362　脳のハロゲンイオン排泄輸送系の薬剤，6－Ha 10－9－benzyl purine（6－XBP）

福士　清，入江俊章，井上　修，山崎統四郎（放医研），野崎　正（理研）

我々は，6－^{18}FBPの脳内代謝に基づく，フッ素イオンの脳での保持，Metabolic Trapの原理を応用し，脳のhalide transportをはかるのに有用な薬剤，6－^{77}Br BP及び^{125}I BPを開発した。

^{77}Br－，^{125}I－BPをマウスに静注後1分のbrain up－takeは，それぞれ8.6，7.6％dose／gで，^{18}F－BP と同様な高い脳移行がみられた（Passive diffusion）。

脳，血液の分析により，Br－BP，I－BPともに速かに代謝的に脱ハロゲン化を受け，1分では約80％，5分では100％，イオン形であった。6－XBPは高い脳移行率と，プリン代謝酵素による速かな脱ハロゲンにより，放射性ハロゲンイオンを脳内へ運ぶキャリアーとみなし得る。

脳からの排泄速度は，ハロゲンにより異なり，$^{18}F^-$，$^{77}Br^-$，$^{125}I^-$のマウス脳からのT½は，それぞれ6.2，40，76分であった。この結果は，脳に存在するI^-排泄輸送系（iodide pump）により良く説明される。

本薬剤は，脳疾患をハロゲン輸送能の変化の観点から研究する場合に，有用であろう。

363　N，N－dimethyltryptamine（DMT）の脳内取り込みに関する検討

谷内一彦，石渡喜一，川島孝一郎，高橋俊博　高橋和弘，岩田　錬，井戸達雄（東北大・サイクロ）

ポジトロン標識したインドールアルキルアミン は精神疾患、幻覚剤の研究に重要な役割を果たすと考えられる。今回我々は^{11}C－ヨウ化メチルを用いたN－メチル化 反応によりDMT，bufotenine，N－methyltryptamine，5－methoxydimethyltryptamineを合成した。そのうち精神疾患に関係深いと考えられているDMTの脳内取り込みに関してレセルピン（Re），パラクロロフエニルアラニン（PCPA）の影響について検討した。方法は^{11}C－DMT をRe処理したラット，コントロールラット に投与しオートラジオグラム を作製。また脳の各部位を一定量取り、％Dose／gを求め脳内DMT濃度を算出してReの影響を調べた。ARGでは大脳皮質，視床，扁桃諸核に高濃度の集積があり、Re 処理にて大脳皮質の集積が抑制された。脳内DMT 濃度と血清濃度の関係は血清濃度が約3～4 nmol／mlまでは直線的増加で、Re PCPA処理では影響をうけなかつた。それ以上の血清濃度では飽和性を示し、Re 処理によりコントロールと比べて取り込みの低下が認められた。

364　^{14}Cモノヨード酢酸のカラー表示オートラジオグラフによる体内分布
― 正常、S－180 肉腫、B－16 メラノーマ移植マウスの対比 ―

秋貞雅祥、石川演美、中島禎一（筑波大 放）、羽鳥昌子、羽山恵美子（生体科学研）

酢酸（A.A.）は急速に代謝されすぐ呼気に排泄されるが、モノヨード酢酸（M.I.A.）はSH酵素阻害剤であるため臓器内貯留が永く、スキャンとしての可能性がある。そこでS180肉腫を移植したICRマウスおよび、B16メラノーマ移植C_{57}ブラックマウスに1－^{14}C－M.I.A.を2.5μCi静注しオートラジオグラフ(A.R.G.)を得て、その生体内分布をフラットベースデンシトメータでディジタル化しかつ観察に便利なようにカラー表示した。

S－180肉腫細胞は2×10^{6}個をICRマウスに、B－16メラノーマは10％ホモジネート液をC_{57}ブラックマウスのそれぞれ背部皮下に移植した。

H.E. 染色標本とA.R.G.の対比はメラノーマ移植3日および6日後の標本について行った。

体内分布は正常コントロールに対し、S－180肉腫群、B－16メラノーマ群とを対比した。

365　各種^{14}C－標識腫瘍親和性物質の体内挙動及び代謝の比較検討

柴　和弘，森　厚文（金沢大　RIセンター）　久田欣一（金沢大　核）

ポジトロン核種（^{11}C，^{18}F）を用いた腫瘍親和性物質としては，糖類似物質，天然アミノ酸，非天然アミノ酸，核酸類似物質等が研究されている。我々は，炭素（^{14}C）で標識したこれらの物質を同じ条件下で各種担癌動物の体内分布及び代謝を比較することにより，新しい腫瘍親和性物質の開発のための指標となり，また標的物質が絞れると考えた。実験は，Deoxy－2－fluoro－D－glucose（FDG），L－Leucine，D. L－Leucine，1－Aminocyclopentane carboxylic acid，Thymidineをエールリッヒ担癌マウス，吉田肉腫担癌ラット及び肝癌AH 109A担癌ラットに投与し，体内分布，オートラジオグラフ，代謝を比較した。その結果，腫瘍への取り込み率（％Dose／g）はACPCが最も高く，全身オートラジオグラフ像もACPCが最も良好な像を得た。

また，ACPCは時間経過とともに腫瘍への取り込み率が増加していることから，その取り込み過程を解明することにより，さらによい腫瘍親和性物質が開発できるのではないかと考え，現在検討中である。

Presented by Medical*Online