

29P-am430

¹⁸F- 標識化試薬 [¹⁸F]FBEM の効率的な合成法の開発

○西嶋 剣一¹, 相田 一樹², 秋澤 宏行³, 大倉 一枝³, 玉木 長良¹, 久下 裕司^{1,2}
(¹北大院医, ²北大アイソトープ, ³北医療大薬)

【背景】チオール基に特異的に反応する有用な ¹⁸F-標識化試薬[¹⁸F]FBEM は、*N*-succinimidyl 4-[¹⁸F]fluorobenzoate ([¹⁸F]SFB) と *N*-(2-aminoethyl)maleimide (AEM) との反応により得られるが、その放射化学的収率の低さが問題であった。【目的】[¹⁸F]FBEM の収率の向上を目的とし反応条件について検討した。【方法】[¹⁸F]SFB を C18 カラムに捕集し、窒素ガスによる十分なパージ後 MeCN により抽出した。[¹⁸F]SFB/MeCN 溶液に、AEM-TFA (1 mg) と *N,N*-diisopropylethylamine (DIEA, 20 μL, AEM に対して 30 当量) とを加える方法 (従来法)、またはあらかじめ DIEA (1 当量) で処理した遊離 AEM を加える方法により、40°C、20 分間反応させた。[¹⁸F]FBEM の放射化学的収率を HPLC により求めた。【結果と考察】従来法は、収率 39%で[¹⁸F]FBEM を与えたものの、副生成物 4-[¹⁸F]fluorobenzoic acid ([¹⁸F]FBzA) も約 10%の収率で与えた。他方、遊離 AEM を用いた場合、[¹⁸F]FBEM の収率が 54%まで向上し、副生成物[¹⁸F]FBzA は数%以下であった。[¹⁸F]FBzA の生成は、固相抽出によるわずかな水分の混入と過剰に加えられた塩基が原因であり、当量の塩基を用いることで副反応が抑えられたものと考えられた。【結論】本法により、¹⁸F-標識化試薬[¹⁸F]FBEM の収率向上が達成された。