

# [2-<sup>14</sup>C]-四氧嘧啶的合成

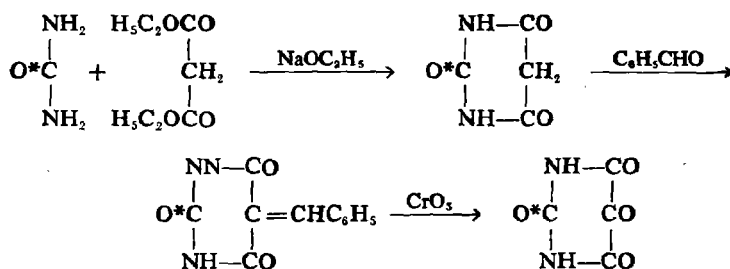
叶义芳 周楨堂 沈德群 王 耘

(中国科学院上海原子核研究所)

关键词: 四氧嘧啶 碳-14 标记化合物

四氧嘧啶能破坏胰岛细胞而引起糖尿病。医学上用它使动物致糖尿病, 作为病理研究的模型; 我们以<sup>14</sup>C标记它, 供动物体内分布试验和基础医学研究使用。

1952年 M. L. Tamayo 等人首先合成 2-<sup>14</sup>C-四氧嘧啶<sup>[1]</sup>, 是以<sup>14</sup>C-脲素与丙二酸二乙酯缩合制得 [2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸, 再与苯甲醛反应生成5-苄叉巴比妥酸, 然后用氧化铬氧化成四氧嘧啶。其化学反应式如下:



1961年 F. Pochon 等<sup>[2]</sup>再次按上述路线合成, 三步的化学总产率为 38%。我们采用直接氧化 [2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸, 得到 [2-<sup>14</sup>C]四氧嘧啶。二步的化学总产率为 50%。

## 1. [2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸的合成

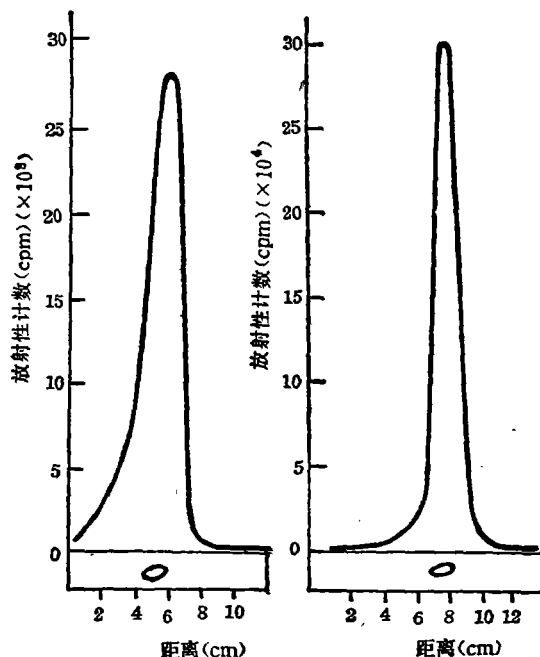
称取<sup>14</sup>C-脲素 31.7mg (比度 165 $\mu$ Ci/mg) 和载体脲素 68.3mg, 置反应瓶中均匀混合。然后加入以 33mg 金属钠与 0.9ml 无水乙醇制成的乙醇钠溶液, 再加入 0.7ml 丙二酸二乙酯的乙醇溶液 (0.62ml 丙二酸二乙酯溶于 1ml 无水乙醇中)。在 108 $^{\circ}$ C 的油浴中搅拌回流反应 6 小时。在反应过程中有白色固体析出, 冷却到室温后, 用 3.7ml 稀盐酸酸化, 白色固体溶解。放置冰箱内过夜, 有白色结晶析出。过滤, 结晶用冰蒸馏水洗涤数次, 干燥, 即得 [2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸产品, 重量为 131mg, 比度 2.84ml/mM, 化学产率 62%, 放化产率 56%。

## 2. [2-<sup>14</sup>C]-四氧嘧啶的合成

称取 160mg 氧化铬, 溶于 0.9ml 冰醋酸和 0.1ml 蒸馏水中, 在室温下搅拌 15 分钟, 然后将上述的 [2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸 100mg 分批加入。加完后, 再在 40 $^{\circ}$ C 的水浴中继续搅拌反应 45 分钟, 得深褐色反应液。在冰箱内放置数小时使沉淀析出完全。过滤, 固体用冷的冰醋酸洗涤数次, 得米黄色固体即为四氧嘧啶, 经干燥后, 产品重 90mg, 比度 2.46mCi/mM, 化学总产率 81%, 放化产率 72%。

## 3. 分析鉴定

[2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸和 [2-<sup>14</sup>C]-四 (下转第 56 页)



图左: [2-<sup>14</sup>C]-巴比妥酸

右: [2-<sup>14</sup>C]-四氧嘧啶

镍, 再接15~20ml, 钴的回收率达99%, 铜还没有下来。若料液中铜的含量很大时, 使钴、铜分离变坏甚至分不开。

### 3. 热靶处理

镍靶照后用10N盐酸溶解(微热), 通过预先装好的717型树脂柱收集流过的料液, 过两周后再上柱分离<sup>57</sup>Co, 用4N盐酸淋洗, 收集<sup>57</sup>Co产品液。<sup>57</sup>Co产品中稳定性钴、铜、铁、银等均检不出。<sup>57</sup>Co核纯大于98%。

## 参 考 文 献

- [1] T. A. Kitchens, *Phys. Rev.*, 138A, 467 (1965).
- [2] Ю. Т. СЕВАМБАНОВ и Др., *радиохимия*, 156, 841, (1973).
- [3] A. Ewert. and M. Blam., *J. Inorg. Nucl. Chem.*, 27, 967 (1965).
- [4] M. Y. Mirza et al., *Radiochim. Acta*, 20, 135 (1973). (1983年5月16日收到)

—————  
(上接48页)

(1) 正常人肾图 静脉注射<sup>125</sup>I-邻碘马尿酸后约10秒钟, 可见迅速上升的血管段, 随后出现斜形上升的分泌段, 高峰出现时间在4分钟, 以后出现逐渐下降的排泄段, 三段界限分明。与<sup>131</sup>I-邻碘马尿酸肾图比较, 二者图形基本一致(图1)

(2) 梗阻型肾图 患者静注<sup>125</sup>I-邻碘马尿酸后, 右肾血管段上升迅速, 随后出现持续上升的分泌段, 逐渐升高, 未见排泄段。表现出所谓梗阻型肾图。患者右输尿管结石(X线片证实)。左肾血管段、分泌、排泄段清晰可见, 左肾功能无异常。与<sup>131</sup>I-邻碘马尿酸肾图对照, 二者图形相似(图2)

(3) 无功能肾图 患者静注<sup>125</sup>I-邻碘马尿酸后, 右肾可见降低的血管段, 未见分泌、排泄段, 成水平线, 峰顶消失。患者右肾因严重肾盂积水而丧失功能与X线静脉造影结果相符。左肾可明显的看到血管段、分泌、排泄段。左肾功能无异常。与<sup>131</sup>I-邻碘马尿酸肾图比较, 二者完全一致(图3)。

通过13例<sup>125</sup>I-邻碘马尿酸肾图检查, 受检者未见不良反应。

## 三、讨 论

放射性核素标记邻碘马尿酸是公认的肾功能检查剂。<sup>125</sup>I与<sup>131</sup>I标记的马尿酸相比较, 因为使用的标记化合物均是邻碘马尿酸, 二者化学性质相同, 均为NaI, 经动物实验, 放射自显影、临床应用, 二者结果基本相同。但二者相比, <sup>125</sup>I的辐射剂量极小<sup>[5]</sup>, 更适于儿童及孕妇的检查。

本文<sup>125</sup>I由中国科学院上海原子核研究所提供, 邻碘马尿酸由中国科学院原子能研究所提供, 特此致谢。

## 参 考 文 献

- [1] 帮豫增等, *中华医学杂志*, 52, 289(1966).
- [2] J. M. Henk et al., *Brit. J. Radiol.*, 40, 327 (1967).
- [3] A. Gottschalk et al., *Diagnostic nuclear medicine, baltimore Williams and Willikins*, 1976, P.446.
- [4] C. Robert et al., *J. Nucl. Med.*, 2, 168 (1980).
- [5] G. J. Hine et al., *J. Nucl. Med.*, 11, 468 (1970). (1982年3月23日收到)

—————  
(上接第59页)

氧嘧啶的纯度采用纸层析法鉴定。巴比妥酸的层析系统为: 正丁醇:冰醋酸:水=5:2:1(V/V)。四氧嘧啶的层析系统为: 正丁醇:冰醋酸:水=5:2:3(V/V)。产品经层析后仅出现一个放射性高峰, 未见有杂质峰, 高峰值与标准品R<sub>f</sub>值相同(见图), 放化纯度>95%。

## 参 考 文 献

- [1] M. L. Tomayo et al., *Chem. Abstr.* 48, 1278d (1952).
- [2] F. Pochon et al., *ibid.*, 55, 25967h (1961). (1983年9月20日收到)

## **Separation of $^{57}\text{Co}$ from irradiated nickel target**

Zhang Weicheng Wang Zhongyang Song Aibao Su Denggui

*(Institute of Modern Physics, Academia Sinica)*

In this paper separation of  $^{57}\text{Co}$ -Ni, Cu by ion-exchange method is described. In 9N HCl nickel passes easily through the column, leaving Co and Cu in the column.  $^{57}\text{Co}$  is eluted by 4N HCl with copper remaining on the column.

**Keywords:**  $^{57}\text{Co}$  ion exchange separation

## **The shielding design of 50 kCi cesium-137 panoramic irradiator**

Zhou Qichang Zhang Qiuyue Fu Junjie

*(Institute of Atomic Energy for Application, Zhejiang Academy of Agricultural Sciences)*

An irradiation facility of  $^{137}\text{Cs}$  gamma source, has been established in Hangchow and functioned normally since then. The intensity of  $^{137}\text{Cs}$  gamma source used is 50 kCi. The source is composed of a cast cylinder of  $^{137}\text{Cs}$  chloride, doubly encapsulated in high integrity stainless steel casting filled with helium and sealed by welding. The dimensions of the cylinder were 52 mm in outer diameter and 480 mm in length, having characteristics of a single line source. The pool is 5 m in depth under the floor locating at the center of the cave. The source is arranged on the elevator frame. The top end of the source was kept 3 m under water level, so that it can meet the need of safety requirement of 2.68 m under the water level. The irradiation cave was shielded with concrete wall of 1.56 m for the sake of residents safety nearby. The roof of the cave was designed in arched form.

This pool type designs, in comparing with dry-well type is more simple, safe, and easy to operate and repair etc.

**Keywords:** cesium-137 irradiation cave irradiation shielding pool

## **Synthesis of carbon-14 labelled alloxan**

Ye Yiefang Zhou Zentang Shen Dequn Wang Yun

*(Shanghai Institute of Nuclear Research, Academia Sinica)*

This paper describes synthesis of 2- $^{14}\text{C}$ -Alloxan from  $^{14}\text{C}$ -urea condensation with malonic ester to form barbituric acid, and directly oxidization of it by chromium oxide. The yield of two steps was 50%. The chemical and radiochemical purities of Alloxan assessed by paper chromatography were over than 95%. The specific activity of barbituric acid was 2.84 mCi/mmol and that of Alloxan was 2.46 mCi/mmol.

**Keywords:** alloxan carbon-14 labelled compound