

55 放射性薬剤 I-131-MIBG の開発

井上 実、押井哲夫、中沢信彦、伊藤隆之、
小川 弘（第一ラジオアイソトープ研究所）
前田 稔、小嶋正治（九大 薬学部）

I-131-MIBG (metaiodobenzylguanidine) は、交感神経遮断薬である guanethidine の放射性ヨード標識アナログであり、1980年にミシガン大学の WIELAND らによつて開発されたものである。

1981年、Sisson らは I-131-MIBG によるシンチグラフィーが良性、悪性、副腎内外の褐色細胞腫の検出に有用であることを報告した。この方法は、安全で特異性が高く、非侵襲的である。

弊社では、固相による同位体交換反応を用いる標識方法により、反応率 95% 以上を得る I-131-MIBG の製造方法を確立し、さらに成分、含量及び安定性等の基礎検討を行った。また、MIBG の急性毒性試験の結果、低毒性である事が確認され、さらに I-131-MIBG のラット体内分布試験により被曝線量も低く、安全性が高いと推定された。

現在、臨床治験中である。

56 D-[1-C-11]グルコースの新規化学合成法について

多田雅夫（東北大 抗研 薬理） 松沢大樹，
阿部由直，伊藤正敏（東北大 抗研 放）
井戸達雄，石渡喜一，今堀良夫（東北大サイクロ）

陽電子放出核糖で標識した D-グルコースの合成研究は、医学利用のために非常に注目をあびている。今回、表題化合物の新規合成法が出来たので報告する。

D-アラビノースとシアン化カリをアルカリ存在下、10分間加熱し、陽イオン交換樹脂カラムを通し、減圧下加熱乾固させ、ラクトン体にする。次いで THF 懸濁液にして、ジボランで 10分間加熱環化し、還元反応を行う。過剰のジボランを水で分解し、イオン性物質を遅滞樹脂で除去し、HPLC で目的化合物を分離、精製する。コールド体の D-グルコースの収率は 17%（シアンから）であった。

[C-11]シアンから、D-[1-C-11]グルコースを上記の合成法で合成した。放射化学的収率は約 10% であり、その純度は 95% 以上であった。

本合成法は、用いられる装置と操作は比較的簡単なものである。D-[1-C-11]グルコース合成の自動化には容易に応用出来るものと考えている。

57 1-C11-Glucose の合成とその体内動態

佐治英郎、間賀田泰寛、徳井太郎、米倉義晴
横山 陽、鳥塚莞爾（京大医、薬）
田中 明、西原善明、飯尾真弓（住友重機械）
山下恭平（東北大農）

F18-FDG は脳、心臓などにおける糖代謝の評価のために広く用いられているが、この化合物は膜輸送や酵素反応などの挙動において、glucose と完全には一致しないので糖代謝率の定量的解析には補正を必要とする。従って、このような問題のない C11-glucose の利用が望まれている。また従来の C11-glucose の合成は生合成で行われるので、非放射性物質の混入の可能性などの点から、特に化学合成法に興味をもたれている。

そこで、今回 Kiliani-Fischer 法、即ち arabinose に C11-NaCN を付加し、常圧下 100℃、ギ酸とラネー合金で還元するという方法により合成し、放射化学的純度 99% 以上の 1-C11-glucose を、合成時間 50 分、放射化学的収率 5~10% で得た。この 1-C11-glucose をマウスに静注し、その体内動態を検討したところ、投与直後より脳に高い取り込みが認められた。また同時に合成される 1-C11-mannose にも高い脳への取り込みが認められたが、その取り込み速度は相違するため、脳における糖代謝率の評価において glucose の純度の重要性が示唆された。

58 [F-18]AcOF 法による [F-18]FDG 自動合成装置の性能

中西博昭、*門間 稔、*石渡喜一、*岩田 鎌、
*井戸達雄、西山 力（島津製作所、*東北大サイクロ）

最近開発された [F-18]AcOF による [F-18]FDG の合成法は、手順が簡単で [F-18]FDM の混入率も少なく、自動合成に適している。そこで [F-18]AcOF 法による [F-18]FDG 自動合成装置の性能について調べた。

本装置は、[F-18]AcOF の付加反応、酸加水分解、生成物の精製の 3 行程から成っており、液面レベル、温度、放射能の各センサ、ウオプリングエバポレータ、無菌コック駆動装置をマイコンにより制御し、臨床用ルーチン製造に適するよう簡便な操作で、無菌、バイロジェンフリーの [F-18]FDG が得られるよう工夫した。

その結果、合成に要する時間は照射終了後 50 分以内、放射化学的純度 97% 以上、放射化学的収率 20~25% で、再現性良く [F-18]FDG を自動合成することができた。また、本装置は [F-18]AcOF の付加反応を利用できる他の化合物の製造にも応用でき、2-deoxy-2-fluoro-L-fucose や肝機能検査の診断薬である 2-deoxy-2-fluoro-D-galactose も製造できる。なお、本装置は東北大に於いて、[F-18]FDG と [F-18]FdGal のルーチン製造に使用されている。