59 2-Deoxy-2-[F-18]fluoro-D-glucoseへの2-deoxy-2-[F-18]fluoro-D-mannoseの混入について

石渡喜一、井戸達雄、岩田錬（東北大、サイクロ）
中西博昭（島津製作所）

ポジトロントモグラフィによる糖代謝評価における有用性から、多くの[F-18]FDG合成法が開発されてきた。tri-O-acetyl glucal(TAG)と[F-18]F_2,あるいは[F-18]AcOFにより合成した[F-18]FDG中の2-deoxy-2-[F-18]fluoro-D-mannose([F-18]FDM)の混入を検討した。

定量は、[F-18]FDGをアセチル化し、シリカゲルカラムを用いるHPLCにより行なった。結果を下表に示す。(A)及び(B)は自動合成装置により、(C)は[F-18]FDGをHPLCにより分取した。CCl_3F中、気相[F-18]AcOFによる反応が最も望ましいことがわかった。

Method	Temperature	Solvent	Run	FDG:FDM
A $^{18}F_2$	-40°C	CCl_3F	3	92: 8
B $^{18}F_2$a)	-40°C	CCl_3F	10	95: 5
C $^{18}F_2$	-78°C	CCl_3F	1	100: 0
D $AcO^{18}F$(l)	room temp.	AcOH	4	80:20
E $AcO^{18}F$(g)	room temp.	CCl_3F	2	98: 2
F $AcO^{18}F$(g)	-78°C	CCl_3F	3	97: 3
G $AcO^{18}F$(g)	room temp.	CCl_3FCClF_2	1	93: 7
H $AcO^{18}F$(g)	room temp.	CCl_3CF_3	1	90:10
I $AcO^{18}F$(g)	room temp.	CCl_3H	1	89:11
J $AcO^{18}F$(g)	room temp.	CCl_2H_2	1	87:13

a) Careful chromatographic separation of ^{18}F-glucopyranosyl difluoride.

60 糖代謝トレーサとしての[1-^{11}C]及び[U-^{11}C]グルコース及び^{18}FDGの比較

石渡喜一、三浦由香、川島孝一郎、今堀良夫、谷内一彦、門間 稔、高橋俊博、井戸達雄（東北大サイクロ）

ポジトロントモグラフィーによる脳、心あるいは腫ようなどの糖代謝の評価には、グルコース(Glc)及びデオキシグルコース等が利用されている。今回、化学合成法による[1-^{11}C]Glc、及び光合成法による[U-^{11}C]Glcのラットにおける代謝動態を、臓器分布及び多重オートラジオグラフィー(ARG)法により検討し、あわせて^{18}FDGと比較した。

[1-^{11}C]Glcの脳への集積は、[U-^{11}C]Glcに比べ顕著に高く、より長く維持される傾向があった。他の臓器では肝での[1-^{11}C]Glcの集積が高いほかは、心を含めほぼ同様の時間分布を示した。また、この臓器分布を反映して[U-^{11}C]Glcの場合は、呼気への CO_2の排出が投与直後から高値を示した。[U-^{11}C]及び[1-^{14}C]Glcによる二重ARGでは、[1-^{14}C]Glcの脳内各部位への集積の違いは、[U-^{11}C]Glcより強調された。また、60分後の[1-^{14}C]Glcの脳内各部位への集積は、^{18}FDGの集積とは多少異なった。心においては、^{18}FDGの集積が著しく高いものの、[1-^{14}C]及び[U-^{11}C]Glcの代謝動態には、ほとんど差は認められなかった。

61 糖蛋白質トレーサー 2-Deoxy-2-〔^{18}F〕Fluoro-L-Fucoseの腫瘍における生化学的検索と有用性

今堀良夫(京都府医大脳外), 井戸達雄, 石渡喜一, 高橋俊博, 門間 稔, 四月朔日聖一, 谷内一彦, 三浦由香（東北大サイクロトロン）

糖蛋白質代謝に関連のある糖質L-fucoseのanalogueである2-deoxy-2-〔^{18}F〕fluoro-fuoseを合成し，ラット移植腫瘍（EA 285s/c，EL-4，AH 109A）で生化学的検索を加え，その有用性を検討した。Rat glioma cellのin vivoでのuptakeを経時的変化として調べた。また腫瘍組織の代謝産物をHPLC，TLCにより分析し腫瘍での代謝を検討した。速かな血中RI減少に比し腫瘍への高い取り込みを認めた。in vivoでRI投与後，過塩素酸処理したhomogenateのactivityの97%が可溶性分画に認められた。HPLCにより可溶性分画は二つのpeakを示した。L-fucoseは糖蛋白質の複合糖質の末端に組み込まれ細胞膜に重要な役割を果す。また体内に投与されても他の単糖類とは異なり，相互変換はなく糖蛋白質だけに取り込まれる。この様に明解な代謝経路を有するが，^{18}FDFの経路は明らかではなかった。しかし本実験で腫瘍組織や肝など糖蛋白質代謝のturn overの速い臓器では，陰イオン性を有する代謝物を生じ，糖蛋白質代謝を反映していると考えられ，ポジトロン放出核種として腫瘍診断への応用が期待される。

62 ^{18}F$^-$利用標識合成装置の開発

在間直樹（東京ニュークリア・サービス）入江俊章，福士清，山崎統四郎（放医研）西原善明（住友重機械）

近年，^{18}F$^-$を利用した^{18}F標識化合物合成が注目されているが，^{18}O（p，n）^{18}F反応を利用した^{18}F生産においては高価な^{18}O濃縮水の回収・再利用が不可欠となる。そこで我々は、^{18}Fから調製されるフツ素化試薬を利用した^{18}F標識化合物の合成と^{18}O濃縮水の回収を目的とした装置を開発した。

装置本体は、^{18}F$^-$を含むターゲット水を導入して蒸溜したのちK^{18}F／クラウンエーテルなどのフッ素化試薬の調製と、^{18}F標識化合物を合成することのできるヒーター付テフロン製反応器・蒸溜された^{18}O濃縮水を冷却回収する冷却器・電磁弁などから構成される。また、別置のコントローラにより遠隔操作が可能である。

本装置を用いることにより効率良くフッ素化試薬を調製するとともに，^{18}O濃縮水を再現性良く回収できた。さらに、^{18}F-6-フロロプリン・^{18}F-6-フロロベンジルプリンを合成したのであわせて報告する。

Presented by Medical*Online