

27PA-am100

多目的自動合成装置を用いたクリック反応による ^{18}F -標識ペプチドの合成：

5- ^{18}F fluoro-1-pentyne の合成検討

大曲 茂生¹, 小松 由紀子¹, ○西嶋 剣一^{1,2}, 志水 陽一¹, 馮 飛², 玉木 長良², 久下 裕司^{1,2}

(¹北大 CIS, ²北大院医)

【背景】銅触媒を用いるアルキンとアジドによる付加環化反応(クリック反応)は選択性や効率が極めて高く、多くの有機溶媒や水中でも問題なく進行する優れた反応である。近年、 ^{18}F を標識化したアルキン化合物またはアジド化合物を用いたクリック反応を利用したペプチドの ^{18}F 標識化が行われている。【目的】今回、多目的自動合成装置を用い、 ^{18}F 標識化アルキン化合物 5- ^{18}F fluoro-1-pentyne の合成法について検討した。【方法】サイクロトロン照射条件は $25\ \mu\text{A}$ 、20 分とした。合成装置はトレイ式の多目的合成装置 (CFN-MPS100, 住友重機械工業製) を使用し、5- ^{18}F fluoro-1-pentyne の蒸留精製が可能なシステムへと改造した。前駆体 1-Tosyloxy-4-pentyne の MeCN 溶液または DMSO 溶液を $[\text{K}/\text{K}222]^{+18}\text{F}$ 存在下 110°C 、10 分間反応させた後、蒸留により 5- ^{18}F fluoro-1-pentyne を精製した。5- ^{18}F fluoro-1-pentyne の放射化学的純度は HPLC により求めた。【結果】前駆体溶液に MeCN を用いた場合、蒸留に 15-20 分程度時間を要したものの 5- ^{18}F fluoro-1-pentyne を放射化学的収率 $10.8\% \pm 5.4$ 、放射化学的純度 $99.3\% \pm 0.2$ で得た (半減期補正なし、 $n=5$)。他方、DMSO を用いた場合、蒸留は 10 分程度と短時間で終了したが、放射化学的収率 $3.3\% \pm 2.8$ 、放射化学的純度は $90.7\% \pm 6.4$ であり、不純物として未反応の ^{18}F イオンが検出された (半減期補正なし、 $n=5$)。【結論】前駆体溶液を検討した結果、MeCN を用いた場合において、高い放射化学的純度で 5- ^{18}F fluoro-1-pentyne を得ることに成功した。