

事後評価報告書

機関名：福井大学

大学等研究者名：高エネルギー医学研究センター 准教授 清野 泰

課題名：短半減期核種による標識化の新規合成法の開発 - [^{18}F]Fluorophenyl 化合物および [^{11}C]Acyl 化合物の新規合成法の開発

1. 目的

新規化合物の探索や創薬研究において、新規 PET トレーサー（ ^{18}F および ^{11}C 標識体）の開発は、欠かせない技術となってきた。 ^{18}F 標識体において汎用性の高い標識合成法が少ないことから、より構造的に制約が少なく汎用性の高い Phenyl 基に直接 ^{18}F を導入する標識化法の開発・検討を行う。さらに、半減期が短い ^{11}C 標識体においては、構造的に汎用性があると考えられる Acyl 基に ^{11}C 標識化する新規合成法の開発およびその導入法の検討を行うことを目的とする。

2. 成果の概要

芳香環フッ素化のための汎用性および反応性の高いと予想される置換基を有する化合物の合成法を確立することができた。

Cold 体で芳香環フッ素化反応を行なう際、通常の有機合成装置では、反応時間が 12 時間かかる。 ^{18}F の半減期（109.8 分）を考慮すると、標識化反応では、この反応条件は不適切である。これを解決するために、マイクロウェーブ合成装置を使用して反応時間の最適化を行い、12 時間から 20 分への短縮に成功した。

マイクロウェーブ合成装置で最適化した条件をもとに、標識合成の条件検討を試みた。サイクロトロンからは、 $^{18}\text{F}/\text{H}_2\text{O}$ で供給されるが、標識合成には不适当であり、より有用な化学種である、フッ化カリウム、フッ化テトラブチルアンモニウム、およびフッ化セシウムに変換した。それぞれの化学種において、プリカーサー量、反応温度および反応時間組み合わせ、それぞれの条件で合成を行なったが、現段階では目的物を得るに至っていない。現在反応条件の検討を継続中である。

3. 総合所見

企業研究者の活用により一定の成果が得られた。肝心の標識化反応が進行していないので、これをまず解決すべきと思われる。