

30amB-257

[¹⁸F]F⁻を用いる [¹⁸F]FDOPA の無担体添加合成法の基礎検討

○秋山 幸生¹, 森本 陽子¹, 立花 晃子¹, 蔵地 理代¹, 田沢 周作¹, 高橋 和弘¹
(¹理化学研)

【目的】本研究では [¹⁸F]F⁻を用いた無担体添加の合成法で [¹⁸F]FDOPA を、自動合成装置を用いてより簡便に、ルーチン的に合成する手法の開発を目的とした。

【方法】出発物質のアルデヒド **1** を [K₂₂₂]K¹⁸F で [¹⁸F]フッ素化を行った。フッ素化反応については反応温度、時間、前駆体の濃度等について反応条件の検討を行った。次に反応溶液を水で希釈して Sep-Pak tC18 に通し、オンカラム法で還元とヨウ素化を行った。その後、得られたヨウ化物 **3** をトルエンで抽出し、グリシン誘導体 (Ph₂C=NCH₂CO₂t-Bu) とのアルキル化を行い化合物 **4** へと変換した。

【結果】フッ素化反応の条件検討の結果、140℃の反応条件が最も高収率であった (放射化学的収率 55%)。また、前駆体濃度や反応時間を変えても収率に大きな変化はなかった。

オンカラム法での還元およびヨウ素化は、いずれも効率良く進行した (それぞれ放射化学収率 95%、80%)。また、アルキル化反応も比較的効率良く進行した (63% ~)。化合物 **4** の脱保護の条件については現在検討中である。

