

29P-am425

Microwave を利用した ^{99m}Tc または Re トリカルボニル錯体の迅速合成法の検討
○森 大輔¹, 木村 寛之¹, 河嶋 秀和², 小野 正博¹, 佐治 英郎¹ (¹京大院薬, ²京大院医)

【背景・目的】 ^{99m}Tc は SPECT に適した線質を有するとともに、ジェネレータにて院内での用時調製が可能であるなど、高い臨床汎用性を有している放射性元素である。また、 $^{186/188}\text{Re}$ は治療の分野において注目されている。これらの核種は二官能性キレート概念に基づき、適当な配位子を介して錯体を形成させ、プローブ分子に導入する必要がある。これまでに報告されている種々の錯体の中でもトリカルボニル錯体は、コンパクトで安定であるため分子イメージングに適している。しかしながら、従来の ^{99m}Tc や $^{186/188}\text{Re}$ 錯体形成反応の中には反応性が悪いものもあり、目的の $^{99m}\text{Tc} \cdot ^{186/188}\text{Re}$ 標識化合物を短時間で収率よく合成する方法が望まれている。そこで我々は、近年有機合成分野において反応の迅速化や高収率化が報告されている microwave を利用し、トリカルボニル錯体の迅速合成について検討した。

【方法・結果】今回、キレート骨格に 2-picolylamine-*N*-acetic acid, bis(2-methylpyridyl)-amine, bis[2-(3,5-dimethyl-1-pyrazolyl)ethyl]-amine を選択し、 ^{99m}Tc と非放射性 Re を用いて錯体形成反応を行った。その結果、いずれの錯体も、反応時間が 5 分以内と非常に短時間で収率良く合成することができた。またその中で、2-picolylamine-*N*-acetic acid ethyl ester を原料として用い、水を溶媒として用いた場合、錯体形成反応中に加水分解が進行し、エステル体から目的とする錯体を one-pot で得ることができた。さらに、二官能性キレート概念に基づき本リガンドを有する母体化合物の microwave による標識に成功した。以上より、microwave を用いることで、 ^{99m}Tc または Re トリカルボニル錯体を迅速に合成可能であることが示された。