

### 50 $^{13}\text{N}$ -アンモニア全自動合成装置の開発 井戸達雄、岩田 鍊 (放医研・臨床)

インハウスサイクロトロン普及の為に、放射薬剤の全自動合成装置の開発が急務となっている。そこでその重要性和合成化学処理の難易を考慮し、まず $^{13}\text{NH}_3$ の全自動合成装置を開発した。

従来一般的に使用されているテバルタ合金による還元法は、自動化の点から困難さが伴うため、これに代って液状で使用できる $\text{TiCl}_3$ 法を用いた。本装置は、還元蒸留部、 $\text{TiCl}_3/\text{NaOH}$ 水溶液注入部およびコントローラから構成される。コントローラパネル上の SET、RUN、WASH のボタンを押すだけで以下の処理が自動的に行われ、 $^{13}\text{NH}_3$  を全自動的に繰返し生産することが可能となっている。

SET : 4 ml の飽和  $\text{NaOH}$  水溶液を反応容器中に注入  
RUN : ターゲット水を反応容器に注入 → 4 ml の 10%  $\text{TiCl}_3$  を注入 → ハロゲンランプによる加熱 ( $150^\circ\text{C}$ ) で生成した  $^{13}\text{NH}_3$  を蒸留し、バイアル中に捕集

WASH : 反応残液を水蒸気圧を利用して排出 → 水を注入して同様に排出し反応容器を洗浄

本装置の使用結果は、蒸留開始 8 分後 (照射終了後 10 分以内) に高純度で放射化学収率 90% の  $^{13}\text{NH}_3$  を得て、その実用性を示した。

### 51 $^{11}\text{C}$ -グルコースの光合成について。 今村恵子 (聖マリアンナ医大, 放), 野崎 正 (理研), 飯尾正明 (国立療養所中野病院)

緑葉による光合成を利用し、 $^{11}\text{C}$  を標識したグルコースの合成を行なっている。中野病院ペビーサイクロトロン (日本製鋼所製) の 10 MeV 陽子照射で、反応  $^{14}\text{N}(\text{p}, \alpha)^{11}\text{C}$  により得た  $^{11}\text{C}$  は  $700^\circ\text{C}$  の  $\text{CuO}$  と接触し、 $\text{CO}_2$  の化学形にそろえられる。室温にて  $\text{CO}_2$  を吸着し、 $220^\circ\text{C}$  で  $\text{CO}_2$  を離脱する特性を有する molecular sieve (4A) を利用し、 $^{11}\text{CO}_2$  の濃縮を行った。

緑葉としては、フダン草またはホウレン草葉を 0.5 g 使用した。予め減圧にした容器に  $^{11}\text{CO}_2$  を導入し、光を 10 ~ 20 分照射した後、90% エタノール (少量の塩酸) を加え、7 分間沸騰させた。色素成分は溶媒抽出 (エチルエーテル) により除去し、水相は中和した後イオン交換樹脂に通し、糖類 (グルコース + フルクトース) を分離した。所要時間は約 40 分である。

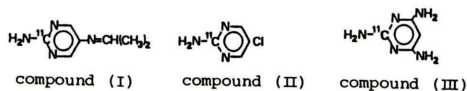
各段階での収率は、葉による  $\text{CO}_2$  の吸収が 90%、エタノールによる溶出が 90%、溶媒抽出が 90%、イオン交換樹脂が 70% で、最終的には約 50% の収率であった。市販ホウレン草はかなり安定した収率を与えた。物質間の  $^{11}\text{C}$  の分布は高速液体クロマトグラフィーにて調べた。

### 52 新しい $^{11}\text{C}$ -標識前駆体、 $^{11}\text{C}$ -グアニジンの製造と $^{11}\text{C}$ -ビリミジン誘導体の合成 岩田 鍊、井戸達雄 (放医研) 富永 健 (東大)

グアニジンは複素環化合物等の合成試薬である。高エネルギー  $^{11}\text{C}$  の  $\text{NH}_3$  との直接反応を利用して得られる  $^{11}\text{C}$ -グアニジンは、新しい  $^{11}\text{C}$ -標識医薬品の開発にとって重要な前駆体となりうる。

$\text{N}_2\text{O}$  を加えた液体  $\text{NH}_3$  を 5  $\mu\text{A}$  のプロトンで 30 分間照射した後、気体生成物と液体  $\text{NH}_3$  を除去し、照射セル内に残留する  $^{11}\text{C}$ -反応生成物を  $\text{MeOH}$  で洗出した。 $^{11}\text{C}$ -グアニジンの生成量は HPLC 分析によって求めた。

$\text{MeOH}$  溶液を減圧下で蒸発乾固して揮発性生成物を除いた後、 $\text{EtOH}$  を加えて  $^{11}\text{C}$ -グアニジン溶液を得、以下に示す  $^{11}\text{C}$ -ビリミジン誘導体の合成を行った。



5 ml の液体  $\text{NH}_3$  に 70 mmol の  $\text{N}_2\text{O}$  を加えたターゲットが、最高の  $^{11}\text{C}$ -グアニジン収率、42% を与えた。これを用いた  $^{11}\text{C}$ -ビリミジン合成の結果、20 分間の反応で化合物 (I) : 100%、同 (II) : 76%、同 (III) : 78% の放射化学収率を得た。要した全時間は 50 分であった。以上、 $^{11}\text{C}$ -グアニジンは新しい前駆体として今後期待できる。

### 53 親娘 2 核種比に注目した新しい核医学診断法。

森 厚文 (金大・RI センター) 天野良平, 真田 茂, 平木辰之助 (金大・医短) 久田欣一 (金大・核)

ジェネレーター関係にある親娘核種を投与ならびにその親娘核種の放射能比を測定し、放射平衡時での放射能比と比較考察することにより、生体内の動的挙動を知ることが期待される。すなわち、関心臓器中での親核種の有効半減期が娘核種の有効半減期より十分長い場合、親娘放射能比を 1 回測定するだけで娘核種の代謝速度など生体内の速度論的解析が可能となる。

そこで、今回まず  $^{81}\text{Rb} - ^{81\text{m}}\text{Kr}$  ジェネレーター関係に注目し、ファントム実験を行った。同強度の親核種  $^{81}\text{Rb}$  を含む陽イオンカラム 2 本の一方にブドウ糖水を流し、他方を密封した 2 本のカラムを、ガンマカメラにて 2 核種同時測定 ( $^{81}\text{Rb}$ : 511 KeV,  $^{81\text{m}}\text{Kr}$ : 191 KeV) を行った。その結果、流水下の  $^{81\text{m}}\text{Kr} / ^{81}\text{Rb}$  比は、密封カラムの  $^{81\text{m}}\text{Kr} / ^{81}\text{Rb}$  比に比べて、流速とともに小さくなった。イメージ上でもこのことが確認できた。次にラットおよびラビットを用いた動物実験を試みた。

これらの結果より、臨床応用の可能性と問題点について検討を加える。