

## 一般演題 E 放射性医薬品 (36~45)

## 36. アルブミンのテクネチウム標識化における鉄, アスコルビン酸の関与

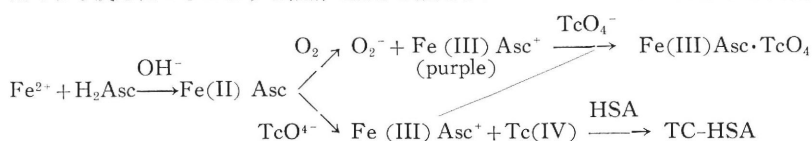
京都大学 薬学部

横山 陽 小南 悟郎 原田 重徳  
田中 久

〔目的〕 鉄-アスコルビン酸 (以下 Fe-Asc) を用いるアルブミン (以下 HSA) の  $^{99m}\text{Tc}$  標識は従来からよく行なわれているが, その反応機構についてはほとんどわかっていない. 演者らはこのラベル化機構を明らかにすることを目的とし, 先に報告したように<sup>\*1</sup>, まず Fe-Asc 錯体生成反応を速度論的に検討した. 今回は  $\text{TcO}_4^-$  の還元, および HSA の標識化と Fe-Asc 生成との関係を求め, さらに得られた結果を基にして標識化の改良を試みた.

〔実験〕 Fe,  $\text{H}_2\text{Asc}$ , HSA および  $^{99m}\text{TcO}_4^-$  を種々の条件下で反応後, 各  $^{99m}\text{Tc}$  成分を Sephadex G 50 カラム法で分割し, HSA Tc の取り込み率を求めた.

〔成果, 結論〕  $^{99m}\text{Tc}$  標識化は Fe (II) と  $\text{H}_2\text{Asc}$  の酸性溶液に,  $^{99m}\text{TcO}_4^-$  を加え, 適当な PH に調整後 HSA を加えることにより行なわれる. この際, 反応時の PH および Fe/ $\text{H}_2\text{Asc}$  の存在比が HSA の  $^{99m}\text{Tc}$  の取り込みに大きな影響を与える. さらに  $^{99m}\text{Tc}$  の取り込みと PH および Fe/ $\text{H}_2\text{Asc}$  との関係を詳しく調べたが,  $^{99m}\text{TcO}_4^-$  の還元 Fe(II) Asc 錯体が関与するとすれば説明できる結果が得られ, 前報の研究成果を考えあわし反応はつぎのような機構で進むと推定された.



$^{99m}\text{TcO}_4^-$  の還元の全てがこの反応機構に従っているとは云えないが, この機構から少なくとも  $\text{O}_2$ , および  $\text{Fe}^{3+}$  の存在が  $^{99m}\text{Tc}$  標識化に不利であると予想される. 実際に  $\text{N}_2$  気流中での実験, および  $\text{Ee}_3^+$  と特異的な反応で知られている deferoxamine を用いて標識化を試みたが, 従来の方法と比較すると遙かに高い  $^{99m}\text{Tc}$  の取り込みが認められた. 現在さらに詳しく検討中であるが, これは HSA に限らず, 一般に  $^{99m}\text{Tc}$  の新しい標識化法として期待される.

\*1 日本薬学会第92年会発表

37. Electrolysis による  $^{99m}\text{Tc}$  標識第1報  $^{99m}\text{Tc}$ -Albumin,  $^{99m}\text{Tc}$ -Microsphere

ダイナボットラジオアイソトープ研究所

酒匂 歳弘 池田 勲夫 杉沢 慶彦  
倉田 邦夫 加藤 貞武

〔目的〕  $^{99m}\text{Tc}$  による標識には,  $^{99m}\text{TcO}_4^-$  を還元して用いるが, これに使用する種々の還元剤にもそれぞれ長短があり, ルティーンの標識方法としては, まだかなりの問題点を残している. それらの中で, Benjamin らによって報告された, 電解法による  $^{99m}\text{Tc}$ -Albumin の標識は, 装置についての難点はあるが, 試薬の調整などに関しては, 他法に比較してかなりすぐれた方法である. しかし, 彼等の方法にも種々の疑問点があり, 再検討の必要性があるものと思われたため, われわれは簡易な反応装置の試作および,  $^{99m}\text{Tc}$ -Albumin,  $^{99m}\text{Tc}$ -Microsphere について, それによる標識化の検討を行なったので報告する.

〔方法〕 電解装置は, 30ml のバイアルに Electrode を封入し, 攪拌しつつ, 定電流にて Electrolysis させるものである. Electrode として cathode に Pt, anode に Sn または Zr を使用した. Electrolyte は 1N HCl 0.3ml,  $^{99m}\text{TcO}_4^-$  soln. 4 ml に Albumin, Microsphere を適当量加え, 電流量を変化させて標識した. 標識されたものの yield は, paper chromatograph, paper electrophoresis によって同定した. こうして得られた  $^{99m}\text{Tc}$ -

Albumin は, 家兎を使用し,  $^{131}\text{I}$ -人血清アルブミンとの比較検討を行ない,  $^{99m}\text{Tc}$ -Microsphere は, マウスを使

用し, Liver/Lung について検討を加えた.

〔結果〕  $^{99m}\text{Tc}$ -Albumin については, Pt-Zr 系が反応収率がよく, 約9クーロンにて70%以上の Yield が得られ, しかも Electrolysis 後, 約10分放置する事により反応が進行し, 95%以上の Yield が得られる事がわかった. また, 家兎による  $^{131}\text{I}$ -人血清アルブミンとの比較においても有意差は認められなかった.  $^{99m}\text{Tc}$ -Microsphere については, Pt-Sn 系がすぐれており, 約6クーロンにて96%以上の Yield が得られ, Liver/Lung は10以上であった. 以上の事から総合すると, Electrolysis 法による  $^{99m}\text{Tc}$  の標識は, 無菌的に標識する事ができ, し