

[³H]辛酰伯喹的制备

邵茹辛 (军事医学科学院六所, 北京 100800) 丁绍凤 (北京师范大学化学系, 北京 100082)

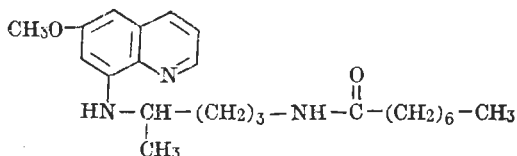
提要 氘气和二氧六环溶液中的辛酰伯喹, 经催化同位素交换, 制备了氘标记辛酰伯喹, 其比放射性为 63.5 mCi/mmol, 放化纯度大于95%.

关键词 辛酰伯喹; 氘标记; 氘气; 催化同位素交换

1981年1月9日收稿 1981年10月25日修回

辛酰伯喹是南京药学院研制的长效抗疟药⁽¹⁾。为了进一步研究其在体内的吸收、分布和排泄机理,我们采用催化气液交换法⁽²⁾,制备了氚标记辛酰伯喹。

辛酰伯喹是浅黄色针状晶体,分子式 $C_{23}H_{35}O_2N_3$, 分子量 385, 结构式



实验部分

在反应瓶中加入 193 mg 辛酰伯喹, 60 mg 氧化钫和 1.5 ml 二氧六环。然后将反应瓶接到真空系统上,用液 N_2 冷冻。真空抽至 10^{-3} mm Hg, 加热氚源铀粉瓶, 向反应瓶充氚气, 氚气压力为 100 mm Hg(约 1 ml 氚气), 在室温下, 电磁搅拌反应 5 h, 表观耗氚量为 0.5 ml。反应结束后, 用液 N_2 冷冻反应瓶, 回收剩余氚气, 过滤反应液, 除去催化剂。减压抽干滤液, 残渣用 4 ml 甲醇溶解, 再抽干, 重复 3 次, 以除去产物中不稳定位置上的氚原子, 即得到氚标记辛酰伯喹的粗品。

我们采用重结晶方法纯化产品。向粗制品中加入 45 ml 无水正庚烷, 加热溶解, 热滤, 冷却滤液, 析出浅黄色针状晶体, 再经滤集, 真空干燥后, 得 $[^3H]$ 辛酰伯喹纯品 87 mg。比放射性为 63.5 mCi/mmol。

Acta Pharmacologica Sinica 1982 Mar; 3 (1): 60—61

PREPARATION OF $[^3H]$ OCTANOYLPRIMAQUINE

SHAO Ru-xin (Academy of Military Medical Sciences, Beijing 100800)

DING Shao-feng (Beijing Normal University, Beijing 100082)

ABSTRACT $[^3H]$ Primaquine octylamide was prepared by catalyzed isotopic exchange between tritium gas and the compound in dioxane solution. The specific activity of the product = 63.5 mCi/mmol,

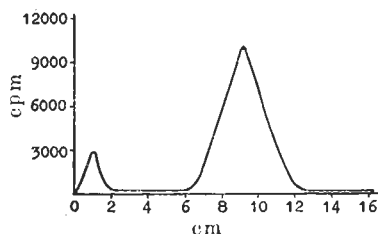


Fig 1. Radiochromatograph of $[^3H]$ primaquine octylamide on paper. Ethyl formate: petroleum ether(60-90°C) = 1:10

放化纯度的测定

产品的放化纯度采用放射性纸层层析测定。用微量 $[^3H]$ 辛酰伯喹甲醇滤液点在新华 1 号滤纸上, 进行上行层析。辛酰伯喹标准品用碘蒸汽显色, $R_F = 0.56$ 。活性纸条由原点至前沿每隔 1 cm 剪取 1 个样品, 用液体闪烁法分段测量, 所得放射性峰与辛酰伯喹标准品的显色点完全一致, 其结果如图 1 所示, 放化纯度大于 95%。

讨 论

催化气液交换法制备 $[^3H]$ 辛酰伯喹, 使用的 3H_2 压力只有 100 mmHg, 具有耗氚量少的优点, 所以此法制备 $[^3H]$ 化合物是一种简便、快速、有效、节省的方法。

参 考 文 献

- 1 南京药学院抗疟药科研组. 南京药学院学报 1979 年 9 月; (2):13
- 2 Buchman O, Pri-Bar I, Shimoni M. *J Label Comp Radiopharm* 1978; 14 (1):155

with a radiochemical purity over 95%.

KEY WORDS primaquine octylamide; tritium labelling; tritium gas; catalyzed isotopic exchange