

26LB-am09

one-pot synthesisを利用した迅速なN-succinimidyl 4-[¹⁸F]fluorobenzoate ([¹⁸F]SFB) 合成法の検討

○戸松 賢治¹, 木村 寛之¹, 河嶋 秀和², 久下 裕司³, 佐治 英郎¹ (¹京大院薬, ²京大院医, ³北大院医)

【目的】 [¹⁸F]SFB はペプチド・タンパク質の ¹⁸F 標識試薬として有用な化合物であるが、合成工程には中間体である [¹⁸F]fluorobenzoic acid ([¹⁸F]FBA) の精製および脱水という煩雑な手技を含むことから、簡便な合成法の確立が期待されている。そこで我々は、 [¹⁸F]FBA 合成時における脱保護反応に tetrapropylammonium hydroxide (TPAH) を用いることで精製工程を省略し、更に脱水操作が反応に与える影響を調べることで、one-pot synthesis を利用した [¹⁸F]SFB の迅速合成の可能性を検討した。

【方法】 TPAH を用いて [¹⁸F]FBA を合成後、acetonitrile を用いて反応溶液を共沸・脱水した条件、および脱水操作を行わずに水を含む条件でそれぞれ反応を継続し、 [¹⁸F]SFB の放射化学的収率を比較した。さらに、反応溶液中の水含有率を変化させて反応を行い、系に存在する水が [¹⁸F]SFB の収率に与える影響を検討した。

【結果・結論】 脱水操作を行わず 1.67% 含水状態で行った [¹⁸F]SFB の放射化学的収率は 42.8% であり、これは脱水操作を行った場合とほぼ同等であったことから、脱水操作が省略できる可能性が示された。また 0-51% の水含有率の範囲では、 [¹⁸F]SFB の収率に大きな変化がないことを見出した。そこで実際に one-pot synthesis で [¹⁸F]SFB の合成を試みた結果、これまでの報告と同等の収率 (46.5±12.0%、減衰補正) で、かつ合成時間は 45 分で得られ、従来法 (60-120 min) よりも大幅な合成時間の短縮にも成功した。