

23PO-pm111

$[^{18}\text{F}]\text{HF}$ からの $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ 合成法の自動合成装置への適応

○金井 泰和^{1,2,3}, 大田 洋一郎^{4,5}, 服部 能英⁴, 堺 俊博^{4,6}, 仲 定宏², 渡辺 利光^{4,7}, 新屋 洋^{3,7}, 山中 祥二⁸, 竹中 宏志⁵, 吉川 智裕⁵, 井口 佳哉⁵, 加藤 潤⁷, 上原 幸樹⁵, 近藤 直哉¹, 平田 雅彦¹, 天満 敬¹, 井上 修^{2,6}, 切畑 光統⁴, 畑澤 順² (¹大阪薬大, ²阪大院医, ³大阪医大, ⁴大阪府大, ⁵ステラファーマ, ⁶阪和インテリジェント, ⁷住友重機, ⁸住重加速器)

【目的】我々はこれまで、 $[^{18}\text{F}]\text{HF}(\text{F})$ から $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ を合成する方法を種々報告してきた。その中で、前駆体にピナコールボラン構造を有するフェニルアラニン誘導体を用いた場合、 $[^{18}\text{F}]\text{HF}$ から高い反応効率で $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ を合成することができることを確認した。そこで今回、これまでに我々が開発した合成法を臨床利用へ向け、自動合成装置を用いて合成法の最適化を行った。

【方法】 $[^{18}\text{F}]\text{HF}$ から $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ を合成する各工程は下図に示すように $[^{18}\text{F}]\text{フッ素化}$ 、 ホウ素化 、加水分解および精製を経て $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ の合成を行った。各工程において反応条件を検討し、最適化を行った。

【結果】各反応において、試薬量や反応溶媒の種類、温度等の条件を種々検討した結果、 $[^{18}\text{F}]\text{フッ素化}$ では $82\pm 7\%$ ($n=9$)、 ホウ素化 及び加水分解を経て、 $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ を合成する事が出来た。なお $[^{18}\text{F}]\text{HF}$ から $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ までの総収率は約10%であった。

【結論】今回、自動合成装置を用いて、収率よく $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ を合成する事が出来た。本法は、 $[^{18}\text{F}]\text{FBPA}$ を臨床使用する上で、有用な知見となる。

