

# 28PE-pm144

$^{11}\text{C}$  オセルタミビル及びその代謝活性体  $^{11}\text{C}$  Ro 64-0802 の標識合成

○ 昆野 富士子<sup>1</sup>, 荒井 拓也<sup>1</sup>, 小川 政直<sup>1</sup>, 柳本 和彦<sup>1</sup>, 羽鳥 晶子<sup>1</sup>,  
山崎 友照<sup>1</sup>, 小田原 知佳<sup>1</sup>, 加藤 孝一<sup>1</sup>, 張 明栄<sup>1</sup>, 鈴木 和年<sup>1</sup> (放医研)

【目的】オセルタミビル(1) は、ウイルスの増殖を抑制するインフルエンザ治療薬である。1 のリン酸塩は経口剤であり、ノイラミニダーゼ阻害剤である Ro 64-0802 (2) の prodrug として開発された。近年、世界市場の 70-80% を占める日本では、1 リン酸塩を若年層に投与した場合に生じる異常行動が問題となってきた。そこで我々は、PET を用いて 1 の生体内動態を探るべく  $^{11}\text{C}$ 1 及び  $^{11}\text{C}$ 2 の標識合成を行い、ラットにおける体内動態について検討した。

【方法】1 を conc. HCl と EtOH 中で反応させ diamine 3 とした。次いで、3 を Boc 化し  $^{11}\text{C}$ 1 の標識前駆体となる 4 を合成した。4 を  $[1-^{11}\text{C}]\text{AcCl}$  でアセチル化した後に、6N HCl で Boc 基を脱保護し、目的とする  $^{11}\text{C}$ 1 を得ることができた。さらに、 $^{11}\text{C}$ 1 を 5N NaOH で加水分解し、代謝活性体  $^{11}\text{C}$ 2 を定量的な収率で合成した。【結果および考察】 $^{11}\text{C}$ 1 をラットに投与し、radio TLC 及び HPLC にて追跡したところ、脳内に  $^{11}\text{C}$ 1 はなく、 $^{11}\text{C}$ 2 のみの存在が認められた。

