クロロホルムフリーで揮発性を抑えた211Atの効率的な濃縮法

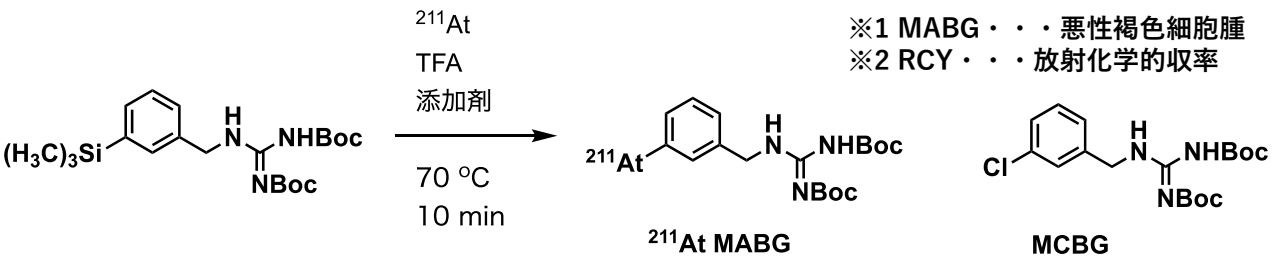
新技術の概要

安全性の高いアルコール溶媒で飛散なく効率的にアスタチンを濃縮できる。

アスタチン－２１１は次世代の標的α線治療に利用する有望なα線放出核種です。
現在、揮発性の高いアスタチンの濃縮するにはクロロホルムが使われていますが、クロロホルムは毒性が高く、クロロホルムから遊離する塩化物イオンが混入するなど、医薬品製造のための溶媒には適していません。
本技術では、アルコール溶媒でアスタチン－２１１を回収し、得られるアスタチン溶液に微量の炭酸塩や炭酸水素塩を添加することで、アルコール溶媒中でアスタチンを効率的に濃縮できます。

本発明の方法と従来法による^{211}At-MABG※1の製造方法の比較

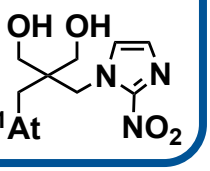
※1 MABG・・・悪性褐色細胞腫
※2 RCY・・・放射化学的収率



●本手法は、添加剤（NCS）なしで、^{211}AtMABGを従来法（$CHCl_3$濃縮法）よりも高効率に標識化することを明らかにしました。
●添加剤（NCS）を用いないために、不純物となるMCBGの生成量を50分の１に抑えられることを明らかにしました。
●本手法を用いて取り出した^{211}Atは、生体内で^{211}Atを安定に標識できるネオペンチルユニバーサル標識基に利用できます。
●自動合成装置を用いた臨床研究候補化合物の検討を始めています。

RCY（%）※2	アルコール濃縮（本発明）	クロロホルム濃縮（従来法）
添加剤あり	78	68
-	97	60

ネオペンチル
ユニバーサル標識基



自動合成装置（ME03）

本技術のアピールポイント

・毒性の高いクロロホルムの医薬品混入やハロゲン含有不純物の混入リスクの回避。
・自動合成装置適用でさらに高効率で高品質な標識化合物合成の実現が可能。

用途分野

セラノスティクス診断および利用薬剤の開発、分子イメージング技術

特許情報

発明の名称：アスタチンの簡便な濃縮法
発明者：田中 浩士
出願番号：PCT/JP2021/017415
（JP，US，FRに移行済み）
整理番号：19T168P/JP,US,FR

Institute of SCIENCE TOKYO

お問い合わせ先：
国立大学法人 東京科学大学　産学共創機構
ind.ip@adm.isct.ac.jp