京市海淀区颐和园
路 5 号, Beijing 100871 (CN)。

(74) 代理人: 北京市柳沈律师事务所 (LIU, SHEN &
ASSOCIATES); 中国北京市海淀区彩和坊路 10
号 1 号楼 10 层, Beijing 100080 (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,
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, IT,
JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, 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,

(54) Title: BORON CARRYING AGENT FOR INTEGRATED TUMOR DIAGNOSIS AND TREATMENT, AND PREPARATION
METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 肿瘤诊疗一体化的硼携带剂、其制备方法和用途



(57) Abstract: The present invention relates to a boron carrying agent for integrated tumor diagnosis and treatment, and a preparation method therefor and use thereof. Provided is a compound represented by formula I: wherein an R group is hydrogen or alkyl. A boron atom connected to the benzene ring may be ^{10}B or natural boron, and at least one fluorine atom in $-\text{BF}_3^-$ is radiolabeled. The present invention generally relates to the fields of radiopharmaceuticals and nuclear medicine. The compound in the present invention can be used for a drug for integrated diagnosis and treatment in tumor diagnosis and BNCT treatment, and by means of the same chemical structure, a reliable distribution result of a drug in vivo is provided.

(57) 摘要: 本发明涉及肿瘤诊疗一体化的硼携带剂、其制备方法和用途。提供了式 I 的化合物: 其中 R 基团为氢或烷基。与苯环连接的硼原子可以是 ^{10}B 或天然硼, 且 $-\text{BF}_3^-$ 中的至少一个氟原子是放射性标记的。本发明一般涉及放射性药物及核医学领域。本发明的化合物可以用于肿瘤诊断与 BNCT 治疗的诊疗一体化药物, 通过其相同的化学结构提供可靠的药物体内分布结果。

WO 2021/175183 A1