

## 28AB-am397

ループ標識法を用いたカセット式多目的合成装置による $^{[11]C}PiB$ の合成検討

○加川 信也<sup>1,2</sup>, 矢倉 栄幸<sup>1,3</sup>, 西井 龍一<sup>1,4</sup>, 東 達也<sup>1</sup>, 山内 浩<sup>1</sup>, 川井 恵一<sup>2</sup>, 渡邊 裕之<sup>5</sup>, 木村 寛之<sup>6</sup>, 小野 正博<sup>5</sup>, 佐治 英郎<sup>5</sup> (滋賀成病セ研,<sup>2</sup>金沢大院医薬保,<sup>3</sup>住重加サ,<sup>4</sup>放医研,<sup>5</sup>京大院薬,<sup>6</sup>京都薬大)

【目的】これまで、我々は様々なアミロイドイメージング剤の候補化合物を検討し、その中でもピリジルベンゾフランを母核とするF-18標識化合物( $^{18}F$ ]FPYBF-2)の有用性を報告してきた (Ono et al., *J Med Chem*, **54**, 2971-9 2011)。そこで、今回 $^{18}F$ ]FPYBF-2の臨床的有用性をゴールドスタンダードである $^{[11]C}PiB$ と比較するため、カセット式合成装置を用いた $^{[11]C}PiB$ の合成をループ標識法で検討した。

【方法】 $^{[11]C}PiB$ の合成は、JFE社製カセット式合成装置を用いて、従来のパブリング標識法ではなく、ループ標識法で行った。ループ標識法による合成は、使い捨ての反応ループ (内径 1 mm×長さ 100 cm, ループ状滅菌チューブ) に少量のシクロヘキサノンに溶解した 2-(4'-Aminophenyl)-6-hydroxybenzothiazole を自動注入して $^{[11]C}$ メチルトリプレートと反応させた。最終製剤化工程には、固相抽出によって得られた $^{[11]C}PiB$ を含むエタノールを生理食塩水で希釈する方法によって合成した。さらに、放射性薬剤基準を参考として品質検定や安全性試験等も行った。

【結果・考察】ループ標識法及び固相抽出法による製剤化技術を用いた $^{[11]C}PiB$ の合成は、放射能： $12.2 \pm 0.9$  GBq、合成時間： $26.6 \pm 0.2$  分、収率： $38.7 \pm 1.5\%$ 、放射化学的純度：99.9%以上であり、放射性薬剤基準を参考として $^{[11]C}PiB$ の品質検定や急性毒性試験 (標識最終製剤) 等を行った結果、特に問題を認めなかった。さらに、従来のパブリング標識法及びロータリーエバポレーターを用いて溶媒を蒸発乾固させる方法よりも合成の準備・後片付けが非常に簡便化され、今後、更なる普及が望まれる合成法であることが明らかとなった。当センターでは、薬剤委員会の承認を得ており、倫理委員会の承認後に $^{[11]C}PiB$ の健常ボランティア試験及び認知症患者を対象にした検討を行い、 $^{18}F$ ]FPYBF-2との比較を予定している。