

## 29P1-am167

コイル内グリニャール反応を用いた $^{11}\text{C}$ アセチルクロライドの合成検討  
○荒井 拓也<sup>1</sup>, 小川 政直<sup>3</sup>, 熊田 勝志<sup>2</sup>, 張 明榮<sup>2</sup>, 加藤 孝一<sup>2</sup>, 福村 利光<sup>2</sup>,  
鈴木 和年<sup>2</sup>(<sup>1</sup>WDB(株), <sup>2</sup>放医研, <sup>3</sup>住重加速器サービス(株))

【目的】  $^{11}\text{C}$  標識分子プローブの製造において、高い安定性かつ再現性を有する  $^{11}\text{C}$  標識反応中間体の合成方法を確立することは非常に重要である。反応中間体の中でも、 $^{11}\text{C}$ アセチルクロライド ( $^{11}\text{C}$ AcCl) に代表されるアシル化試薬は、多くの標識合成において広く汎用されている。現在までに、one pot 法や蒸留法による  $^{11}\text{C}$ AcCl の合成法は報告されているが、合成効率および再現性等の問題から実用性が乏しかった。そこで今回、 $^{11}\text{C}$ AcCl の安定製造を目的として、コイル型グリニャール反应用合成装置を用いて合成検討を行った。

【方法】まず、ターゲットより  $^{11}\text{C}$ CO<sub>2</sub> を回収し、濃縮した後、MeMgBr/THF 溶液をあらかじめコーティングさせたコイル内に通過させ、グリニャール反応を行った。次に、種々の酸塩化物をコイルに通過させることにより、 $^{11}\text{C}$ AcCl を合成した。この反応混合物と様々な求核性試薬を直接反応させることにより、 $^{11}\text{C}$ アシル化反応を試みた (one pot 法)。また、反応混合物の蒸留によって  $^{11}\text{C}$ AcCl を精製した後、同様にアシル化反応を行った場合 (蒸留法) においても検討した。 $^{11}\text{C}$ AcCl の生成効率については、aniline と反応させることにより生成する  $^{11}\text{C}$ acetanilide の収率より決定した。

【結果】コイル中での  $^{11}\text{C}$ CO<sub>2</sub> と MeMgBr の反応効率は 50% 以上であった。また、SOCl<sub>2</sub>, ClCOCOCl, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>(COCl)<sub>2</sub> などの酸塩化物とグリニャール反応物との反応から、 $^{11}\text{C}$ AcCl の生成が確認された。さらに、 $^{11}\text{C}$ AcCl を数種の求核性試薬と反応させた結果、良好な  $^{11}\text{C}$ アシル化効率を得られた。現在、使用するグリニャール試薬や酸塩化物、反応時間・温度等について条件を検討することにより、 $^{11}\text{C}$ AcCl 製造について最適化を行っている。