



Revista Española de Medicina Nuclear e Imagen Molecular



CO088 - CONJUGADOS ORGANOTRIFLUOROBORADOS PARA BNCT: REACCIONES DE INTERCAMBIO RADIOISOTÓPICO PARA IMAGEN PET

Álvaro Erhard García¹, Laura Confalonieri², Daniela Imperio², Marcin Balcerzyk³ y Luigi Panza²

¹Hospital Universitario Costa del Sol, Marbella, España. ²University of Eastern Piedmont Amedeo Avogadro, Novara, Italia. ³IKERBASQUE, Basque Foundation of Science, Bilbao, España.

Resumen

Introducción: La terapia de captura neutrónica en boro (BNCT) es un tratamiento contra el cáncer basado en la incorporación de compuestos borados en el tumor y posterior irradiación con neutrones, generando partículas alfa de elevada transferencia lineal de energía.

Objetivo: El objetivo principal es la síntesis y análisis de la biodistribución de derivados, conjugados a un resto de trifluoroborato.

Material y métodos: La síntesis se basó en la estructura: monosacárido -Linker- trifluoroborato. La citotoxicidad se evaluó en cultivos de fibroblastos humanos (ATCC) y ensayo MTT con [0,001-1 mM]. La estabilidad se analizó mediante espectroscopía [19 F]-NMR. Para el radiomarcaje se empleó una disolución ácida de [18 F]-flúor, sobre la que se disolvió el compuesto y se incubó 85 °C, 20 min, seguido de purificación y evaluación de la pureza y estabilidad in vitro mediante radioTLC. La biodistribución se analizó mediante microPET/CT en ratones Balb/C sanos y utilizando [18 F]FDG como control.

Resultados: Los compuestos se sintetizaron (pureza > 95%). En una concentración de 1 mM, el compuesto seleccionado redujo la viabilidad celular y la estabilidad mostró un comportamiento de hidrólisis (vida media 72 h). El radiomarcaje proporcionó un rendimiento del 49,88% y la pureza fue del 97,2%. A 37 °C, el compuesto radiomarcado se mantuvo estable 1 hora en plasma humano y 100 minutos en solución salina. Los resultados de la biodistribución mostraron que el radiofármaco se metabolizó en hígado y no atravesó la barrera hematoencefálica, mostrando así diferencias con la [18 F]FDG.

Conclusiones: La síntesis de azúcares que contienen la estructura tri fluoroborato (-BF 3) es factible de una manera simple, eficiente y rápida. El radiomarcaje con flúor [18 F] permite el análisis de la biodistribución en este tipo de compuestos, con una estabilidad aceptable. Por otra parte, este compuesto parece ser bastante tóxico para aplicaciones de BNCT. El descubrimiento de un candidato potencial teranóstico para BNCT sigue siendo un gran desafío para los investigadores.