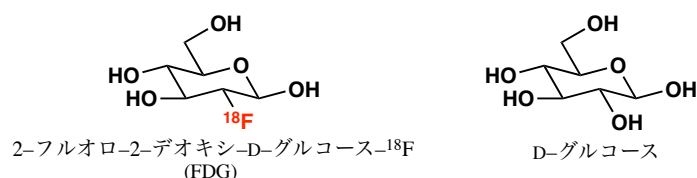


ノート 14.5 がん診断薬フルオロデオキシグルコースの合成：クリプタンドを用いた S_N2 反応

がんの診断に用いられる新しい技法の一つにポジトロン断層法 (positron emission tomography, PET) がある。これは陽電子を用いるコンピューター断層撮影技術であり、陽電子を出す放射性同位体として ^{18}F が用いられる。このフッ素同位体が陽電子を放出すると近傍の原子の電子と衝突して対消滅し、 γ 線を発生する。これが PET 装置で検知され、コンピューター画像処理によって ^{18}F が体内のどこにあるかわかる。

フッ素同位体は 2-フルオロ-2-デオキシ-D-グルコース (FDG) としてグルコースに組み込まれる。FDG をグルコースとともに摂取すると、増殖速度の大きい腫瘍細胞に多く取り込まれるので、がんの検査に用いることができる。



放射性同位元素の ^{18}F の半減期は約 110 分なので内部被爆の危険は少ない。しかし、FDG をすばやく合成して、直ちに用いることが重要になる。 ^{18}F は H^{18}O_2 のサイクロトロン放射によって K^{18}F 水溶液の形で製造され、次の反応式に示す方法で合成される。テトラアセタートとして保護されたグルコースの 2-トリフルオロメタンスルホナートの S_N2 反応を促進するためにクリプランドが用いられている。非プロトン性溶媒中で [2.2.2] クリプタンドが K^+ を取り込んでいるので、 F^- は溶媒和されず活性が高い。

