

63 素の還元

金属マグネシウムによるC-11-二酸化炭

飯田重規、尾形哲郎、山田輝雄（日本製鋼所）

C-11-一酸化炭素はC-11-バルビタール類、C-11-B-C-N-Uなどを合成するための中間化合物となるC-11-ホスゲンの原料となる重要な化合物である。C-11-一酸化炭素は従来C-11-二酸化炭素を亜鉛により還元する方法で製造されてきたが、反応温度が亜鉛の融点に近く、温度コントロールが難しい、という問題があった。これに対し、井戸らの活性炭により還元を行う方法は温度コントロールも容易で収率も良好であるが、比放射能が低下するために標識化合物の原料としては必ずしも適当ではない。

我々はC-11-二酸化炭素の還元反応を再検討した結果、C-14-二酸化炭素からC-14-炭素への還元に使用される金属マグネシウムがC-11-一酸化炭素の製造に有效であることを見い出した。金属マグネシウムは反応性が高いため耐久性にやや難はあるものの、融点が高く、温度コントロールが容易である。種々の反応条件により製造した結果につき論ずる。

65

ビルビン酸-1-¹¹C の合成と臨床応用

原 敏彦、飯尾正明、井植六郎（国療中野）

私達はサイクロトロンで製造した¹¹CO₂を用いて、酵酸菌の酵素 pyruvate-ferredoxin oxidoreductaseにより、35分の所要時間で、ほぼ100%の収率にてビルビン酸-1-¹¹C 注射液を作成する方法を開発した(Eur. J.Nucl.Med.in press)。分離精製は昇華法を用いているから、方法が容易でありかつ何らの不純物も含まない。

ビルビン酸は解糖系の最終産物であるが、ビルビン酸-1-¹¹Cを静注すると、これはほぼ single circulatory passage で全身臓器（脳も含む）の細胞内にとりこまれ、好気的代謝の盛んな正常臓器ではさらにミトコンドリア膜を通過して直ちに脱炭酸し（アセチルCoAの生成）¹¹CO₂を放出する。¹¹CO₂は速やかに血流により除去される。嫌気状態の組織ないしミトコンドリア活性の低下した組織ではビルビン酸-1-¹¹Cは乳酸-1-¹¹Cとなり、これは長時間細胞内に留まったのち血中に放出される。従って後者の状態にある組織は、静注5~10分後から特異的な陽性画像となる。

当院ではすでに30例以上の臨床例において、肺癌、胃癌、脳腫瘍、脳梗塞、小脳変性症を描出することに成功した。

64

アミノ酸代謝を利用した機能診断用放射性医薬品(3)

C-11標識アミノ酸評価のための基礎的検討

藤林康久、川井恵一、小豆沢美弥、佐治英郎、島塚莞爾、横山 陽（京大 医、薬）

C-11標識アミノ酸は、肺臓、腫瘍等のイメージング剤として高い評価をうけている。我々は、これらのアミノ酸の集積代謝機序を基礎的に検討することにより、標識アミノ酸の代謝機能診断薬としての評価を試みた。

標識アミノ酸として、C-14標識体を用い、膜輸送系、細胞内アミノ酸プール、タンパク中含有率及び代謝ルートなどの観点から Leu, Phe, Met, Glu, Ser を選択した。細胞への集積性及びその解析には、ラット肺臓及び肝臓スライスを用いるin-vitro実験系を、体内分布及び各組織中アミノ酸代謝の検討には、マウスを用いた。in-vitro実験において、Leu, Met, Phe（非極性アミノ酸）は、エネルギー依存性の高い集積を示したが、タンパクに最も多い Ser, アミノ酸プールに最も多い Glu は低かった。また、非極性アミノ酸の中においても、その膜輸送あるいは代謝系の相異に因ると考えられる挙動を示した。これらの相異はin-vivoにおいても観察され、特に、現在最もよく用いられている Met の集積には、細胞膜能動輸送系の関与が大きく、また Phe はタンパク合成系の働きを反映する挙動を示した。これらの結果から、各アミノ酸が、それぞれ異なる代謝機能を反映する肺臓診断用放射性医薬品として評価し得ると考えられる。

66

臨床使用を目的とした0-15標識ブタノールの合成

高橋和弘、村上松太郎、羽上栄一、佐々木広、

水沢重則¹、近藤 靖²、中道博之¹、

飯田秀博、菅野 嶽、上村和夫（秋田脳研 放、内¹、神内²）

0-15標識水はPETを用いた局所脳血流橋測定のために広く臨床的に用いられているトレーサーである。この0-15標識水を用いた血流測定法は有用ではあるが、高い血液量の部位で血流量値を低く評価することが知られている。0-15標識ブタノールは、この0-15標識水を用いた方法の問題点を解消する新しい血流量測定用トレーサーとして期待される。0-15標識ブタノールのトリプチルボランからの合成反応はKobalkaらによって報告された。我々はこの合成反応を用いて臨床的に使用可能な0-15標識ブタノールの製造法を検討した。トリプチルボランと0-15標識酸素の反応条件、副生成物の除去、溶媒除去、無機塩類の除去などの各合成操作について、操作の簡素化、時間の短縮を考慮して検討を加え、最終生成物の収量、放射能学的純度および化学的純度を測定した。その結果、臨床使用に充分と思われる収量および純度を有する0-15標識ブタノール水溶液が得られた。