

### 58 $^{99m}\text{Tc}$ -リン酸系化合物の骨無機質成分への集積機序

安東 醇、平木辰之助 (金沢大、医短) 安東逸子、久田欣一、竹内鉄夫 (金沢大、核)

$^{99m}\text{Tc}$ -MDP、 $^{99m}\text{Tc}$ -EHDPおよび $^{99m}\text{Tc}$ -ピロリン酸 (PYP) の骨集積機序はchemisorptionと言われているが、その詳細は不明である。本研究は、これら $^{99m}\text{Tc}$ -リン酸系化合物の骨集積機序を明らかにするために行った。

$^{99m}\text{Tc}$ -リン酸系化合物の骨集積は $^{99m}\text{Tc}$ -リン酸系化合物のリン酸基が、骨の無機質のリン酸基と交換反応で取り込まれると仮定し、これを証明することとした。骨のモデルとしてハイドロキシアパタイト (HAP) 結晶とラットの骨を乾燥し、粉状にしたものを使用した。まず、これら骨のモデルに $^{32}\text{P}$ -PYPの取り込みを実験したところ、 $^{32}\text{P}$ -PYPは明らかに取り込まれた。つぎに $^{32}\text{P}$ -リン酸イオンで標識したHAP結晶と骨粉にPYPを作用させたところ、HAP結晶と骨粉から $^{32}\text{P}$ -リン酸イオンが遊離された。この二つの実験から、HAP結晶または骨粉へのPYPの取り込みはリン酸基の交換反応であることが明らかとなった。また $^{99m}\text{Tc}$ -PYPのHAP結晶および骨粉への取り込みも $^{32}\text{P}$ -PYPの取り込みとよく類似していた。

以上のことから、 $^{99m}\text{Tc}$ -PYPの骨無機質への取り込みはリン酸基の交換反応であると推定され、 $^{99m}\text{Tc}$ -MDP、 $^{99m}\text{Tc}$ -EHDPについても同様と推定された。

### 59 Bifunctional Chelating Agentを用いる $^{99m}\text{Tc}$ 標識の検討。

荒野 泰、三崎敦司、細谷健夫、山田 晃、横山陽、田中 久 (京大、薬) 佐治英郎、石井 靖、鳥塚莞爾 (京大、医、核放科)

$^{99m}\text{Tc}$  のすぐれた放射能の性質をさらに生かすため、生物活性化合物のBifunctional Chelating Agentを用いる $^{99m}\text{Tc}$ 標識が注目されている。我々は、ビスチオセミカルバゾン誘導体がBifunctional Chelating Agentとして、すぐれた構造をもつと考えて検討を続けているが、本研究では、グルコース、乳糖、および、グルクロン酸、および高級脂肪酸を用いて行なった結果を報告する。

糖類は、C-1位のアルデヒドおよび弱い酸化反応で導かれるC-2位のカルボニル基を利用し、これに2分子のチオセミカルバジッドを反応させて、目的物を得た。

高級脂肪酸はアルキル基に新しく合成したビスチオセミカルバゾン誘導体を導入する方法で行なった。

$^{99m}\text{Tc}$ は、この2個のチオセミカルバゾンgroupと、中性の、分子容の小さい、安定なキレートを生成し、被標識化合物への影響の低い状態で標識される。

さらに、これらの構造と、動物の体内分布との関係を検討する予定である。

### 60 肝・胆管系スキヤニング剤： $^{99m}\text{Tc}$ -エチレンジアミン二酢酸誘導体について

前田辰夫、加留部善晴、河野 敏、大矢雅人 (九州がんセンター)

新しい肝・胆管系スキヤニング剤開発を目的として $^{99m}\text{Tc}$ -標識体を合成し、家兎について検討した。主なものは、1) N-(benzenesulfonyl)ethylenediamine-N',N''diacetic acid, 2) N-(P-chlorobenzenesulfonyl)EDDA, 3) N-(P-toluenesulfonyl)EDDA, 4) N-(P-ethylbenzenesulfonyl)EDDA, 5) N-(P-propylbenzenesulfonyl)EDDA, 6) N-(P-t-butylbenzoyl)EDDA である。これらをPH7,  $\text{SnCl}_2$ 還元により $^{99m}\text{Tc}$ 標識した。標識体の分離確認はTCL(展開溶媒: Saline, n-butanol: acetic acid: water; 4:1:1, ethanol: water; 7:8)によった。これら家兎に静注し、放射能の動態をシンチカメラで経時的に撮影した。

$^{99m}\text{Tc}$ -EDDA は臓器親和性に乏しかったが、化合物1, 2, 3, 4, 5の $^{99m}\text{Tc}$ 標識体は血中からのクリアランスが早く肝・胆管系を経て小腸に移行した。胆嚢は数分で描写され始める。これらの化合物は安定でキット化が可能。

### 61 $^{99m}\text{Tc}$ -(Sn)-ピリドキシリデン-トリプトファンおよび5-メチルトリプトファン: 尿中排泄が少なく、肝胆道移行が迅速な肝胆道系イメージング剤としての可能性

東 真, 葉杖正昭

日本メジフィジックス株式会社 技術部

スズ還元法によって $^{99m}\text{Tc}$ -(Sn)-ピリドキシリデン-トリプトファン [ $^{99m}\text{Tc}$ -(Sn)-PT], およびその5-メチル誘導体 [ $^{99m}\text{Tc}$ -(Sn)-PMT] を調製し、ラットおよび兎における体内動態を検索した。

ラットにおける静注後1時間での体内分布は投与総放射能に対して下記のごとく(%)であり、極めて迅速な肝胆道移行を示した。

	血液 1 ml	肝臓	小腸	腎臓	尿中
PT	0.04	0.9	92.0	0.5	1.9
PMT	0.05	1.4	91.3	0.5	1.7

兎における経時的シンチグラムはラット体内分布とほぼ同様の移行動態を示し腎臓、膀胱の描出は認められなかった。

これらの結果は $^{99m}\text{Tc}$ -(Sn)-PT およびPMTが、1)迅速な血中消失, 2)迅速な肝胆道移行, 3)極めて少ない尿中排泄, という優れた特性を備えた新しい肝胆道系イメージング剤となり得ることを示唆した。