

29【P2】 I -335

ループ法を用いた MeMgBr からの ^{11}C EtI と ^{11}C *i*-PrI の選択的合成
○小川 政直^{1,2}, 張 明榮^{1,2}, 鈴木 和年¹(¹放医研,²住重加速器サ)

【目的】 ^{11}C ヨウ化アルキルは、 ^{11}C 標識放射薬剤の合成にとって重要な試薬である。現在まで、 ^{11}C MeI を除いた一級 ^{11}C ヨウ化アルキル (^{11}C EtI 及び ^{11}C PrI 等)は、グリニャール反応による one-pot 合成が主に報告されている。しかし、 ^{11}C *i*-PrI を始めとする ^{11}C 二級ヨウ化アルキルの実用的な製造法はなかった。今回我々は、ループ型グリニャール反応用合成装置を用いて同一の反応基質 MeMgBr から ^{11}C EtI と ^{11}C *i*-PrI を選択的に、または同時に合成し、簡易 GC により単離を行う。

【方法】MeMgBr/THF をループ内にコーティングし、 ^{11}C CO₂ を通過させる際、反応温度、時間を変化させグリニャール反応を行った。反応後、LiAlH₄ による還元及び HI によるヨウ素化を行い、 ^{11}C EtI と ^{11}C *i*-PrI を簡易 GC で単離した。

【結果】ループ法で得られた反応生成物中における非放射性 MeI の量は従来の one-pot 法に比べ大幅に低下し、GC による分離を容易にした。一方、MeMgBr によるグリニャール反応の温度及び時間を変化させることによって、 ^{11}C EtI と ^{11}C *i*-PrI を選択的に、または同時に合成することができた。 -5°C で MeMgBr を ^{11}C CO₂ と 1.5 分間反応させた場合、反応混合物中の ^{11}C EtI の割合が 91%であったのに対し、 25°C で 5 分間の場合、反応混合物中の ^{11}C *i*-PrI の割合が 81%となった。また、 25°C 、1.5 分間反応の場合には、反応混合物中の ^{11}C EtI と ^{11}C *i*-PrI の割合はそれぞれ 51%と 40%であった。簡易 GC で精製を行うことにより ^{11}C EtI は、放射化学純度 97%、比放射能 1.4 Ci/ μmol で、 ^{11}C *i*-PrI は、放射化学純度 96%、比放射能 1.8 Ci/ μmol でそれぞれ得ることができた。