

## 260 術者の被曝を軽減する為の $H_2^{15}O$ ボーラス静注装置

石井信一(住重加速器サービス), 千田道雄, 外山比南子, 石井賢二, 佐々木徹, 織田圭一(都老人研PET), 大山雅史(日本医大第二内科)

$H_2^{15}O$ ボーラス法は静注時の術者の被曝が問題とされている。そこで都老人研究所施設内に設置された $H_2^{15}O$ 自動合成装置を用いて安価にできる手動ボーラス静注装置を試作した。本装置は、キューリーメータ、減衰槽、シリング、ライン交換弁、フィルターで構成されており、合成装置から送られてきた $H_2^{15}O$ をキューリーメータ内減衰槽に導きアクティビティを測定したのち、フィルターを通して患者へと注入する。又ライン中のエアーはフィルター内で除去する。この一連の動作で、術者の被曝は1.5 GBq投与時30 μSvだったものが5 μSvに軽減された。

## 261 NMCCにおける放射性薬剤の製造と品質管理

篠野健太郎、柳澤誠、金子靖子\*、ニツ川章二\*、(岩手医科大学、\*日本アイソトープ協会)

日本アイソトープ協会仁科記念サイクロトロンセンター(NMCC)では、島津製作所製の小形サイクロトロン(MCY-1750)、放射性薬剤自動合成装置及びPET(HEADTOME IV)よりなるサイクロトロン核医学診断システムを導入し、現在、臨床測定に向け放射性薬剤の製造テストを行っている。使用を予定している薬剤は $C^{15}O_2$ 、 $C^{15}O$ 、 $^{15}O_2$ の3種のガス剤、及び $^{18}FDG$ 注射液、 $^{11}C$ -methionine注射液である。ガス剤については、放射化学的純度ならびに担体量をガスクロマトグラフ法によって測定し、注射剤については放射化学的純度(高速液体クロマトグラフ法)の測定及び無菌試験、エンドトキシン試験を通じて品質管理を行う。 $^{18}F$ および $^{11}C$ の比放射能についても報告する。

## 262 ヨウ素標識deprenylの合成

大桃善朗、杉本淳、村上勝彦、田中千秋(大阪薬大)  
間賀田泰寛、平田雅彦、横山陽(京大・薬)

*L*-DeprenylはMonoamine oxidase-B(MAO-B)特異的阻害剤であり、この $^{11}C$ 標識体を用いたin vivoでのMAO-B活性測定の試みが報告されている。本研究では、SPECT用放射性医薬品の開発を目的とし、deprenylのヨウ素標識を計画した。

種々のdeprenyl ヨウ素標識導体を合成し、その中からin vitroにおいてMAOに対しdeprenylと同等の阻害活性を持ち、かつB型に特異的な導体を見いだした。この導体について、対応するトリプチルスズ基を導入した前駆体からのヨウ素置換反応による放射性ヨウ素標識について検討した。

## 263 $^{125}I$ 標識R<sub>0</sub>16-6491誘導体の合成

大桃善朗、村上勝彦、杉本淳、田中千秋(大阪薬大)  
間賀田泰寛、平田雅彦、横山陽(京大・薬)

Monoamine oxidase(MAO)は、種々の脳疾患との関連が示唆されており、その活性測定はこれら疾患を診断する上で有用と考えられている。本研究では、SPECT用診断剤の開発を目的とし、MAO-B特異的阻害剤R<sub>0</sub>16-6491のヨウ素標識誘導体の合成を計画した。

合成した種々のヨウ素標識導体の中から in vitroにおいてMAO-Bに対し、R<sub>0</sub>16-6491と同等の強い特異的阻害活性を有する誘導体を見いだした。この誘導体の $^{125}I$ 標識は、ヨウ素導入位置にトリプチルスズ基を有する前駆体と $^{125}I$ とのipso置換反応により行い、短時間かつ高収率でno-carrier-addedの標識体を得ることができた。

現在、動物体内での本標識体の挙動を検討中である。

## 264 脳機能診断を目的とした放射性医薬品(8).

$^{125}I$ 標識tyrosine位置異性体の脳機能診断薬としての評価

川井恵一、中川司、田中健一、久保寺昭子(東京理大・薬)  
藤林靖久、米倉義晴、佐治英郎、小西淳二、横山陽(京大・薬、医)

脳への高い集積性を示すL-tyrosineの位置異性体であり、脳内カテコールアミン生合成酵素に対して高い親和性を有するm-tyrosineとo-tyrosineの光学異性体を分離し、それらの $^{125}I$ 標識体について脳集積性やその集積機序、脱ヨウ素化反応に対する抵抗性を検討した。

それぞれのL-体は、アミノ酸能動輸送機構によって、高く脳へ集積することが示された。またこれらは、脱ヨウ素化反応の基質である3-iodo-L-tyrosineとは異なり、L-体であるにも関わらず、脱ヨウ素化に対する高い抵抗性を示した。

よって、 $^{123}I$ -L-m-tyrosine、L-o-tyrosineは、脳内アミン生合成機能診断薬としての可能性を有するものと考えられる。

## 265 Iodine- $^{125}I$ -IBZMの合成とその体内動態に関する基礎的検討

石川演美、佐藤始広、武田徹、吳勁、板井悠二(筑波大学放射線科)

SPECT用ド<sup>3</sup>-ルミシレカ<sup>7</sup>-D-2)メジソク<sup>8</sup>用薬剤として、IBZM(S)-(-)-3-iodo-2-hydroxy-6-methoxy-N-[(1-ethyl-2-pyrroldinyl)methyl]benzamideが有望視されている。われわれはIBZMをKungらの方法にて合成した。IBZM合成後、 $^{125}I$ にて標識し、マウス、ラットを用いてその体内分布、および経時的な脳内分布について検討した。基底核領域と比較すると非特異的結合部位である大脳皮質、小脳の洗い出しが速やかであった。また、血液中の放射活性測定および高速液体クロマトグラフィーを用いたIBZMの血中の代謝産物の分析を行った。脳内での代謝産物の経時的变化についても検討予定である。