放射性医薬品

331 臨床的応用を目的とした^{62}Zn-^{62}Cu ジェネレータに関する基礎的検討

藤林康久、松本和也、小林信博、横山　陽
（京大　薬、医）

^{62}Cu（$T_{1/2}$＝１０分）は、^{62}Zn（$T_{1/2}$＝９時間）を親核種とするポジトロン放出核種であり、臨床的応用性の高い^{62}Zn-^{62}Cu ジェネレータの開発は、院内サイクロトロンを必要としない定量的ポジトロン核医学診断を可能とする。^{62}Cuの短い半減期を考慮すると、ジェネレータからの分離操作が迅速かつ単純であることが望まれる。そこで本研究では、ZnとCuとの錯形成能の相違を利用して、^{62}Znを担体に吸着させたカラムから^{62}Cuを錯体として選択的に分離することを考えた。担体には陽イオン交換樹脂（CG-120）を用い、これにZn-Cu を吸着させた後、Cu分離用錯形成剤として、アミノ酸及びその誘導体を用いた。コールドおよびホット実験系において種々検討の結果、Gly またはCys によってCuの選択的分離が達成された。また、これらのシステムによって得られたCu-GlyおよびCu-Cysはそれぞれ２価および１価Cuの性格を持ち、リガンド交換法による容易かつ速やかな操作によって二官能性放射性薬品などの標識が可能であることが確かめられ、広い臨床的応用性が期待された。

332 ^{18}O-濃縮水から製造される[^{18}F]F$^-$のオンライン分離と標識利用法の開発

田沢周作、岩田　錬、井戸達雄、高橋俊博、旗野健太郎
（東北大、サイクロ）

[^{18}F]F$^-$の求核置換反応を用いる^{18}F-標識化合物の合成は最近重要性を増している。^{18}O-濃縮水をターゲットとする方法がルーチンな製造法に適しているが、その高価なターゲットの簡便な回収と再利用法の開発が期待されている。本研究では、カラム法によるターゲットからのオンライン的な[^{18}F]F$^-$の分離と標識合成利用を検討した。

[^{18}F]F$^-$は20％ ^{18}O濃縮水2.5 mLをターゲットとし^{18}O(p,n)^{18}F反応を用いて製造された。陰イオン交換樹脂AG1-X8またはKryptofix 2.2.2.Bポリマーをカラムに充填しアルカリ次いで水で充分洗浄した後、照射済みのターゲットをこれに通して[^{18}F]F$^-$の樹脂への吸着率を調べた。次ぎに30～50 μmolのK_2CO_3またはCs_2CO_3を含む少量の水で[^{18}F]F$^-$を溶出しターゲットからの全回収率を求めた。[^{18}F]F$^-$は、0.3 mLでいずれの樹脂を用いてもほぼ定量的にターゲットから吸着分離されたが、Kryptofix 2.2.2.Bポリマーの方がより少ないアルカリ量で高い溶出率を与えた。一方、[^{18}F]F$^-$を吸着した樹脂を充分乾燥した後、これに種々の反応基質を含む溶媒をカラムに満たし、その^{18}F-標識率を調べて[^{18}F]F$^-$のオンライン合成利用の可能性に関して検討を加えた。

---

333 ^{18}F$^-$を用いた脂肪酸の^{18}F標識化

高橋俊博，井戸達雄，岩田錬，石渡喜一，
川島孝一郎（東北大，サイクロ）

ポジトロン標識脂肪酸は、心筋のエネルギー代謝を評価するイメージング剤として有用である。その中でも^{11}C標識脂肪酸は、ＰＥＴを用いた心筋の局所機能診断に広く用いられているが、^{11}Cの半減期が短い為、心筋からのクリアランスをより長時間観察したり又心筋のＡＲＧ作製等には不利である。そこで、これらの短所を補う目的で^{18}Fによる脂肪酸の標識化を検討した。標識方法は ⅰ）^{18}O(p,n)^{18}F反応により^{18}F$^-$を製造 ⅱ）^{18}F$^-$とKryptofix[2,2,2]より[K・222]$^+$ ^{18}F$^-$を製造 ⅲ）原料と[K・222]$^+$ ^{18}F$^-$との求核置換反応 ⅳ）エステルのケン化 ⅴ）標識体の分離精製である。まずモデル反応として^{18}F$^-$と種々の脱離基を有するC_{11}直鎖脂肪酸メチルエステルとの置換反応を検討した。その結果、脱離基としてBr及びOTosが適当である事が解かった。（放射化学的収率 Br:85-90%, OTos:81%）次にこれらの結果を基に、16-ブロモヘキサデカン酸メチルエステルより16-[^{18}F]フルオロパルミチン酸(1)を合成した。（放射化学的収率:64-73%）1はラットにおいて^{11}C標識パルミチン酸と同様な挙動を示す事が明らかになった。更に、３位にメチル基を有する脂肪酸の^{18}F標識化についても検討した。

334 [^{18}F]FDGの代謝：血清中の^{18}FDG-6-phosphateの存在について

石渡喜一[1]，川島孝一郎[1 2]，井戸達雄[1]，
（東北大，　サイクロ[1]，医，脳内[2]）

グルコース代謝の測定に用いられている^{18}FDGの代謝産物として、リン酸化物（^{18}FDG-6-P）が血清中に存在することをラット、マウス及びヒトで確認した。

実験動物としてWistar rat, Donryu rat, ddY mouse及びC3H/He mouseを用いた。ラットでは^{18}FDG投与後10，30及び60分に採血、マウス及びヒトでは60分に採血し、血しょう中の代謝産物をHPLCで分析した。^{18}FDG-6-Pは陰イオン交換カラムにより、^{18}FDGは糖分析カラムにより定量した。^{18}FDG-6-Pは、酵素合成した^{18}FDG-6-P標品及び脳の主代謝産物に一致すること、ホスファターゼにより^{18}FDGに加水分解されることにより同定した。ラットでは^{18}FDG-6-Pの割合は経時的に増加し、60分後にはWistar ratで8%、Donryu ratでは12%に達した。マウスでは約1/3の^{18}Fが^{18}FDG-6-Pとして存在したが、ヒトでは3%であった。

デオキシグルコース法により脳グルコース代謝を測定する時、血清中の^{18}FDG-6-Pの割合を補正しないと、Wistar ratの場合には補正値の97%に、Donryu ratでは94%になる。また、ヒトの場合にはその影響は1%以下である。

Presented by Medical*Online