

一般演題 E

103. テクネチウムとアスコルビン酸との反応

京都大学 薬学部

横山 陽 小南 悟郎 田中 久

テクネチウム-アスコルビン酸キレート (以下 Tc-Asc と略) は種々の ^{99m}Tc 標識放射性医薬品合成の際に、最も重要な役割を演じることが予想されるが、その化学的性質についての知見は全く得られていない。この性質を明らかにすることにより、良い Tc 標識化法が得られ、さらにはより正確な診断が行なえるようになることが期待される。

〔実験法〕 Tc として、 $\text{NH}_4\text{TcO}_4\text{-}^{99}\text{Tc}$ を用い、主に可視部の吸収スペクトルでキレート生成反応をしらべた。

〔結果、考察〕 一般に Tc 標識放射性医薬品中の Tc は 4 価、または 5 価の状態にあると云われている。Tc と Asc との反応においても、7 価の TcO_4^- と Asc とを単に混ぜ合わせても吸収スペクトルに変化をみせないが、長時間放置後か、あるいは加熱すると、はじめて 490 nm に吸収極大を示すようになる。一方、大過剰の Asc の存在下 TcO_4^- 溶液に SnCl_2 塩酸溶液を加えると、可視部に大きな吸収を示すようになり、Tc は還元後、Asc と反応することが明らかにされた。しかしこれらの吸収スペクトルは Tc: Asc の濃度比、pH および反応時間などに依存して複雑に変化することが認められた。一方、 TcCl_6^{2-} [Tc(IV)]、 TcOCl_4^- [Tc(V)] を別に合成し、これらの塩酸溶液を出発物質として Asc の反応をしらべた。 TcCl_6^{2-} と SnCl_2 還元で得られる Tc との Asc に対する反応性はほとんど同じであり、この結果は少なくとも SnCl_2 還元では 4 価の Tc から得られる Asc キレートを与えることを示している。さらに Asc と構造類似の Tc キレート生成が予想される Tiron との反応を比較し、また、Tc-Asc 結晶の単離、磁気モーメントの測定などから、この反応にはキレートの加水分解、多量体生成、さらに Tc(IV)-Tc(V) の酸化などの反応が組み合っていることがわかった。今後、種々の方法での実験結果とあわせて、溶液中での存在種、およびそれらの反応性について詳しく検討する。

放謝性医薬品

104. 塩化第一錫を用いる ^{99m}Tc インスタント標識法に関する基礎的検討

京都大学 放射線部

藤田 透 森 徹
放射線科

伊藤 春海 石井 靖 鳥塚 莞爾

^{99m}Tc はシンチグラフィに最適の核種であり、標識も容易であることから、その臨床利用は殆ど全臓器に及び、日々利用度が高まっている。我々は既に塩化第一錫を用いる ^{99m}Tc 標識法を開発し、各種標識物質の臨床利用につき報告して来た。

今回我々は標識時の術者の被曝軽減、標識条件の均一化及び利用の一般化を意図し、被標識物質をアイソトープを含まない化学処理を行なった後凍結保存し、必要時に $^{99m}\text{TcO}_4^-$ を混じるのみで簡単に標識を行ないうる所謂インスタント標識法について若干の基礎的検討を行なったので、その成績を報告する。

〔方法〕 人血清アルブミンを被標識物質として用いた。人血清アルブミン (HSA) の生理食塩水溶液に新鮮に塩化第一錫酸性溶液を加え、希塩酸により pH を 2.5 ~ 3.0 に調整し、5 分間室温で攪拌する。次いで重曹液にて pH を中性に戻し、0.22 μ のミリポアフィルターを通した後凍結乾燥し、 N_2 ガスを充填して密栓の上 -20°C に保存した。標識時には室温で $^{99m}\text{TcO}_4^-$ 溶液を加え 1 ~ 2 分間混和した。標識効率及び標識物の性状の検討はセファデックス G-50 ゲル濾過によって行なった。

〔成績〕 1) HSA 量に関する検討——50 μg の塩化第一錫に対し HSA 量を変えた場合、30 mg 以上の使用が優れた。2) 塩化第一錫量に関する検討——50 mg の HSA に対して 100 μg 以下の量で充分であり、過量では却って効率が劣る。3) 保存に関する検討——前処理後そのまま凍結した場合短期間で効率は低下した。処理後 N_2 ガスを充填した場合は約 2 週間有効であり、更に前処理後凍結乾燥し、 N_2 ガスを充填して密栓の上保存したものは長時間保存しても標識効率は著明な低下を示さなかった。

〔断案〕 インスタント標識法を検討し、一応所期の目的を果たし、有用性を認めた。現在 HSA 以外の物質についても検討中であり、このインスタント法は今後広範囲に利用されうと考える。