

30TH-am02

求核置換反応を利用したフルオロデオキシマンノース合成法の確立と腫瘍集積性の評価

○新保 亮¹, 古本 祥三², 吉岡 孝志³, 仲田 栄子², 青野 嘉隆¹, 石川 洋一¹, 岩田 錬¹, 福田 寛⁴(¹東北大CYRIC, ²東北大院医, ³山形大医, ⁴東北大加齢研)

目的：^[18F]Fluoro-2-deoxyglucose (^[18F]FDG, a) は腫瘍の画像化に非常に優れており、PET診断薬として最も広く利用されているが、脳への集積が高く、炎症鑑別も難しいという欠点をもつ。^[18F]Fluoro-2-deoxymannose (^[18F]FDM, b) は^[18F]FDG のアノマーであり、C-2 位の¹⁸F基の立体配置が異なるが、以前の研究で腫瘍への高い集積性に加え高い血液クリアランスと脳への低い集積性を持ち、腫瘍診断薬への応用が可能であることがわかった。しかし^[18F]FDMの実用的合成法は未だ確立されていない。今回は^[18F]FDMの実用的合成法を確立し、生物学的評価を行なった。方法：3 種の前駆体 (c~e) を合成し、求核置換反応による標識を行なった。その後加水分解反応で保護基を外し、固相抽出とイオン交換樹脂による精製を行なった。合成した^[18F]FDMを腫瘍ラットに投与し、臓器別体内分布を測定した。また腫瘍の撮像をプラナーイメージング装置で行った。結果：3 種の前駆体のうち1種を使った標識合成では放射化学的収率60%、放射化学的純度98%以上で合成することができた。臓器別体内分布測定では以前確認された特徴に加え、高い腫瘍筋肉比と腎臓・膀胱からの速やかな排泄がみられた。プラナーイメージング装置での撮像では鮮明な腫瘍像を観察できた。結論：^[18F]FDMの実用的合成法を確立し、腫瘍診断薬としての可能性を示すことができた。

