

### 335 Acetyl hypofluorite法により合成された<sup>18</sup>F-DG anomerの検討

藤井 亮,<sup>1</sup> 今堀良夫,<sup>2</sup> 山下正人,<sup>3</sup> 水川典彦,<sup>2</sup> 柳生武彦,<sup>1</sup> 堀井 均,<sup>1</sup> 脇田員男,<sup>1</sup> 中橋彌光,<sup>1</sup> 平川公義,<sup>2</sup> (西陣病院,<sup>1</sup> 京都府医大 脳外科,<sup>2</sup> 放射線科<sup>3</sup>)

Glucoseの脳内取込みに関しては、諸家の報告によれば anomerのうちβ体のほうが脳内への取込みが高いとされている。今回我々はAcetyl hypofluorite法で合成された<sup>18</sup>F-DGのanomerの同定を行い、その比率を求めた。方法はTAGを溶かしたfreon-11中でAcO<sup>18</sup>Fをbubblingし、その<sup>18</sup>F-adductをHPLCにより分析し、一方この<sup>18</sup>F-adductと<sup>18</sup>F-DGを再度アセチル化したものと比較検討した。結果は<sup>18</sup>F-adductでは1個のみのpeakを示したが、これはTAGの付加反応の場合α位からの求電子付加が立体的に有利な為でありこのpeakは<sup>18</sup>F-DGのα体と考えられる。<sup>18</sup>F-DGをアセチル化した場合には2個のpeakが生じ、検討の結果、後に出現するpeakが<sup>18</sup>F-adductのpeakと一致した為これを<sup>18</sup>F-DGのα体と考えた。この様にして得た<sup>18</sup>F-DGのα、β体の比率を求めた結果はα体が33.7±5.1%、β体が66.3±5.1%となりこの値はglucoseのα、β体の比率とほぼ同値であった。α、β体の比率がLumped constant等に影響を与えると考えられるが、今回の検討では比率に再現性がありglucoseの比率とも等しく、その影響は少いものと考えられる。

### 336 F-18アニオンを原料とするF-18フルオロデオキシグルコース合成装置の製作 飯田重規、菅原迪、(日本製鋼所)

ポジトロン核医学において最も重要な診断剤であるF-18フルオロデオキシグルコース(FDG)の合成は、従来ネオン法により製造されるF-18分子状フッ素を原料として行なわれてきたが、最近の標識合成の進歩により、F-18アニオンを原料としてFDGの合成を行なうことが可能となった。我々は、F-18アニオンからのFDG合成を検討し、合成装置を製作したので報告する。

F-18アニオンはO-18重水をターゲットとして陽子ビームでの照射により製造し、高価なターゲットを回収するため陰イオン交換樹脂によりF-18アニオンを濃縮する方法を用いた。FDGの合成はStöcklinらの方法を採用し、50%前後の好収率を得た。

F-18アニオンの製造はネオン法によるF-18製造に比べて収量が多い、取出量が安定している、F-18が無担体で製造できる、等有利な点が多く、本装置はFDGのルーチン合成に特に適しているものと思われる。

### 337 F-18標識6-フルオロドーバ合成装置の開発 三宅義徳<sup>1</sup>、吉村厚<sup>2</sup>、一矢有一<sup>1</sup>、桑原康雄<sup>1</sup>、 大塚誠<sup>1</sup>、増田康治<sup>1</sup> (九州大学 放射線科<sup>1</sup>、同ラジオアイソトープ総合センター<sup>2</sup>)

F-18標識6-フルオロドーバは、ドーバミンレセプターイメージング薬剤としてその有用性が認められている。しかし、本薬剤の放射化学的収率が一般に低い(1-3% EOS)ため、日常的な臨床利用ができなかった。最近、3-O-メチルドーバ誘導体とアセチルハイポフルオライトとの反応により収率が8%(EOS)に向上することがAdamらによって報告され、本薬剤の臨床利用が可能となった。今回、我々はパーキンソン病、ハンチントン舞蹈病等のドーバミンレセプターの関与する疾病への臨床利用を図るために、Adamらの合成法を用い、遠隔操作によるF-18標識6-フルオロドーバ合成装置の開発を試みた。

F-18標識6-フッ素ガスを、酢酸ナトリウム3水和物を充填したカラムに通じて、F-18標識アセチルハイポフルオライトを製造し、それを酢酸またはアセトニトリルに溶かした3-O-メチルドーバ誘導体に室温にて反応させ、ヨウ化水素酸または2N塩酸にて加水分解後、高速液体クロマトグラフィーにて分離精製する。これらのステップはすべて、遠隔操作が可能である。

### 338 2-[<sup>18</sup>F]-L-fluorophenylalanine 利用に関する基礎的研究——ラット血漿中放射能について 伊藤 功、村上松太郎、高橋和弘、三浦修一、羽上栄一、佐々木広、飯田秀博、菅野 巖、穴戸文男、上村和夫 (秋田脳研、放)

2-[<sup>18</sup>F]-L-fluorophenylalanine (2-<sup>18</sup>F-Phe) のコンパートメント解析にむけた基礎検討の一環として、血漿中放射能プールについて2-<sup>18</sup>F-Pheと2,6-<sup>3</sup>H-Pheの比較検討を行なった。L-Pheと<sup>18</sup>F-AcOFから合成した2-<sup>18</sup>F-Pheを市販の2,6-<sup>3</sup>H-Pheと混合し、ラットに静脈内投与した。一定時間経過後、動脈血を採取し、酸処理、クロマトグラフィー等を行なった。両トレーサーの血漿中最低濃度値は20分前後に認められた。その後、時間と共に上昇し60分時点で2-<sup>18</sup>F-Pheは約1.2倍、2,6-<sup>3</sup>H-Pheは約2.2倍の値を示した。酸不溶性画分は2-<sup>18</sup>F-Pheは20分後、2,6-<sup>3</sup>H-Pheは10分後から出現し、60分時点ではそれぞれ血漿中濃度の28%、54%に至った。この時点の酸可溶性画分には、2-<sup>18</sup>F-Pheが90%以上存在するが、2,6-<sup>3</sup>H-Pheは約10%しか認められなかった。以上の結果より、2-<sup>18</sup>F-Pheの代謝は極めて遅く、血漿中プールも単純であり、長時間にわたるデータ収集およびそのコンパートメント解析に適しているものと考えられた。