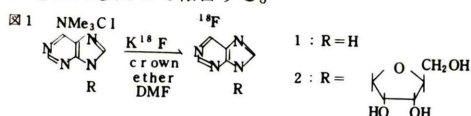


**1535**  $^{18}\text{F}$ -プリン誘導体の新しい標識合成法  
入江俊章、福土清、山崎統四郎 (放医研)  
井戸達雄 (東北大)

ポジトロントモグラフィ用の radiopharmaceuticals として、生体内基質アナログを用いた機能診断法は大きな興味の対象となっている。核酸、塩基類の  $^{18}\text{F}$ -標識は、 $\text{AgF}$  によるハロゲン交換、 $\text{F}_2$  の付加反応等によって 2、3 の標識化が行なわれているが、収率、比放射能等の難点も多い。今回、プリン骨格の 6 位の四級アンモニウム基の置換反応を用いる  $^{18}\text{F}$ -標識法 (図 1) を開発したので報告する。



標識に用いる  $^{18}\text{F}$  は、水をターゲット物質として生産されたものを用いることが可能で、従来の方法によって無水  $\text{K}^{18}\text{F}$  に調製した後、18-Crown-6 を含む DMF 溶液で  $^{18}\text{F}^-$  を可溶化し、基質の四級アンモニウム塩を加え、少し減圧下加熱反応することにより標識を行なう。反応時間、温度条件等が検討され、最適条件下で 1 は 20~30%、2 は 60~70% の放射化学的反応収率が達成された。さらに、これらは収率は低下するが、NCA (non carrier added) での標識も可能である。

**1536** 東北大サイクロトロンによる短寿命医用 RI の開発現状  
井戸達雄、岩田 鍊、石渡喜一、高橋俊博、  
門間 稔 (東北大・サイクロ)

東北大 AVF サイクロトロンは、陽子 40 MeV まで加速できる。52 年 12 月最初のビームを得、54 年 6 月から学内共同利用機器として多目的に使用が開始された。医学利用のための RI 製造は、55 年度より本格的に進められ、 $^{11}\text{C}$ 、 $^{13}\text{N}$ 、 $^{15}\text{O}$ 、 $^{18}\text{F}$ 、 $^{45}\text{Ti}$ 、 $^{77}\text{Br}$ 、 $^{125}\text{I}$  などの核種とその化合物の製造開発が行なわれた。

標識化合物については、標識気体自動合成装置によって  $^{11}\text{CO}$ 、 $^{11}\text{CO}_2$ 、 $^{11}\text{CH}_4$ 、 $\text{H}^{11}\text{CN}$ 、 $^{15}\text{O}_2$ 、 $\text{C}^{15}\text{O}$ 、 $\text{C}^{15}\text{O}_2$ 、 $^{18}\text{F}_2$ 、 $\text{H}^{18}\text{F}$  を製造し、診断用ならびに標識合成原料として利用している。その他  $^{11}\text{CH}_3\text{I}$ 、 $^{11}\text{C}$ -グルコース・フルクトース、 $^{11}\text{C}$ -プロピオン酸メチル、 $^{13}\text{N}$ - $\text{NH}_3$ 、 $^{13}\text{N}$ -グルタミン酸、 $^{13}\text{N}$ -アラニン、 $^{13}\text{N}$ -アスパラギン酸、 $^{18}\text{F}$ -5FU、 $^{18}\text{F}$ -2-FDG などが合成され、動物におけるトレーサー実験とともに、ECAT によるポジトロン断層スキャンに応用されている。

全自動合成装置 (ケミカル・ブラックボックス) については、 $^{11}\text{CH}_3\text{I}$ 、 $^{11}\text{C}$ -グルコース、 $^{11}\text{C}$ -オクタールアミン、 $^{18}\text{F}$ -2-FDG、 $^{18}\text{F}$ -フルオロメタンが完成または開発中である。

**1537** 固定化酵素法による  $^{13}\text{N}$ -標識アミノ酸の合成

石渡喜一、井戸達雄、岩田 鍊、高橋俊博、  
門間 稔 (東北大・サイクロ)

放射性薬剤として利用される  $^{13}\text{N}$ -アミノ酸の固定化酵素法による合成を検討した。固定化酵素は、ファルマシア社の AH-セファロース及び CH-セファロースを支持体とし、グルタミン酸脱水素酵素を室温下に水溶性カルボジイミドにより縮合させて調製した。 $^{13}\text{N}$ -グルタミン酸の合成は、固定化酵素 (GLDH-セファロース) を充填した小カラムを 0.1M リン酸緩衝液 (pH 7.5) に平衡化し、これに  $^{13}\text{NH}_3$ 、オキソグルタル酸及び NADH を含むリン酸緩衝液を通して行つた。次いで、水に平衡化した AG 11A8 カラムにより塩類を除いて単離した。全操作は約 5 分で、ほぼ定量的に  $^{13}\text{N}$ -グルタミン酸を得た。 $^{13}\text{N}$ -アラニン及び  $^{13}\text{N}$ -アスパラギン酸は、グルタミン酸-ピルビン酸トランスアミナーゼ及びグルタミン酸-オキサロ酢酸トランスアミナーゼを、それぞれ同様に固定化し、GLDH-セファロースカラムに連続させ合成した。合成した  $^{13}\text{N}$ -アミノ酸は、ラットに投与し、脳、心臓及び肝臓に注目して体内分布を検討した。

**1538** NaBr 水溶液をターゲットとする  $^{77}\text{Kr}$  の簡便な製造法

岩田 鍊、井戸達雄、門間 稔、石渡喜一、  
高橋俊博 (東北大・サイクロ)、玉手和彦、  
魚路益男、山崎統四郎 (放医研)

ポジトロントモグラフィによる脳血流量の定量的な測定には、 $^{77}\text{Kr}$  ( $\beta^+$ : 80%, EC: 20%, 半減期: 7.7 分) が非常に有用であると言われている。従来から知られている NaBr ベレットをターゲットとする製造法に代る簡便な方法として、我々は NaBr 水溶液をターゲットとする  $^{77}\text{Kr}$  製造法を検討した。

$^{79}\text{Br}$  (p, 3n)  $^{77}\text{Kr}$  反応を用い、NaBr の 40wt % 水溶液をターゲットとし、加速粒子としては 38 MeV のプロトンを使用した。照射は半閉鎖系で行ない、照射終了後、一定流速の He をターゲット中に通じて生成した  $^{77}\text{Kr}$  を取出した。ターゲットの厚さ、電流値を変化させて、 $^{77}\text{Kr}$  の生成量とその核種純度を調べた。

$^{76}\text{Kr}$  の生成は認められなかったが、天然の Br をターゲットとするため  $^{79}\text{Kr}$  の混入は避けられなかった。ターゲット厚を 5mm まで減らすことにより、その混入率を約 8% 前後に減少させることができた。一方  $\text{H}_2\text{O}$  より生成する  $^{11}\text{CO}_2$  の存在も認められたが、ライン中にアルカリを置くことにより除去できた。20 分間の照射での  $^{77}\text{Kr}$  の取出し量は約  $6\text{mCi} \pm \mu\text{A}$  であつた。