

# 29P-am431

JFE 社製ハイブリッド合成装置を用いたアシル化反応による [ $^{11}\text{C}$ ] 標識の反応条件検討

○田沢 周作<sup>1</sup>, 蔵地 理代<sup>1</sup>, 水川 陽介<sup>2</sup>, 大崎 勝彦<sup>2</sup>, 高橋 和弘<sup>1</sup>(<sup>1</sup>理研,<sup>2</sup>JFE)

【目的】我々は、JFE社製ハイブリッド合成装置（ディスプレイブルカセット式）を用いることによって、アシル化反応による [ $^{11}\text{C}$ ] 標識薬剤の合成が [ $^{11}\text{C}$ ] ヨウ化メチル法と同様、汎用的に実施できることを示してきた。また、m-トルイジンを前駆体としたモデル反応を用いて  $\text{CH}_3\text{MgCl} > \text{CH}_3\text{MgBr} > \text{CH}_3\text{MgI}$ 、または  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{MgCl} > \text{CH}_3\text{CH}_2\text{MgBr} > \text{CH}_3\text{CH}_2\text{MgI}$  の順に [ $^{11}\text{C}$ ]  $\text{CO}_2$  との反応性が高いことを見出してきた。今回は、反応性が高い  $\text{CH}_3\text{MgCl}$  と  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{MgCl}$  を用い、 [ $^{11}\text{C}$ ] タミフルおよび [ $^{11}\text{C}$ ] メラトニンについて反応条件を検討した。

【方法】  $\text{CH}_3\text{MgCl}$  または  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{MgCl}$  の脱水エーテル溶液に、モレキュラーシーブを用いて濃縮した [ $^{11}\text{C}$ ]  $\text{CO}_2$  を吹き込んだ後、フタロイルジクロライドと 2,6-ジブチルピリジンを添加して [ $^{11}\text{C}$ ] アセチルクロライドまたは [ $^{11}\text{C}$ ] プロピオニルクロライドを中間体として得た。これを加熱蒸留し、前駆体溶液に吹き込むことによりアシル化を行った。蒸留温度、蒸留速度、アシル化溶媒、アシル化温度およびアシル化触媒について放射化学的収率および比放射能を比較した。

【結果および考察】アシル化反応は反応性が高く、蒸留された [ $^{11}\text{C}$ ] アセチルクロライドまたは [ $^{11}\text{C}$ ] プロピオニルクロライドは、室温で定量的にアシル化が進行することが明らかになった。N-ジメチルアミノピリジンなどのアシル化触媒の効果は必要なかった。放射化学的収率は 10~25% (EOB)、放射化学的純度は 95% 以上 (EOS)、比放射能は 30~60GBq/ $\mu\text{mol}$  (EOS) であった。収率低下の主な原因は、 [ $^{11}\text{C}$ ] アセチルクロライドまたは [ $^{11}\text{C}$ ] プロピオニルクロライドを蒸留する際の移送経路への残留がであったので、今後、改善していく必要がある。