

234

[^{11}C] - CH_3I による合成システムの整備

村上松太郎、高橋和弘、羽上栄一、佐々木広、飯田秀博、三浦修一、菅野 巖、上村和夫(秋田脳研 放射線科)

[^{11}C] - CH_3I による合成の時間短縮化、高比放射能化、汎用化を目的としてシステム整備を行なった。即ち、核種の製造から標識化合物の分離(HPLCによる)までの過程を単純化するとともに小容量化した。そのために

[^{11}C] -製造・回収系の独立化、[^{11}C] - CH_3I 合成装置の小容量化、標識反応過程におけるフランジ式バルブの採用などを行なった。本システムをmethionine, Ro15-1788およびN-methylspiroperidole合成に利用した。その結果、いずれの化合物とも照射終了から30分以内に1Ci/ μmole 以上の比放射能で得られるとの確信を得た。

235

^{11}C - β - メチルヘプタデカン酸の合成システムの開発

鈴木啓文、西原善明(住友重機械工業)、佐治英郎、間賀田泰寛、小西淳二(京大薬、医)

^{11}C - β - メチルヘプタデカン酸(MHDA)は、心筋のイメージングに有用と報告されている。そこで、この脂肪酸のルーチ的な生産を目的とした自動合成装置の開発を試みた。 $^{11}\text{C}\text{O}_2$ を原料としグリニャール反応により合成した脂肪酸をn-ヘキサンで抽出しSEP-PAK $^{\text{R}}$ にて精製し最終的にアルブミン溶液に溶解させた。

合成時間は35分であり、得られたMHDAの放射化学的純度は95%以上であった。これをマウスに静注し心筋への長時間にわたる高集積を確認した。

以上より本装置は、 ^{11}C -MHDAのルーチン生産に有効と考えられた。尚、 ^{11}C -パルミチン酸、酢酸も本装置で合成した。

236

^{11}C 標識化合物合成における $^{11}\text{CH}_3\text{I}$ とチオール基含有化合物との反応の有用性について

間賀田 泰寛、稲垣 雅、佐治 英郎、横山 陽、小西淳二(京大薬、医)、大桃 善朗(大阪薬大)

^{11}C 標識化合物はその半減期から短時間内での合成を必要とするため、この目的に適した反応を選択することが基本的に重要である。そこで今回、チオール基とハロゲン化アルキルの高い反応性に着目し、各種のチオール基含有化合物と $^{11}\text{CH}_3\text{I}$ との反応に関する基礎的な検討を行なった。その結果、チオール基の $^{11}\text{CH}_3\text{I}$ によるメチル化は短時間内に高収率で進行し、また、アミノ基や水酸基を同時に有する化合物においても $^{11}\text{CH}_3\text{I}$ はチオール基と選択的に反応することが見出された。このように、 ^{11}C -メチル化において、チオール基の高い選択性が示され、本反応は ^{11}C 標識放射性医薬品合成に基本的な反応として有用であることが認められた。

237

^{68}Ga -EDTA の Bound Fraction の検討

脇田員男¹、今堀良夫²、山下正人²、水川典彦²、小田洋平²、堀井 均¹、藤井 亮¹、柳生武彦¹、稲葉 正¹、馬淵非砂夫¹、青木 正¹、中橋彌光¹(西陣病院¹、京都府立医科大学²)

血液中に置いて ポジトロン製剤 ^{68}Ga -EDTA とアルブミン結合型の存在が議論されていたが、これに関する明かな報告は見られない。今回我々は アルブミンに特異的親和性を有するブルーセファロースを用いて 結合型を検索した結果 B/Fratio は時間とともに数%の値に達した。この結果よりコンパートメントモデルを考えるうえでアルブミンの結合型の存在は充分考慮すべき因子であることが判明した。

238

千葉大学病院に於ける自動合成装置による F-18-FDG製造と臨床応用

今関恵子、吉川京塚、宇野公一、有水昇(千葉大放科)伊藤裕、植松貞夫(千葉大放部)榎本和夫、岡住慎一(千葉大二外科)間宮敏夫(埼玉医療センター)西原善明(住友重機)

千葉大学病院では院内サイクロトロン設置に伴い、1986年3月よりポジトロン放出核種の生産が可能となった。F-18-FDG自動合成装置により本薬剤の製造が可能であり1987年4月より合成テストが、また1988年2月より臨床使用が開始された。

今回は臨床使用に先だって行った臨床利用の為の安全性を確認する目的で行った諸結果と第一相試験の結果について報告する。

239

ジェネレータ産生ポジトロン核種 Cu-62 による二官能性放射性医薬品の標識

松本和也、藤林靖久、横山 陽 (京都大学薬学部、医学部)

ジェネレータシステム(前年会にて報告)により容易に製造される Cu-62 ($T_{1/2}=10\text{ min}$, $\beta^+=98\%$)を用いる二官能性放射性医薬品開発の基礎的検討を行った。Gly 錯体として溶出される Cu-62 は Gly よりも強い Cu 配位子にのみ結合することが可能でありこの性質を利用した配位子選択的な標識が期待される。実用的なモデルとして Cu と特に強い配位能を持つジチオセミカルバゾン骨格(DTS)を導入したアルブミンの Cu-62標識を試みたところ、アルブミンの母体との結合は進行せず、DTS部位のみへの選択的かつ安定性の極めて高い標識が達成された。本結果はこの標識体の臨床応用の可能性を示すと共に一般的に Gly 錯体として溶出される Cu-62 を用いた二官能性放射性医薬品開発が可能であることを明らかにした。