

23R-pm22

含水 ^{18}F 溶液と濃縮 ^{18}F 化法による ^{18}F -FMISO の ^{18}F 化反応の検討

○阿保 憲史¹, 桐生 真登², 東川 桂¹, 志賀 哲³, 久下 裕司¹ (¹北大 CIS, ²日本メジ,
³北大院医)

【目的】 ^{18}F 標識 PET 薬剤の合成では、通常、標識前駆体との ^{18}F 化反応を無水条件下で行うために、 ^{18}F 化反応前に ^{18}F 溶液の加熱乾固、共沸乾固等が行われる。この工程には約 15 分を要するため、半減期の短い ^{18}F 標識 PET 薬剤では放射能の減衰による約 10%の収率低下が生じる。本研究では、上記無水化工程を必要としない ^{18}F 化法を考案することを目的に以下の検討を行った。【方法】 ^{18}F -フルオロミソニダゾール (^{18}F -FMISO) の ^{18}F 化反応について検討した。すなわち、含水 ^{18}F 溶液と FMISO 前駆体 (NITTP) 溶液を反応容器に添加したもの (MeCN 1.0 mL、含水率 2.85%: 試料①及び②)、含水 ^{18}F 溶液を加熱乾固し、NITTP 溶液を添加したもの (MeCN 1.0 mL 含水率 0%: 試料③) を作製した。①は窒素ガス気流下の開放系での反応 (濃縮 ^{18}F 化)、②③は従来の密閉系での反応 (従来 ^{18}F 化) とし、各々 100°C で 3~10 min 反応させた。反応終了後ただちに氷冷し、①は 50%含水 MeCN で溶液化した。各反応液中の目的物 (^{18}F -化体) の割合および収率を高速液体クロマトグラフィー (HPLC) にて評価した。【結果】①では反応開始後 3 min では目的物は検出されなかったが、4、6 min での目的物の収率は各々 60.3 ± 4.0 、 $97.4 \pm 0.6\%$ であった。②では目的物は検出されなかった。③では反応開始 3、5 min にて目的物の収率は各々 $52.6 \pm 2.9\%$ 、 $92.5 \pm 2.4\%$ であった (全て $n=3$)。【考察・結論】濃縮 ^{18}F 化による ^{18}F -FMISO の ^{18}F 化反応において、含水 ^{18}F 溶液を直接 ^{18}F 化反応に供することが可能であった。今回考案した濃縮 ^{18}F 化法は、合成工程の簡略化、合成時間の短縮と放射化学的収率の改善、反応容器の耐圧条件の緩和など多くのメリットを有する。また濃縮 ^{18}F 化法では、反応溶液が乾固されるため、通常続いて行われる加水分解工程への移行も容易である。今後、更なる ^{18}F 標識 PET 薬剤への応用が期待される。