

C. 放射性医薬品・核種

- 46 RIHSAよりもすぐれた ^{67}Ga 標識HSA
横山 陽, 大桃善朗, 田中 久(京大, 薬)
佐治英郎, 石井 靖, 島塚莞爾(京大, 医, 核放
科)

核医学診断に有用な生理活性タンパク質のRI標識は、現在ヨウ素標識が唯一の満足できる方法であるが、 $^{99\text{m}}\text{Tc}$, ^{67}Ga , ^{68}Ga , ^{111}In 等放射能的に秀れた金属RIによる標識が期待されている。そこで、一方にこれら金属RIとの安定なキレート形成能をもち、他方にタンパク質との結合能を有するBifunctional Chelating Agentを用いる標識方法が注目されている。

我々は、DeferoxamineのBifunctional Chelating Agentとしての特性に着目して、これによる極めて安定なヒト血清アルブミン(HSA)の ^{67}Ga 標識体を得ることに成功した。

DeferoxamineをGlutaraldehyde二段階法でHSAにカップリングさせ、 ^{67}Ga で標識した。 ^{67}Ga -HSAはin vitroで極めて高い安定性を示した。in vivoでもラットを用いた血液からのクリアランスの検討は、 ^{67}Ga -HSAが市販の ^{131}I -HSAよりもその異化速度が遅く、又、マウスでの各組織への分布は、各臓器の血液量を如実に反映する結果を示した。

以上の結果は、 ^{67}Ga -HSAが従来のRIHSAを凌ぐ秀れた放射性医薬品であることを示している。

- 47 $^{18}\text{O}(\text{p}, \text{n})^{18}\text{F}$ 反応による ^{18}F の生産と、その利用法について
入江俊章, 福士 清, 井戸達雄(放医研)

$^{18}\text{O}(\text{p}, \text{n})^{18}\text{F}$ 反応による ^{18}F の生産法は、その他の核反応による生産法にくらべ、高い収率で ^{18}F を得ることが可能であり、エネルギーの低いサイクロトロンによる ^{18}F の生産にも適している。しかし、 ^{18}F は水溶液で生産され、かつターゲット物質である高濃縮 ^{18}O -水が高価である欠点がある。今回、本反応を用いた、 ^{18}F の生産率及び、ターゲット水の回収方法と ^{18}F の捕捉方法とその標識合成への利用法について検討した。Ep17.2 MeV (incident)、3~10 μA で、種々の ^{18}O 濃度の水を照射し、 ^{18}O -100%で262.9 mCi/ $\mu\text{A}\cdot\text{sat}$ の結果を得た。また本照射条件下での、放射線分解による水の損失は、殆んど無視しうるものであった。照射水は、carrier KFを加えた蒸留法、F型樹脂捕捉法により、 ^{18}O -水の回収と、 ^{18}F の標識試薬としての捕捉を行なった結果、いずれの方法でも、簡便に、 ^{18}O -水は、90%以上の収率で回収、再使用が可能であり、 ^{18}F の捕捉も、ほぼ完全で、従来進めてきた方法と同じように、置換反応による ^{18}F -標識試薬として利用でき、 ^{18}F -アミノ酸、ステロイド類の標識合成に応用を行なった。

- 48 医用有望核種 $^{195\text{m}}\text{Pt}$ の光核反応による無担体調製
天野良平(金大・医短) 八木益男(東北大・核理研) 安東 醇(金大・医短) 森 厚文(金大・RIセンター) 久田欣一(金大・核医)

近年、白金金属錯体の抗腫瘍剤の発展とともに、白金の放射性同位体による標識化合物の研究が望まれている。WolfらやLangeらにより、 $^{195\text{m}}\text{Pt}$ および $^{193\text{m}}\text{Pt}$ の放射性核種により標識した化合物の体内分布に関する研究が行なわれた。しかし、これら両核種は原子炉照射による $^{194}\text{Pt}(\text{n}, \text{r})$ および $^{192}\text{Pt}(\text{n}, \text{r})$ 反応により製造されたものであるため、無担体でなくその使用に限界が生じた。本報告では無担体 $^{195\text{m}}\text{Pt}$ の調製法について述べる。東北大学核理研の電子線リニアックの30~60 MeV加速電子を、0.7 輻射長の白金コンバーターを用いて制動放射線に転換し、試料(Au金属片)を照射した。照射後 $^{197}\text{Au}(\text{r}, \text{pn})^{195\text{m}}\text{Pt}$ の光核反応で生成した $^{195\text{m}}\text{Pt}$ を、放射化学分離(MIBK溶媒抽出法、陽イオン交換法)により $^{195\text{m}}\text{Pt}$ を得た。放射性核種の純度は極めて高いものであった。 $^{195\text{m}}\text{Pt}$ 生成率は30~45 MeVで急激に増加し、それ以上では徐々に増加する傾向を示した。本電子リニアックの60 MeV加速で通常出力、平均電流200 μA で10時間照射すれば、Au 1g 当り0.5 mCiの $^{195\text{m}}\text{Pt}$ が製造できることがわかった。

- 49 固定化酵素を利用した ^{13}N 標識グルタミン酸の合成について。
福士 清、*玉手和彦、*鈴木和年、井戸達雄、岩田 鍊、入江俊章 (放医研、臨床、*技術)

^{13}N は半減期10分の β^+ 核種で、アンモニアや窒素ガス等の比較的単純な構造の分子が化学合成され、臨床利用されている。アミノ酸を合成する場合に、(1)反応時間が短かく、(2)反応が特異的であり、(3)放射化学収率が高い、等の理由で酵素合成が有利である。そして、固定化酵素は、(4)除蛋白が不要で、(5)カラム法による合成の自動化が可能で、理想的な合成法である。(固定化酵素の調製)(1) Corning社の多孔性ガラスビーズ(COOH-CPG)を、N-hydroxysuccinimide、カルボジイミドと反応、活性化した。(2) Pharmacia社のCNBr活性化Sephrose-4B。(1)、(2)の支持体1gに対して、10mgのグルタミン酸脱水素酵素を加えて反応させた後、未反応の酵素を除去した。(^{13}N -グルタミン酸の合成)固定化酵素1~2gを小カラムに詰め、基質、補酵素、 $^{13}\text{NH}_3$ の混合液をペリスタポンプを用いたフロー系で合成し、未反応の $^{13}\text{NH}_3$ を陽イオン交換樹脂カラムを通し、除いた。全操作は、5分以内に終了し、いづれの固定化酵素によっても、90%の収率でアミノ酸を合成できた。収率は、流速と酵素活性量に強く依存していた。