

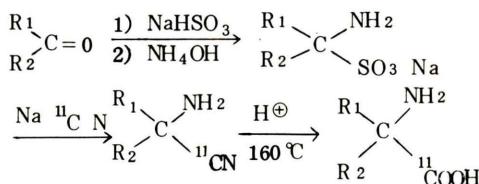
13

¹¹C-DL-アミノ酸の無担体合成

飯田重規（日本製鋼所） 岩田 錠、井戸達雄
(東北大・サイクロ)

酵母スキャンなどに有用な ¹¹C-アミノ酸の合成法としては strecker 反応が最も一般的であるが、この反応では担体 (carrier) として KCN (または NaCN) を加えるのが普通である。しかし、系を乱さずに生体内でのアミノ酸の分布、代謝を観測するためには無担体レベルでの合成が望ましい。我々は Na¹¹C N を原料として無担体での ¹¹C-DL-アミノ酸の合成を行ない以下の結果を得たので報告する。

次の反応により合成を行い、フェニルアラニン、



フェニルアラニン、ACPC、パリンをそれぞれ 16%, 51%, 40%, 49% の収率で得た。合成および精製に要した時間は約 60 分であった。

15

¹⁸FDG の全自動合成装置の開発

岩田 錠、高橋俊博、門間 桑、篠原 真、
井戸達雄（東北大・サイクロ） 山田輝雄
(日本製鋼所・加速器部)

ポジトロン核医学診断用の放射性薬剤のなかで、¹⁸FDG は現在最もその有用性が認められている化合物である。そのルーティン的な診断利用に伴い、合成の自動化が強く望まれてきた。そこで我々は、¹³NH₃、¹¹CH₃I の自動化と ¹⁸FDG の手動合成の経験に基づき ¹⁸FDG の全自動合成装置の開発を行つた。

¹⁸FDG の合成は、大別して (1) ¹⁸F₂ の照射容器からの取出しと反応、(2) 反応物のカラムクロマトによる分離と分取、(3) 溶媒の留去と酸加水分解、(4) 最終生成物の精製、の 4 つの過程から成る。上記合成操作のより確実な自動化のため、コントローラとしてマイクロコンピュータを導入した。コントローラは、超小型半導体放射能検出器、光液面センサー、圧力センサー、温度センサーを通してその操作状況を判断し、合成の全過程を自動的に進行させる。作動部は、ルーティン的な使用のための取扱いの簡便さを損うことなく、無菌かつバイロジエンフリーの ¹⁸FDG を得るよう工夫した。

本装置の概要とこれを使用した ¹⁸FDG の自動合成の結果について報告する。

14

¹⁸F-2FDG 自動合成装置試作とその評価

長町信治、石松健二（日立メディコ）
入江俊章、井上修、山崎統四郎（放医研・臨床）

¹⁸F-2FDG (フルオロデオキシグルコース) は、生体内の糖代謝をポジトロンでイメージングする薬剤として非常に重要なものであり、現在では世界で数カ所の施設で臨床利用が行なわれるようになってきている。放医研でも昭和 55 年度より臨床利用が始まっている。我々は、基本的な合成操作は従来放医研で行なわれてきたものを組み込み、ターゲットの充填から FDG の合成までを遠隔操作で行ない、さらにマイクロコンピューターコントロールによる自動運転も行なうことのできる装置を試作した。この装置を実現するにあたって、合成操作の最適化、液体検出器や放射線検出器等検出器の開発、使用する反応容器、カラム類の小型化及び反応系路の滅菌法の開発などを行なった。その結果、この装置を用いた遠隔操作はもちろん、自動運転において、従来の手操作とほぼ同じ放射化学的収率で、EOP から FDG の抽出までの合成時間を ¹⁸F の半減期内で行なうことが可能となり、操作の簡易化、被曝の軽減、及び EOS 時における実放射能量増加を達成できるようになった。

16

¹⁸F-標識単糖類の合成

多田雅夫（東北大・抗研・薬） 松沢大樹、福田寛（東北大・抗研・放） 井戸達雄、高橋俊博、篠原真（東北大・サイクロトロンセンター）

¹⁸F-標識-D-グルコース誘導体が腹部重要臓器の癌診断に有効であり、その異性体の体内分布等に顕著な差のあることが判ったので、他の単糖類についても検討する目的で本合成開発研究を組織的に行っている。

六炭糖の 1,2 位に、二重結合を導入し不飽和糖 (D-ガラクトール、D-アラール及び L-グルカル) を合成し、この二重結合への付加反応を利用して標識化する。サイクロトロンで核反応を起させて、標識ガス製造装置で取り出した ¹⁸F-F₂ ガスを用いて、これら不飽和糖に付加させ、常法通り処理して、¹⁸F-2-デオキシ-2-フルオロ-D-ガラクトース、¹⁸F-2-デオキシ-2-フルオロ-D-アルトロース及び¹⁸F-2-デオキシ-2-フルオロ-L-グルコースを、高い放射化学的純度で合成することに成功した。なお、これら新規 ¹⁸F-標識単糖類について動物実験を行い目下検討中である。