452　心筋交感神経機能診断を目的とした放射性医薬品(7). p-Hydroxynorephedrineの構造類似体との比較

川井恵一, 山根貴徳, 西山新吾, 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・医, 薬）

心筋交感神経機能診断を目的とした放射性医薬品として, 放射性ヨウ素標識p-hydroxynorephedrine(I-PHNE)の高い可能性を示した. 本検討では, noradrenaline, adrenalineの芳香環3位の水酸基を欠く, PHNEの構造類似体octopamine, synephrineを用い, 各放射性ヨウ素標識体を比較検討した.

マウス体内分布実験の結果, 心筋集積性はいずれも同等であったが, I-PHNEは, 最も高い心筋対周辺組織比を示した. 更に, 薬物負荷実験の結果, I-PHNEの挙動が, 最も心筋交感神経機能を反映していると考えられた. 以上より, I-PHNEは, これらの神経伝達物質誘導体と比較してより高い有用性を有すると考えられる.

453　ヨード脂肪酸（^{123}I-BMIPP）注射液の動物における体内分布及び代謝物の検索

岡野　栄, 伊藤　修, 倉見　美規　（日本メジフィジックス株式会社, 中央研究所）

^{123}I-BMIPP(15-p-^{123}I-iodophenyl-3R,S-methylpentadecanoic acid)注射液はSPECT の手法を用いて局所心筋脂肪酸代謝を評価することを目的として開発された製剤である. 我々は本剤のラット及びウサギにおける体内分布, 血中及び尿中放射化学的成分の検索を行い, 体内での代謝の様相を検討した.　本剤は心臓では投与後1時間まで一定の値を示したが, 肝臓では心臓に比べ速やかに減少した. 主な排泄経路は尿中への経路であった. また, 代謝物の検索から^{123}I-BMIPPは最初にα酸化を受け, 次いでβ酸化を受けp-^{123}I-iodophenylacetic acidとなり, その後抱合体として尿中に排泄される代謝の様相が示された.

454　脂溶性キレート剤による白血球標識の検討－^{111}In－トロポロン, ^{99m}Tc－トロポロン, ^{99m}Tc－ECDの比較－

冨吉勝美, 平野恒夫, 井上登美夫, 遠藤啓吾（群馬大学医学部核医学教室）

脂溶性キレート剤による白血球標識を試行し, 血中成分分布, 標識率及び安定性を検討した. 白血球分離は, 全血43mℓに7mℓのACD及び10mℓ Hydroxy Ethyl Starch (HES)を加え, 60分間沈殿させた後, 上清を150Gで遠心して, 白血球を得た. ^{111}In－トロポロンによる標識率は97.2%, 安定性は24時間後91.3%であった. 現在15例の臨床応用で有用かつ安全であった. 同様に^{99m}Tc－トロポロン, ^{99m}Tc－Ethyl Cysteinate Dimer (ECD)の標識率はそれぞれ50.2%, 70.5%で, 24時間後の安定性は0%, 23.7%であった. ECDによる白血球標識の有用性が考えられた.

455　化学的に不安定な官能基を有する^{99m}Ｔｃ－ジアミノジチオール（ＤＡＤＴ）類の合成の基礎的検討

柴　和弘、森　厚文（金沢大・ＲＩセンター）、松田博史、久田欣一（金沢大・核医学科）

ジアミノジチオール（ＤＡＤＴ）類は^{99m}Ｔｃ核種に対して高いキレート形成能力を持つ配位子として知られている。ＤＡＤＴ類は合成の最終段階でジスルフィド結合をジチオールに還元する必要があるが、従来、この還元過程がかなり過酷な反応条件であった。そのためＤＡＤＴ類をバイファンクショナルキレート剤として利用する場合、生理活性物質や薬物およびそれらと結合させるために必要な官能基を持つＤＡＤＴ類自体を化学変化させてしまう可能性がある。そこで今回、ＤＡＤＴ類の合成法に改良を加え、化学的に不安定な官能基（エステル基等）を有するＤＡＤＴ類の合成を検討したので報告する。

456　両親媒性^{99m}Ｔｃ錯体とその性質

中山守雄、中川和泉、渡邊理恵、堂園弘幸、原田久美子、杉井　篤（熊本大学薬学部）　原　正史、木下留美、古嶋昭博、冨口静二、高橋睦正（熊本大学放射線科）

我々はすでに、ヒドロキサムアミド(Ham)が^{99m}Tcに対し高い親和性を示すキレート形成部位であることを報告した。今回、鎖長の異なる一連の直鎖アルキルHam誘導体より得られる^{99m}Tc錯体の詳細なキャラクタリゼーションを行なった結果、長鎖アルキルHamと^{99m}Tcの錯体は、親水的な配位部位と疎水的なアルキル鎖からなる両親媒的な特性を有することが確認された。また、錯形成過程においても長鎖アルキルHamの場合に特徴的傾向が確認された。また、これら錯体は安定性が高いことから、マウスにおける体内分布挙動は、その両親媒的特性との関連が大きいと考えられた。

457　肝機能診断剤 Tc-99m-GSA 注射液の開発

山道芳弘, 鷲野弘明, 倉見美規(日本メジフィジックス株式会社　中央研究所)

Tc-99m-GSA 注射液は, HSA にガラクトースと DTPA を導入し, これに Tc-99m を結合させ, 肝実質細胞に存在するアシアロ糖蛋白受容体に結合する特性を利用した肝機能評価を目的とする放射性診断薬である. 本剤 1 ml 中には, GSA 3 mg, テクネチウム-99m を検定日時において 185 MBq 含む.

ラットに本剤を投与した結果, 投与後 10 分において肝臓に投与量の 90 % 以上が集積し, その他の臓器には顕著な集積は見られなかった. 肝臓に集積した本剤は肝実質細胞に取り込まれ代謝された後, 主として肝胆道系を介して十二指腸に排泄され, 糞中に移行すると考えられた. 投与後 48 時間までに投与量の約 75 % の放射能が糞中に排泄された.

Presented by Medical*Online