142　^{99m}Tc溶離液の比放射能評価

天野良平,安東　醇,平木辰之助,(金沢大学医技短),森厚文(金沢大学RIセンター),松田博史,久田欣一(金沢大学核医学科)

我々は、第19回および第28回本総会において ^{99m}Tc溶離液中の不純物核種、Tc総量の直接測定法を報告した。今回、最近の^{99m}Tc溶離液,ジェネレータ中の不純物核種の測定、高速液体クロマトグラフ法および液体シンチレーション法による溶離液中の Tc総量(^{99m}Tc + ^{99}Tc)の測定、さらにそれによる^{99m}Tcの比放射能の評価、^{99m}Tcの減衰のみによる計算評価との比較を行った。
その結果,^{99m}Tc溶離液中の不純物核種については第19回と同様のものが検出されたが、濃度は極めて低く改善されていた。比放射能については,従来の^{99m}Tcの減衰のみによる計算評価で良いとされているが、本実験値は計算値より必ず低く、1/2 程度になることがあった。
この原因の実験的検討を行った。

143　高分子スズ錯体を用いる^{99m}Tc標識放射性医薬品製造法の検討

中山守雄，寺原孝明，原田久美子，杉井　篤（熊本大学薬学部）原　正史，下村　修，古嶋昭博，冨口静二，広田嘉久，高橋睦正（熊本大学放射線科）

現在、大部分の^{99m}Tc製剤では、$SnCl_2$が還元剤として多量に使用されている。我々は、品質の変動や複雑な標識操作の要因となるSnを^{99m}Tc製剤中からほぼ完全に除去しかつ^{99m}Tcの還元反応を容易に進行させるための高分子スズ錯体の開発を行った。特に、リン酸基を含む多孔性のキレート形成樹脂が高いSn(Ⅱ)結合量を示し、しかも極めて安定に結合していることから、標識の際の溶液中へのスズの混入を抑えることが出来た。更に加水分解及び空気酸化の影響も小さく、迅速かつ簡便に効率の良い^{99m}Tc標識を行うことができることから、種々の^{99m}Tc標識化合物調製への適用を試みた。

144　低分子量ジアミンジチオール(DADT)型配位子の合成と^{99m}Tc標識化の検討

柴　和弘，森　厚文（金沢大・RIセンター），松田博史，寺田一志，絹谷啓子，久田欣一（同核医学科）

ジアミンジチオール(DADT)類は^{99m}Tc－標識薬剤の優れたキレート形成部位となり得ることをすでに報告してきた。　しかしレセプターマッピング及び代謝機能診断用の^{99m}Tc－標識薬剤の開発を考える場合，作用活性部位への影響をできるだけ少なくするため^{99m}Tc核種とのキレート形成部位はできるだけ分子量を小さくし，その性質についても注意を払う必要があると考えられる。　そこで今回，低分子量のDADT類の合成を試み，^{99m}Tc核種との標識条件並びに物理化学的性質，生物学的性質についても検討を加え，Bifunctional chelating agentのキレート形成部位としての可能性について検討したので報告する。

145　^{99m}Tcに対する新しいキレート形成部位としてのヒドロキサムアミドの評価

杉井　篤，西郷秀生，原田久美子，中山守雄（熊本大学薬学部）原　正史，下村　修，古嶋昭博，冨口静二，広田嘉久，高橋睦正（熊本大学放射線科）

我々は、^{99m}Tcと高い親和性を有するキレート形成部位の開拓が新しい^{99m}Tc標識放射性医薬品の開発に重要であると考え、その観点からヒドロキサムアミド基を含む一連の配位子群($R\text{-}C(NH_2)NOH$)に着目した。これらの配位子は5員環構造のキレート環の形成が期待されるにもかかわらず、^{99m}Tcとの反応性については全く検討されていない。今回、その基本的化合物であるベンゾ及びピリジルヒドロキサムアミドを合成し配位能の検討を行った結果、室温下、広範囲のpH域、希薄な配位子濃度でも^{99m}Tc錯体が高収率で得られることから、Tcに対し極めて高い親和性を有することが明らかになった。

146　糖代謝機能診断を目的とするヨード標識グルコース誘導体の開発：エステル化による脂溶性の向上

間賀田泰寛、稲垣　雅、山田能久、佐治英郎、横山　陽（京都大、薬、医）、大桃善朗、田中千秋（大阪薬大）

演者らはこれまで、ヨード標識糖代謝機能診断薬として、ヘキソキナーゼのリン酸化反応に関与するグルコサミン誘導体(BGA)を報告したが、脳内移行性の低さが示された。そこで、エステル化による脂溶性の増加により BBBを透過させ、脳内エステラーゼにより BGAに変換させることを計画し、検討を行なった。BGA のアセチルエステル体及びピバロイルエステル体について検討した結果、両エステル体ともに脳への高い移行性及び滞留性を示した。さらに、脳内での存在状態を検討したところ、アセチルエステル体が投与初期にはエステル体として脳内に移行し、所期の通り早い時間でのエステルの開離が認められた。現在さらに脳内における BGAの挙動について検討中である。

147　アミノ酸代謝を反映する放射性機能診断薬(9)　^{123}I-α-methyl-L-tyrosineの膵臓集積性と代謝挙動

川井恵一，久保寺昭子（東京理大・薬）　藤林靖久，米倉義晴，小西淳二，佐治英郎，横山 陽（京大・薬,医）

放射性ヨウ素標識修飾アミノ酸は，天然アミノ酸とは異なる挙動を示し，代謝系の解析を容易にする．我々は既に ^{123}I-α-methyl-L-tyrosine(AMT) の高い脳集積がアミノ酸膜輸送機能を選択的に反映することを報告した．今回，AMT の膵臓への集積と代謝挙動について検討した．
AMT はマウス体内分布実験において高い膵臓選択性を示し，母体化合物であるL-tyrosineよりも高い膵臓対他組織比が得られた．その集積には，膜能動輸送機構の関与が認められた．ヨウ素標識薬剤で問題となる脱ヨウ素化はどの主要組織においても見い出されず，その他の代謝に関しても高い安定性が観察された．よって，AMT は膵臓のアミノ酸膜輸送機能の解析にも適した放射性診断薬として有用であることが認められた．

Presented by Medical*Online