

518  $^{99m}\text{Tc}$  標識化合物の迅速純度試験法(第3報)

真田 茂, 安東 醇, 安東逸子, 平木辰之助  
(金大医短) 久田欣一(金大 核)

患者に投与する前に $^{99m}\text{Tc}$ キット製剤の放射化学的純度を検査しておくことは重要である。我々は既にリン酸系化合物についてMiniaturized paperchromatography(ミニペーパー法)による簡便で迅速な純度試験法を報告した(第20回総会)。今回は $^{99m}\text{Tc}$ -DTPA、 $^{99m}\text{Tc}$ -DMSA、 $^{99m}\text{Tc}$ -HSA、 $^{99m}\text{Tc}$ -MAA、 $^{99m}\text{Tc}$ -スズコロイドなどについて検討したので報告する。

展開用紙は長さ55mm、幅5mmで下端より10mmの位置を原点とし、展開槽は長さ80mm、直径15mmのガラス製試験管を用いた。上記標識化合物は原点に、フリーの $^{99m}\text{TcO}_4^-$ は溶媒先端部へと、分離の良好な展開溶媒を検索した。さらに、ミニペーパー法による試験値と放射性医薬品基準に基づいた方法(放棄基法)による試験値とを比較検討した。

$^{99m}\text{Tc}$ 標識化合物の化学的挙動は複雑で、その純度試験については十分検討されなければならない。我々は種々の放射化学的純度に調整した上記標識化合物を用い放棄基法による結果と比較したところ、80~90%アセトンを開閉溶媒としたミニペーパー法による結果が再現性よく一致した。本法は診療の現場において簡便にしかも迅速に純度試験を行うのに有用と考える。

520  $^{99m}\text{Tc}$  標識高級脂肪酸の合成とその体内分布挙動

間賀田泰寛, 荒野 泰, 西尾仁美, 横山 陽(京大薬) 佐治英郎, 鳥塚莞爾(京大医)

心筋のイメージング及び代謝機能診断を目的として、 $^{11}\text{C}$ パルチミン酸や $^{123}\text{I}$ パラヨードフェニル脂肪酸などが開発され、その有用性が認められているが、さらに広汎性の観点から $^{99m}\text{Tc}$  標識脂肪酸の開発が望まれるところである。今回演者らは、キレート形成部位にジチオセミカルバゾン骨格を用いる $^{99m}\text{Tc}$  標識脂肪酸誘導体を合成し、その体内分布挙動を検討した。また $^{64}\text{Cu}$  誘導体ならびに炭素鎖の長さの等しい $^{131}\text{I}$  パラヨードフェニル脂肪酸、 $^{11}\text{C}$ パルチミン酸についても合わせて検討した。 $^{99m}\text{Tc}$  標識体のマウス体内分布において、血液クリアランスが遅いことが示されたが、ヨード標識体と比べて初期の心筋への取り込みは同等であり、また、より長時間のリテンションが認められた。 $^{64}\text{Cu}$  標識体においては取り込みは $^{99m}\text{Tc}$  と同等であり、一方血液クリアランスが速いため、投与後1hrで心臓対血液比1.7が得られた。このことから、金属としての性質の相違はあるものの、この構造が $^{99m}\text{Tc}$  を用いる標識脂肪酸として有効であることが見出された。現在、さらに $^{99m}\text{Tc}$  標識体に関して検討中である。

## 519 水素化ホウ素ナトリウムを還元剤とした

$\text{Tc}-99\text{m}$  標識化合物合成の試み

末広牧子 (東京都養育院付属病院 核放)

$\text{Tc}-99\text{m}$  標識化合物は従来、塩化第一スズを還元剤として合成されてきたが、標識条件によっては、重合体を生成するなど、必ずしも、 $\text{Tc}-99\text{m}$  によって標識される化合物の生物学的性質を反映させた臓器描出剤が得られるとは限らなかった。このような問題の要因は、還元剤としての $\text{SnCl}_2$ の性質に深い関連があると考えられる。

このため、従来法に対して、われわれは、他の還元剤を用いた場合の $\text{Tc}-99\text{m}$  標識化合物合成について基礎的な検討を加えた。

還元剤としては、水素化ホウ素ナトリウムを用い、よりマイルドな条件下における還元を試みた。還元の様子は、TLC(順相、逆相)、ペーパークロマト、などの手段により確認した。 $\text{Tc}-99\text{m}$  (VII) の還元は $\text{NaBH}_4$ の量に依存して進行し、2mgで~60%、5mgで~80%、10mgで90~100%の還元率であった。また、還元には、加熱が不可欠で、加熱なしの場合、短時間のうちに、可逆的に $\text{Tc}-99\text{m}$ は酸化されることがわかった。さらに、このような新しい還元剤を用いた $\text{Tc}-99\text{m}$  標識法によるカテコールアミン系の物質の標識について検討した。

## 521 腫瘍診断を目的としたグルコース誘導体:

$^{11}\text{C}$ および $^{99m}\text{Tc}$ 標識1-チオグルコース

佐治英郎, 間賀田泰寛, 徳井太郎, 荒野 泰, 横山 陽, 鳥塚莞爾(京大医・薬)

正常組織に比べ、腫瘍においては、糖代謝が亢進し、かつその代謝活性は腫瘍の悪性度と相関関係があるとされている。このため、 $^{11}\text{C}$ -グルコースおよび各種グルコース誘導体が腫瘍診断薬として検討されている。本研究では、糖代謝機能を有し、かつ $^{11}\text{C}$ -メチル基の導入ならびに $^{99m}\text{Tc}$  標識に極めて有利な性質を有する1-チオグルコースに着目し、 $^{11}\text{C}$ ならびに $^{99m}\text{Tc}$  標識体について基礎的に検討した。

$^{11}\text{C}$ -ヨウ化メチルによるチオール基のメチル化は、バイアル中での簡単な振盪操作で直ちに進行する。また、 $^{99m}\text{Tc}$  標識は、5価Tc酸化状態をもち、かつ安定な多核錯体形成の条件が設定された。Ehrlich 担癌マウスを用いる体内分布挙動の検討で、 $^{11}\text{C}$ および $^{99m}\text{Tc}$  の両標識体とも、腫瘍への高い集積が認められ、腫瘍診断薬としての可能性が示唆された。これらの体内挙動は所期のとおりに糖代謝を反映する結果であると考えられるが、現在さらに詳しく検討中である。