

CNEA-296

REPUBLICA ARGENTINA
COMISION NACIONAL DE ENERGIA ATOMICA

PREPARACION DE IODOURACILO CON YODO 131

por

Eleon L. Quiñillán y Aldo E. A. Mitta

BUENOS AIRES

1971

Quihillalt, Elena L.
Preparación de iodouracilo con yodo 131. Buenos Aires, Comisión Nacional de Energía Atómica, 1971.

7 p. 27 cm. (CNEA-296)

Acidos nucleicos. Mitta, A.E.A.

577.155

Nº 0685

REPUBLICA ARGENTINA
COMISION NACIONAL DE ENERGIA ATOMICA

PREPARACION DE IODOURACILO CON YODO 131

por

Elena L. Quihillalt* y Aldo E. A. Mitta*

BUENOS AIRES

1971

INIS CLASSIFICATION AND KEYWORDS

D 14

IODINE 131
URACILS
LABELLED COMPOUNDS
ORGANIC IODINE COMPOUNDS
ISOTOPIC EXCHANGE
RADIOCHEMISTRY
CHEMICAL REACTIONS
RADIOLYSIS
TEMPERATURE
PREPARATION
IMPURITIES
THIN-LAYER CHROMATOGRAPHY
ELECTROPHORESIS
CHLORAMINE

PREPARACION DE IODOURACILO CON YODO 131

Elena L. Quihillalt* y Aldo F.A.Mirra*

RESUMEN

Se describe un método para preparar iodouracilo 131 I por intercambio isotópico, con un rendimiento radioquímico de 100 % en pocos minutos.

Se estudió el efecto de diversas variables, tales como iluminación, temperatura, masa de oxidante y tiempo de reacción. También se estudió la estabilidad del producto.

SUMMARY

A method to prepare iodouracil 131 I by isotopic interchange is described which gives a 100 % radiochemical yield in a few minutes. The influence of several variables such as: light, temperature, mass of oxidant and time of reaction was studied, as well the stability of the product.

*Comisión Nacional de Energía Atómica.

INTRODUCCION

Los precursores en la síntesis de ácidos nucleicos marcados con isótopos de iodo son útiles en el estudio del crecimiento celular, ya que estos precursores aventajan a los marcados con ^{14}C y ^3H por cuanto éstos requieren técnicas trabajosas para su medición.

En el presente trabajo describimos un método de preparación en pocos minutos, de iodouracilo marcado con ^{131}I con un rendimiento radioquímico prácticamente del 100 %.

PARTE EXPERIMENTAL

Técnica de marcación.

Se toman 23,8 mg (0,1 mM) de iodouracilo y se disuelven en 1 ml de HONa 0,1 M, se ajusta con ácido acético 0,1 M a pH 7 utilizando un peachímetro y lleva a 10 ml con agua destilada. De esta solución se toma 1 ml (0,01 mM) y se coloca en un tubo de centrifuga de 5 ml de capacidad provisto de tapón esmerilado. Se añade 1-3 mCi de yoduro de sodio radiactivo sin portador ni reductor. Se agrega 0,25 ml de solución de cloramina T recién preparada (2 mg/ml). Se tapa, se deja 10 minutos a temperatura ambiente y luego se le añade 2-3 gotas de una solución de $\text{S}_2\text{O}_3\text{Na}_2$ 0,1 M para detener la reacción. El rendimiento radioquímico es de 100 %. Se esteriliza pasando por Millipore de $0,45\mu$.

Controles

Se midió la radiactividad del producto con una cámara de ionización Mediac modelo 6362 de Nuclear Chicago.

Se determinó pirógenos y estérilidad de acuerdo a la Farmacopea Argentina.

Se determinó radioyoduros inorgánicos:

- a) Cromatografía en capa delgada (4). Soporte: silicagel G (Merck); solvente: butanol saturado con ácido acético 0,1 M; tiempo de desarrollo: 180 minutos; Rf iodouracilo ^{131}I : 0,84; Rf yoduros ^{131}I : 0,48.

b) Cromatografía en capa delgada (5). Soporte: silicagel G (Merck); solvente: benceno - dioxano - ácido acético (90:25:4); tiempo de desarrollo: 60 minutos; Rf iodouracilo ^{131}I : 0.46; Rf yoduro ^{131}I : 0.0.

c) Electroforesis en papel Whatman N°3 MM; solución amortiguadora: ácido acético - acetato de sodio 0.075 M, pH 5.5, $\mu=0.1$ durante 45 minutos con una corriente de 2.5 mA por tira. Movilidad de los yoduros: 10 cm; iodouracilo ^{131}I : 0.

En todos los casos, las tiras y las placas se valoran radiométricamente mediante un radioscanner Packard modelo 7200 y las áreas resultantes se determinan por pesada o planimetría.

Variables

Se estudió el efecto de diversas variables, tales como: temperatura, masa de oxidante, etc.

EFFECTO DE LA TEMPERATURA

0.01 mM de iodouracilo; 0.8 mCi de yoduro de sodio radiactivo; pH 7; 15 minutos.

Nº	Temperatura °C	Rendimiento %
1	12	100
2	30	100
3	100	100

EFFECTO DE MASA OXIDANTE Y TIEMPO DE REACCION

0.01 mM iodouracilo; 1 mCi yoduro de sodio radiactivo; pH 7; 15 minutos; 30°C.

Nº	Cloramina T (mg)	Rendimiento Tiempo (minutos)		
		1	5	10
1	0.5	98	100	100
2	0.05	90	98	98
3	0.005	---	5	50

EFFECTO DE LA ILUMINACION

En este caso no es importante la presencia de luz, habiéndose obtenido iguales resultados en ausencia de la misma.

Estabilidad

Se estudió la estabilidad del iodouracilo ¹³¹I, durante seis días, en distintas condiciones, como se muestra en la tabla siguiente.

Tiempo (días)	Rendimiento %			
	1.26 mCi/mg (3 mCi/ 2.5 ml)		0.4 mCi/mg (1 mCi/ 2.5 ml)	
	4°C s/ilum. T° amb.c/ilum		4°C s/ilum. T° amb.c/ilum	
1	97	97	100	100
2	97	97	100	100
3	88	80	100	100
4	80	75	100	100
5	75	70	100	100
6	---	---	100	100

Conclusiones

Se describe un método rápido y sencillo para marcar iodouracilo ¹³¹I que evita manipular material radiactivo, ya que el rendimiento de reacción permite no tener necesidad de purificar el producto.

BIBLIOGRAFIA

1. RUSOFF, W.H. y col., *Cancer Research* 13, 221 (1953).
2. SILVESTER, D.J. y WHITE, N.D., *Nature* 200, 4901, 65 (1965).
3. BUI, N.M., GUILLET, R. y DOMIT, F., *Int. J. Appl. Radiat. Isotopes* 6, 337 (1965).
4. MASSAGLIA, A., ROSA, U. y SOSI, S.J., *Chromatog.* 17, 316 (1965).
5. The Radiochemical Centre Data Sheet 8357 - England.
6. Manual de Controles Radiofarmacéuticos C.N.E.A. (1970).

