

求核置換反応を用いる放射性フッ素標識における非放射性不純物の解析と高純度 ^{18}F 標識分子合成への応用

(東工大物質理工¹・東京都健康長寿医療センター研究所²) ○ソウ エイソウ¹・多胡 哲郎²・豊原 潤²・田中 浩士¹

Elucidation of nonradioactive side-products during ^{18}F -Fluorination due to nucleophilic substitution and development of the method for the synthesis of ^{18}F labeled compounds with a high purity. (¹Sch. Mater. & Chem. Tech., Tokyo Tech., ²Tokyo Metropolitan Institute of Gerontology, ³) ○Ruichong Song,¹ Tetsuro Tago,² Jyun Toyohara,² Hiroshi Tanaka,¹

^{18}F]PET made visualizing pharmacokinetics inside human body with high sensitivity and high resolution possible by using ^{18}F -Fluorinated biometric molecule. In order to simplify the purification of ^{18}F]PET tracer we reported the method of using precursor preserving neopentyl-type labelling unit and lipophilicity tag. After the fluorination of the precursor purification is complete by using solid phase extraction producing ^{18}F]PET tracer with a high radioactive purity. However, by HPLC analyzing other than the target ^{18}F]PET tracer a small amount of non-radioactive by-products could be observed. These by-products are generated under the condition of heating and the presence of K.222 and potassium carbonate acetonitrile start self-polymerization and react with the precursor. In this presentation we isolate and determine the structure of the by-products generated from precursors in acetonitrile solvent in order to suppress the by-product formation.

Keywords : Positron emission tomography(PET); ^{18}F]Fluoride;

^{18}F]PET、放射性フッ素で生体認識分子を標識し、人体に投与することで体内の薬物動態を高感度高解析度で可視化することができる。 ^{18}F]PET トレーサーを簡便に精製するため、ネオペンチル骨格および脂溶性タグを導入した前駆体を開発した。この前駆体を放射性フッ素化した後、固相抽出により高い放射性純度で ^{18}F]PET トレーサーの合成を実現した。しかしながら、HPLC で分析したところ、 ^{18}F]PET トレーサー以外に、微量な非放射性不純物が確認されている。この副生成物はクリプトフックスと炭酸カリウムの存在下、アセトニトリル溶媒が自己重合を行った後、前駆体と反応することで形成されると判明した。本発表では、副生成物形成の抑制方法を検討するため、アセトニトリル溶媒中前駆体から生じる副生成物を単離し、構造決定を行った結果を報告する。

