

## 206 ジアミド結合を有するPETS誘導体Malonyl-

bis(N-methylthiosemicarbazide)のTc-99m標識

荒野 泰, 田川正秋, 井上達雄, 山部恵子

横山 陽 (京都大学 薬学部)

5-6-5 キレート環構造を有する Pentane-2,4-dione-bis(N-methylthiosemicarbazone)(PETS)は従来の5-5-5キレート環構造のDTS誘導体に比べて、遙かに高い安定性と脂溶性を備えたTc-99m錯体を形成する。本研究では、安定なTc錯体を簡単な標識操作により高収率で得る目的で、ジアミド結合の配位子 Malonyl-bis(N-methylthiosemicarbazide)(MATS)を合成し、Tcとの錯形成反応を検討した。MATSは、短時間の加熱、あるいは高pHでの標識反応でほぼ定量的に単一のアニオン型Tc錯体を生成した。またこの錯体はTc-PETSに匹敵する安定性を示した。これらの結果から、DTS分子のflexibilityがTc錯形成反応に大きな影響を及ぼすことが強く示唆された。

207 <sup>99m</sup>Tc 標識メルカプトアルブミンの作成とその特性の検討

杉井 篤, 宇田貞武, 寺原孝明, 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,

富口静二, 伊豆永浩志, 高橋睦正 (熊本大学放射線科)

人血清アルブミン(HSA)は、メルカプト体やノンメルカプト体等の幾つかの成分から成っており、<sup>99m</sup>Tc標識HSAの安定性に大きく関与すると考えられる。本研究では、<sup>99m</sup>Tc標識におけるHSAのメルカプト部分の関与を確認するために、還元剤として新たに開発した高分子スズ錯体を使用して、精製したメルカプト及びノンメルカプトHSAの<sup>99m</sup>Tc標識を行った。分析には、薄層、ゲル浸透、イオン交換クロマトグラフィー及びゲル電気泳動を用いた結果、メルカプト部位が標識に直接関与することが明らかになった。さらに、今回得られた<sup>99m</sup>Tc標識メルカプトHSAのin vivo安定性も確認された。

208 <sup>99m</sup>Tc-アルキルヒドロキサムアミド錯体の調製とその体内分布挙動の検討

中山守雄, 堂園弘幸, 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, 富口静二,

伊豆永浩志, 広田嘉久, 高橋睦正 (熊本大学放射線科)

我々は、ヒドロキサムアミドが<sup>99m</sup>Tcに対して有効なキレート形成部位であることをすでに明らかにした。そこで今回は鎖長の異なるアルキル基を有するモノ及びジヒドロキサムアミドを配位子として合成した。これらの配位子はすべて、室温下、高収率かつ迅速に<sup>99m</sup>Tc錯体を形成した。得られた錯体については、電荷及びHPLCによる分析においては共通性が認められたが、アルキル鎖の伸長に伴う脂溶性の規則的な増加も確認された。これらの錯体をマウスに投与し体内動態を検討した結果、アルキル基の違いに基づくと考えられる、幾つかな特徴的な体内分布挙動が観察された。

209 排出<sup>99m</sup>Tcの自然界での挙動

天野良平, 安東 静, 平木辰之助 (金沢大学医療技術短大) 森 厚文 (金沢大学RIセンター), 松田博史, 久田欣一 (金沢大学校医学)

我々は、第19、28および29回本総会において<sup>99m</sup>Tcジェネレータ溶離液中の不純物核種、Tc総量の直接測定法、比放射能評価について報告し、<sup>99m</sup>Tc放射性医薬品に含まれる長半減期<sup>99</sup>Tcの存在量について十分な知見を得てきた。一方、近年自然界での<sup>99</sup>Tcの挙動が保健物理学的重要性から注目されている。患者から排出される<sup>99</sup>Tcの挙動についても考慮されなければならない。そこで今回、<sup>99m</sup>Tc放射性医薬品投与患者から尿排出された<sup>99m</sup>Tcの自然環境での変化を知るための予備的実験を放射化学的手法により行った。尿中に排出された<sup>99m</sup>TcはTcO<sub>4</sub><sup>-</sup>以外の化学形の<sup>99m</sup>Tcを含むが、水による希釈、日光、土砂などの影響により次第にTcO<sub>4</sub><sup>-</sup>の化学形となっていくことが判った。

## 210 BIOLOGICAL BEHAVIOR OF Tc(V)-DMS PREPARED BY LIGAND EXCHANGE REACTION: Effect of Initial Radiometal State. Kazuko Horiuchi and Akira Yokoyama. Faculty of Pharmaceutical Sciences, Kyoto University.

In search for better Tc-agent for tumor detection, the effect of Tc-core on the in-vivo behavior of polynuclear Tc complex of dimercaptosuccinic acid (Tc(V)-DMS), was considered of interest. In this work, a precursor, Tc-glucoheptonate (Tc-GH) was prepared at different degree of polynucleation and their effect on the Tc-agent to be radiolabeled were screened by in-vitro and in-vivo experiment. Those precursors generated Tc-DMS with physical characteristic compatible to Tc(V)-DMS. The study of each radiolabeled Tc-DMS complex in Ehrlich ascite tumor bearing mice indicated, however, that the initial radiometal state in the Tc-GH precursor greatly affected the biodistribution of the post labeled Tc-DMS; other relevant factors will be also discussed.

## 211 [F-18]Fluoroboronophenylalanine (FBPhe)

の合成と拒癌マウスにおける体内分布

石渡喜一, 井戸達雄, ＊市橋正光, ＊三島豊 (東北大学・サイクロ、＊神戸大・医・皮)

癌の熱中性子捕捉療法のための標的化合物として合成されたp-boronophenylalanine (BPhe)をF-18による標識化し、FM3A乳癌を移植したマウスにおける体内分布を調べた。

トリクロロ酢酸中 BPhe・HClに[F-18]AcOFを室温で反応させ、逆相カラムを用いたHPLCにより2位標識のFBPheを高純度で単離した。放射化学収率は25%-35%であった。

FM3Aの放射能は投与後2時間まで集積したが、酸不溶性画分への移行はなかった。脾臓をふくめ他の組織では減少パターンを示した。2時間では腎臓以外の全ての組織に対しFM3Aの放射能摂取率が高かった。FBPheはPETによる癌のイメージング剤として期待される。