

156 オンカラム法による簡便な $[^{11}\text{C}]$ アミノ酸の合成
岩田 鍊、井戸達雄（東北大 CYRIC）、多田雅夫（東北大加齢研）

PET 診断へのルーチンな利用を目的として、カラム抽出法を応用した簡便で迅速な $[^{11}\text{C}]\text{HCN}$ からの $[^{11}\text{C}]$ アミノ酸のオンカラム合成法を開発した。

Extrelut (Merck) を充填した 2 本の短いカラムを用い、1) $[^{11}\text{C}]\text{HCN}$ の反応溶液への捕集、2) 標識反応、3) 反応生成物の反応液からの抽出、4) 加水分解用塩酸溶液への逆抽出、5) 加水分解、6) 塩酸の留去、のすべての操作をオンカラム的に行った。生成物の $[^{11}\text{C}]$ アミノ酸は短い陽イオンカラムで保持した後、生理食塩水で溶出して最終的に精製した。

腫瘍診断に有用とされる $[^{11}\text{C}]\text{ACPC}$ と $[^{11}\text{C}]\text{AIB}$ を、40~60%の放射化学的収率で 40 分以内に合成できた。本法を用いた合成装置の自動化は容易なことから、ルーチン利用に適した簡便で迅速な $[^{11}\text{C}]$ アミノ酸の合成法として期待される。

157 二重標識化合物による生体内化学反応の体外計測法の基礎的検討

野口順子（昭和薬大）小川幸次、野崎正（北里大 衛生）
石井信一（住重加速器サービス）外山比南子、石渡喜一
織田圭一、千田道雄（都老人研 PET）

二重標識化合物を用いて生体内化学反応の体外観測法を開発し、放射性薬品に寄与する目的で、 ^{125}I - ^{14}C または ^{123}I - ^{11}C 標識ヨードペンタン酸 ($^1(\text{CH}_2)_4^*\text{CO}_2\text{H}$, $p\text{-}^1\text{C}_6\text{H}_4\text{O}(\text{CH}_2)_4^*\text{CO}_2\text{H}$ など) を取り上げ、まず合成方法を確立した（グリニャール反応、ヨウ素の同位体交換などを用いた）。次に、両核種のマウス体内分布を臓器を取り出して測定した。また、ピンホールコリメーターを装着したガンマカメラによりラットについて体外観測した結果、両核種の分布に顕著な差を認めることができた。

158 McN5652X の合成とその応用

佐々木正大（東京理科大）、久保寺昭子（東京理科大）、
須原哲也（放医研）、鈴木和年（放医研・新技術事業団）

5-HT uptake blocker である $[^{11}\text{C}]\text{-McN-5652-X}$ はこれまで報告された他のセロトントランスポーター標識リガンドに比較して in vivo での特異結合の割合が高く、ヒトでの応用も報告されている。今回の実験では、基本的には Suehiro らの方法により改良を加えて $[^{11}\text{C}]\text{-McN-5652-X(+体)}$ を合成したが、この方法では $[^{11}\text{C}]\text{-McN-5652}$ の標識用前駆体合成時にいくつかの問題点が生じてきた。これらを解決し、 $1.8\text{Ci}/\mu\text{mol}$ 、放射化学純度 98% 以上の $[^{11}\text{C}]\text{-McN-5652-X}$ （製品として）を得た。現在、マウス、猿を用いた臨床実験を行っているが初期の予測どおり視床に高い集積性が認められている。今後、さらに臨床実験を重ねる予定である。

159 $[1\text{-}^{11}\text{C}]\text{-2-octynoic acid}$ の中鎖脂肪酸 CoA 脱水素酵素機能マーカーとしての可能性の検討

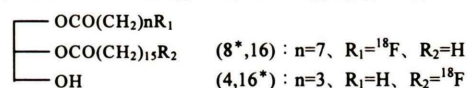
川島秀文、久下裕司、矢嶋一賀、山崎俊司、森 秀顕、
橋本直人、三宅可浩（生体機能研）

2-octynoic acid は中鎖脂肪酸 CoA 脱水素酵素 (MCAD) の自殺基質であり、ラットへの投与により MCAD 欠損症と同様の尿所見がみられることが知られている。 $[1\text{-}^{11}\text{C}]\text{-2-octynoic acid}$ のラット静注による心臓、肝臓及び腎臓における放射活性の経時的変化は、注射後数分で最大値を示し、その後徐々に減少した。注射後約 30 分でのネコ全身 PET スキャンによってもこれら組織における放射活性の保持が観察された。この時点における尿中放射活性は、ほとんど代謝産物に由来するものであり、標識 octynoic acid と MCAD との反応を示唆するものであった。以上の結果から $[1\text{-}^{11}\text{C}]\text{-2-octynoic acid}$ の MCAD 機能マーカーとしての可能性について言及する。

160 細胞内情報伝達機能の画像化を目的とした ^{18}F -標識 diacylglycerol (FDAG) の体内動態

向吉 政展、山口 幸治、高橋 俊博、岩田 鍊、井戸 達雄（東北大 CYRIC）

細胞内情報伝達機能を担っている diacylglycerol (DAG) の ^{18}F -標識化は、post-receptor 画像化に有用と考えられる。我々は、これまで acyl 鎖の炭素数を変え動態評価を行ってきた結果、 $(8^*, 16)$ が phosphatidylethanolamine (PE) に特異的に代謝されることを報告している。今回は、他の脂質に対して代謝特異性を持つ FDAG を開発するため、検討を行った。



$(4, 16^*)$ では、PE への代謝が大きい $\text{phosphatidylcholine}$ や $\text{phosphatidylinositol}$ にも組み込まれることが分かった。その他、 $(6^*, 16)$ についても報告する。

161 Xe^{18}F_2 によるフッ素-18 標識化：フッ素化メチオニンアナログの合成

簇野健太郎、柳澤融（岩手医大サイクロトロン）

XeF_2 の合成上の有用性は広く認められているが、 Xe^{18}F_2 による標識化は例が少ない。今回、 $[^{18}\text{F}]\text{フルオリド}$ より Xe^{18}F_2 の調製を行ない、これによる ^{18}F 標識メチオニンアナログの合成を試みたので報告する。

$(n\text{-Bu})_4\text{N}^{18}\text{F}$ 、 XeF_2 、 $\text{N-t-butoxycarbonyl-L-methionine methyl ester}$ を -20°C に冷却下混和し、次いで室温にて反応させた。反応の進行は TLC にて観察した。塩化メチレンを溶媒として 60 分反応を行ったところ、12% の放射化学的収率で ^{18}F 標識体が得られた。

