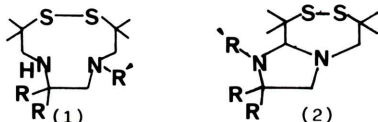


## 42 Tc-99mキレート剤：Diaminodithiol (DAT) 類の合成とTc-99m標識

柴 和弘, 森 厚文 (金大・RI)  
松田博史, 辻 志郎, 久田欣一 (金大・核医)

新しいTc-99m標識化合物の開発を目的として、diaminodithiol (DAT) 類に着目し合成及びTc-99m標識について基礎検討を行った。その結果、従来の方法 (Kungら, Burns ら) ではTc-99m標識率は30~50%と低く、それは化合物によって目的とするDAT (1) 類がほとんど得られず、分子内で環化した (2) が主生成物であるためと考えられた。そこで我々は分子内環化反応を抑えるため反応条件を変え極低温下 (-78°C) で合成を行い目的のDAT (1) 類を得ることができた。

Tc-99m標識もSnCl<sub>2</sub> (1x10<sup>-4</sup>M)還元により、pH 5.0~10.0と広い範囲にわたり、短時間で85~95%と高い標識率を示すことから優れたTc-99mキレート剤であり、bifunctional chelating agent への応用が期待される。



## 44 ヨード標識側鎖脂肪酸の基礎的検討

米倉義晴, 山本和高, 千田道雄 (京大 放核)  
藤林康久, 川井恵一, 横山 陽 (京大 薬)  
佐久間隆, 東 真 (日本メジフィジックス)  
鳥塚莞爾 (福井医大) F. F. Knapp, Jr. (ORNL)

心筋代謝イメージングを目的として、各種の標識脂肪酸が開発されている。その中でも側鎖脂肪酸は、ミトコンドリア内でβ酸化をうけずに心筋内に捕捉されることを意図して開発された化合物で、ガンマカメラによるシンチグラフィやSPECTへの応用が期待されている。そこで、このような側鎖脂肪酸の一つとして、p-iodophenyl-3-methylpentadecanoic acid (BMIPP) の体内挙動に関する基礎的検討を行った。

BMIPPは、ラットおよび家兎において、心筋では投与後安定して高い集積を示したのに対して、血中からは速やかに消失し、肝からも徐々に消失した。この結果、心筋/血液、心筋/肺、心筋/肝の比は、投与後15~20分でいずれも高い値を示した。すなわち、BMIPPは、ガンマカメラにより良好なイメージが得られることを示唆している。更に、これらの臓器への取り込みが血中の代謝基質物質によりどう変化するかについて検討し、心筋代謝イメージング法としての問題点についても検討を加えた。

## 43 糖代謝機能診断を目的とするヨード標識 N-benzoyl-glucosamine 誘導体の開発

間賀田 泰寛, 佐治 英郎, 大桃 善朗, 横山 陽  
(京大 薬, 医 大阪薬大)

演者らはこれまでに、I-123 及び放射性金属標識グルコース誘導体を種々合成し、それらの糖代謝機能測定を目的とする診断薬剤としての可能性について検討を行ってきた。その結果、糖輸送能を評価しうる薬剤は得られたが、糖代謝の律速段階であるヘキソキナーゼとの反応に関与しうる薬剤は得られていない。以上のことをふまえて、本研究では、糖代謝機能の測定を可能とする、ヨード標識グルコース誘導体を得ることを目的とし、N-(iodo-benzoyl)-glucosamine (BGA) の合成と、その体内動態の検討を計画した。

BGA の合成は glucosamine のアミノ基に iodo-benzoyl 基を酸クロライド法により導入して行なった。I-125 による標識は、交換反応により行なった。in vitro において、ヘキソキナーゼによるリン酸化について検討したところ、BGA 自身はリン酸化されないものの、ヘキソキナーゼによるグルコースのリン酸化を非拮抗的に阻害し、ヘキソキナーゼとの相互作用があることが示された。この標識体のマウス体内分布を検討したところ、標識状態は安定で、血液クリアランスは非常に速く、投与初期における半減期は、3.2 分であった。また、脳への取り込みは認められないものの、脾臓あるいは肝臓などのヘキソキナーゼの活性の高いと考えられる臓器への高い集積が認められるなどの興味ある結果が得られた。これらのことは BGA が糖代謝機能診断薬剤として評価される可能性を示すものであり、現在、さらに詳細に検討中である。

## 45 (p,2n) <sup>125</sup>I と (p,5n) <sup>125</sup>I の SPECT 像における基礎的検討

池田穂積, 浜田国雄, 小堺和久, 大村昌弘,  
下西祥裕, 佐崎 章, 福田照男, 越智宏暢,  
小野山靖人 (大阪市大 放), 大西良浩  
(日本メジフィジックス)

現在本邦において用いられている <sup>125</sup>I は、(p,2n) 反応によるものであり、<sup>125</sup>I 等の混入があるためイメージング上問題があるとされている。一方、<sup>125</sup>I (p,5n) <sup>125</sup>Xe → <sup>125</sup>I によってえられる <sup>125</sup>I は100%の <sup>125</sup>I であり、注目されている。そこで (p,2n) <sup>125</sup>I と (p,5n) <sup>125</sup>I との SPECT 像に関して空間分解能、均一性、直線性、cold 及び hot lesion の検出能の面から比較検討を行った。140KeV 高分解能用コリメータ (以下 HR と略す) では、(p,2n) <sup>125</sup>I よりも (p,5n) <sup>125</sup>I を用いた時がすべての検討項目において優れており、HR は最大使用エネルギーが 140KeV であるにもかかわらず、空間分解能、cold lesion の検出能の点で、300KeV 平行多穴型コリメータ (以下 PL と略す) より優れていた。しかし FSD は 10.5% であり、hot lesion の画像においてややリングアーチファクトが生じる弱点もみられた。また PL でも (p,2n) <sup>125</sup>I よりも (p,5n) <sup>125</sup>I を用いた時がすべての検討項目でやや優れていた。