

〔RADIOISOTOPES, 29, 539 (1980)〕

Synthesis of High Specific Activity 4-Hydroxyaminoquinoline 1-oxide [6-³H]

YUKIO MORI, KAZUMI TOYOSHI, AYUMI DENDA*, YOICHI KONISHI*

高比放射能 4-Hydroxyaminoquinoline 1-oxide [6-³H] の合成

森 幸雄, 豊吉一美, 伝田阿由美*, 小西陽一*

近年, 4-Hydroxyaminoquinoline 1-oxide (4-HAQO) をラットに単回投与することにより肺癌が形成されることから, 本実験系は発癌性の研究に対して有用な実験モデルであることが明らかにされた。標識 4-HAQO の合成についてはいくつかの報告がされているが, これらの標識体は発癌作用機構の *in vitro* での研究に主として用いられており, *in vivo* 研究に十分な比放射能を持っているとは云えない。そこで標識 4-HAQO の合成を, 高比放射能, 高純度ならびに標識位置の明らかな成績体が得られることが知られているトリチウムガス接触還元法で検討した。

Fig. 1 には, 6-bromoquinoline を出発物質に185 GBq (5 Ci) のトリチウムガスで接触還元することにより調製した quinoline [6-³H] から 4-HAQO [6-³H] を合成するルートを示した。すなわち, quinoline [6-³H] と quinolino の混合物を *m*-クロル過安息香酸で酸化すると quinoline 1-oxide [6-³H] が85%の収率で得られた。次に硫酸中で硝酸カリウムでニトロ化した 4-nitro quinoline 1-oxide [6-³H] を phenylhydrazine で還元して 4-HAQO [6-³H] を合成し, 得られた 4-HAQO は塩酸塩として再結晶することにより精製した。その結果, 放射化学的純度97% (ラジオろ紙クロマトグラフ法) で, 4.60 GBq (124 mCi) /mmol の高比放射能を有する 4-HAQO が合成された。またトリチウムガスおよびキャリアー (quinoline) の量を調節することにより, さらに比放射能を高くすることも可能である。

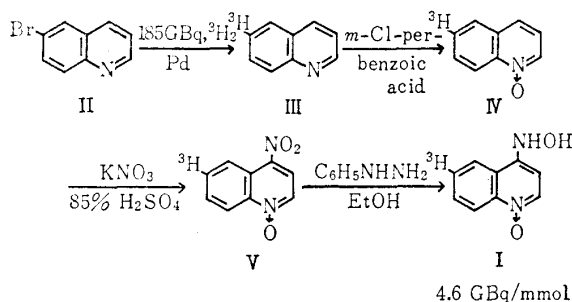


Fig. 1 Synthesis of 4-hydroxyaminoquinoline 1-oxide [6-³H]

* 奈良県立医科大学附属ガンセンター