

322 ポジトロンCTの為の放射性薬剤(注射薬剤)の品質管理

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, 上田 聖², 堀井 均¹, 藤井 亮¹, 柳生武彦¹, 稲葉 正¹, 青木 正¹, 馬淵非砂夫¹, 中橋彌光¹ (西陣病院¹, 京都府立医科大²)

当院において, ポジトロンCTの為の放射性薬剤(注射薬剤)の臨床使用を開始して約4年が経過した。

現在 ^{18}F FDG, ^{67}Ga -EDTA, H_2^{15}O , などを使用しているが, これらの薬剤は特に半減期が短い実際には人体投与後に品質管理試験を行うことが多い。院内製造薬剤の品質管理はシステムの運営において大変重要な意味を持つものであり, これまで我々が行ってきた細菌試験法, エンドトキシン試験法, ガンマ線測定法などについて, 品質管理上の問題点を報告する。

323 [^{14}C] PROPYL KETENE を使った新しい [^{14}C] 標識法

藤井 亮¹, 今堀良夫², 井戸達雄⁴, 堀井 均¹, 脇田員男¹, 柳生武彦¹, 馬淵非砂夫¹, 水川典彦², 山下正人², 上田 聖², 中橋彌光¹ (西陣病院¹, 京都府医大脳神経外科², 放射線科³, 東北大 サイクロトロン・RIセンター⁴)

in-vitroに於いてPK-Cに関する基礎的研究は多施設で [^3H] Phorbol esterを用いて行なわれている。そこで我々はPETによるin-vivoでのPK-Cのimagingを目的とし, Phorbol esterの [^{14}C] 標識化を行なうためその前駆体として [^{14}C]-Propyl keteneの合成を行なった。方法は, [^{14}C]-Butyric acidを生成しその熱分解により [^{14}C]-Propyl keteneを合成した。同定は同様の方法により生成したCold propyl keteneをMass Spectraにより分析した。結果, Keteneは非常に反応性が高く, 迅速にアシル化を行なうことが出来た。また熱分解時に於ける温度に対する依存性も認められた。

324 "Non-Carrier added" PHORBOL 13- [^{14}C] BUTYRATE の合成

藤井 亮¹, 今堀良夫², 井戸達雄⁴, 堀井 均¹, 脇田員男¹, 柳生武彦¹, 馬淵非砂夫¹, 水川典彦², 山下正人², 上田 聖², 中橋彌光¹, (西陣病院¹, 京都府医大脳神経外科², 放射線科³, 東北大 サイクロトロン・RIセンター⁴)

PETによりin-vivoに於ける2nd messengerの画像化を行なうためにPK-CのrigandであるPhorbol 13butylateの [^{14}C] 標識化を行なった。方法は [^{14}C] Butyric acidの熱分解により生成した [^{14}C] Propyl keteneを原料であるPMTE (Phorbol 20-Methoxy Trityl Ether)を溶かし込んだピリジン中に吹込み [^{14}C] 標識化を行ない, 加水分解によりdetritylationしてPhorbol 13- [^{14}C] Butyrateの合成をおこなった。その結果, 収率3.2% (at EOB), 純度98% (HPLC分取), 比放射能67 GBq/mol (1800 mCi/mol) で合成できた。

325 ^{14}C ヨウ化メチル自動合成装置の性能評価と ^{14}C -メチオニン, ^{14}C -N-メチルスピペロン標識合成への応用

富吉勝美, 織内昇, 館野円, 井上登美夫, 佐々木康人 (群馬大学医学部核医学教室), 石原十三夫 (同放射線科),

^{14}C 標識化合物合成の前駆体として用いる ^{14}C ヨウ化メチル (MI) の自動合成装置 (ARJSC-1 日本製鋼所) の性能評価を行い, 装置の一部を改良した。本装置は $^{14}\text{N}(\text{p}, \alpha)^{14}\text{C}$ で製造した ^{14}C を $^{14}\text{CO}_2$, $^{14}\text{CH}_3\text{OH}$ を経て $^{14}\text{CH}_3\text{I}$ とする過程を自動的に制御する。MIの合成収率は単位照射量 $\mu\text{A}/\text{min}$ 当り, $(1.26 \pm 0.41) \times 10^7 \text{ Bq} (\bar{m} \pm \text{S.D.})$ であった。

MIとL-ホモシステインチオラクトンを反応させて, ^{14}C -メチオニン (ME) を, また, MIとスピペロンを反応させて ^{14}C -メチルスピペロン (MSP) を合成した。得られたMEの放射化学的純度は $76.7 \pm 15.4\%$, 使用したMIに対する収率は $24.2 \pm 15\% (n=6)$ であった。MSPの放射化学的純度は $26.7 \pm 0.85\% (n=8)$ で, 毎回実施したバクテックによる検査で無菌, リムラステスト陰性であった。

326 [^{19}F] fluorobenzyl 化剤, o-あるいはp- [^{19}F] fluorobenzylhalide の合成 廣野健太郎, 井戸達雄, 岩田鎌 (東北大・サイクロ)

芳香環への [^{19}F] fluorideによる求核置換を用いたフッ素の導入は過去幾つか報告されているが, 脂肪族に対する場合に比べ, 標識可能な構造は限られる。今回, 筆者らはN-benzylあるいはbenzylester等の構造を持つ化合物の [^{19}F] 標識合成に汎用可能な [^{19}F] benzyl 化剤, o-及びp- [^{19}F] fluorobenzylhalideを合成したので報告する。o-あるいはp- (以下同じ) fluorobenzaldehydeをDMSO中 [Kryptofix 222/K] [^{19}F] とともに加熱しフッ素化体を得た。このaldehyde体は NaBH_3CN を加え, 約pH 4に調整する事によって定量的に還元された。得られたalcohol体に無水HBrあるいはHIのベンゼン溶液を加え, halideに導く至適条件を検討した。反応液よりSEP-PAK silicaを用いて酸を除き, 得られたbenzylhalideを用いて種々のamineのbenzyl化に成功した。

327 [^{18}F] 標識 6-Fluoropurine riboside の肺内移行の機作について

福士 清, 入江俊章, 井上 修, 山崎統四郎 (放医研臨床研究部)

肺は, アデノシンを血液の中から除去し, 不活性化する上で重要な臓器であり, ヌクレオシド取り込みのための担体輸送系を備えている。また, この輸送系はジビリダモールで特異的に阻害されることが知られている。

今回, 上記のプリン誘導体 (塩基とリボース体) と阻害剤 (0, 0.1, 0.5, 1.0 mg/kg) をマウスに同時投与し, 一分後の肺への取り込みを測定し, 用量-阻害曲線のモデル解析を行うことにより, 肺内移行の機作を調べた。

その結果, リボース体の場合, 肺による取り込みは担体輸送が65%, 残りの35%は単純拡散であり, 一方塩基の場合には, 100%単純拡散によることが判った。