## 476 アミノ酸トレーサの脳および癌組織中の蛋白質，脂質および核酸成分における放射能の割合

石渡喜一，窪田和雄，村上松太郎，窪田朗子，佐々木徹，千田道雄（都老人研PET，東北大加齢研，秋田脳研）

PETにより脳や癌の蛋白質合成を評価するトレーサとして提案されている[methyl-$^{11}$C]methionine($^{11}$C-Met)、[1-$^{11}$C]leucine($^{11}$C-Leu)および2-[$^{18}$F]fluorotyrosine($^{18}$F-Tyr)の蛋白質合成に利用される割合を再評価した． $^{3}$H-Met，$^{14}$C-Leuと$^{18}$F-TyrをFA3A乳癌移植マウスに同時に投与した．脳およびFM3Aの放射能の酸不溶物質への移行率を測定し、更に脂質、RNA、DNAおよび蛋白質成分に分離した。3トレーサとも蛋白質成分の放射能の割合が主であった。理論的に蛋白質以外の高分子成分への移行を考えにくい$^{14}$C-Leuを基準とすると、$^{3}$H-Metは脂質とRNAに、$^{18}$F-Tyrは脂質成分の割合が高かった。シクロヘキシミドにより蛋白質合成を阻害した時、その傾向は著しくなった。

## 477 F-18 fluorophenylalanine dynamic studyによる脳内遊離中性アミノ酸濃度の測定

畑澤　順、伊藤　浩、下瀬川恵久、三浦修一、村上松太郎、飯田秀博、菅野　巌、庄司安明、奥寺利男、犬上　篤、小川敏英、藤田英明、高橋和弘、佐々木広、上村和夫（秋田脳研　放）

F-18 fluorophenylalanineとO-15 $H_2O$のPET studyを行ない、FPheの脳血液関門でのinfluxおよびefflux の速度定数、水のdistribution volume (Vd) を求め、これらの値と血液中の総遊離中性アミノ酸濃度 (平均 444nmol/ml)、既知のMichaelis-Menten定数 (phenylalanine; 35nmol/ml) から、脳内総中性アミノ酸濃度を測定した。対象は、健常成人14例(21-71才)である。脳内総中性アミノ酸濃度は、レンズ核(331nmol/ml)、視床 (321)、小脳 (289)で高値を示し、脳幹(243)、白質 (246)は低かった。血液中の遊離中性アミノ酸濃度には依存していなかった。

## 478 $^{11}$C標識カルシウムチャンネル拮抗薬，$^{11}$C-semotiadil、の合成と生体内分布

石渡喜一，関　博之，石井賢二，石井信一，野崎　正，千田道雄（都老人研PET，北里大衛生）

PETによるカルシウムチャンネルの測定を目的として，その拮抗薬であるsemotiadil(SEM)をC-11標識合成し，そのマウスにおける体内分布を検討した． norSEMを$^{11}$CH3I によりメチル化し，HPLCにより化学的，放射化学的に高純度の$^{11}$C-SEMを単離精製した．マウスにおいて，肺，肝，膵，小腸等の摂取率が高かった．脳への集積は低いが、15分に最大値を示した。海馬、線条体、視床下部では投与量の増加により$^{11}$Cの集積が低下したが、他の脳組織や心筋ではその特徴は見られなかった．また，カルシウム拮抗薬作用の弱い$^{11}$C-光学異性体では，特異的分布を示さなかった． $^{11}$C-SEMは，脳内カルシウムチャンネルを画像化するトレーサーとなる可能性が示唆された．

## 479 カルシウムイオンチャネルイメージング剤としての$^{123}$I標識dihydropyridine誘導体の合成

藤原　聡之、原田平　輝志、前田　稔(九大薬)、三宅義徳(国循セ放診部)、西村　恒彦(阪大トレーサ)

SPECTによる脳内カルシウムイオンチャネルイメージングを目的として[$^{123}$I]標識dihydropyridine誘導体の合成を検討した。4-クロロ-3-ニトロベンズアルデヒドを出発物質とし、5ステップで3-Ethyl-5-methyl-2,6-dimethyl-4-(3-nitro-4-iodophenyl)-1,4-dihydropyridine-3,5-dicarboxyrate 1 を得た(総収率9%)。1のヨウ素をトリメチルチンに置換して[$^{123}$I]iodo-dihydropyridine体合成の前駆体である2を79%の収率で合成した。N-クロロスクシンイミドを酸化剤として2と[$^{123}$I]NaIとを反応させ、3-Ethyl-5-methyl-2,6-dimethyl-4-(3-nitro-4-[$^{123}$I]iodophenyl-1,4-dihydropyridine-3,5-dicarboxyrateの合成に成功した。

## 480 $^{18}$F-FDTの脳局所動態について

原田平輝志（新技術事業団）、井上　修、鈴木和年（放医研）、前田　稔（九大薬）

2-デオキシ-2-[$^{18}$F]フルオロ-D-グロース($^{18}$F-FDT)は、組織のガラクトキナーゼ活性を反映した動態を示す代謝トラップ型のトレーサである。我々は、$^{18}$F-FDTの脳集積と脳機能との関連性を明らかにするための基礎的研究として、本トレーサのサル脳での局所動態を、動物用PETを用いて$^{18}$F-FDGと比較測定した。

アニオン法によるFDG自動合成装置を用いて合成した$^{18}$F-FDT及び$^{18}$F-FDGを、それぞれ赤毛サルに投与後経時的にPETスキャンを行った結果、$^{18}$F-FDTは投与初期における脳内分布、及び経時的動態共に$^{18}$F-FDGとは異なった挙動を示し、ヘキソキナーゼ活性とは異なる情報がとれる可能性が示唆された。

## 481 [$^{18}$F]標識GABA誘導体のラット体内分布

三宅義徳(国循セン、放診部)、植原敏勇、西村恒彦(阪大トレーサ)、小嶋正治(九大薬)

PETによる脳内GABAイメージング薬剤の開発を目的として、[$^{18}$F]標識GABA誘導体1,2-distearyl-3-(4-amino-2,3-di[$^{18}$F]fluoro-butyryl)propane-1,2,3-tri-ol([$^{18}$F]FGABA-G)のラット体内分布を検討した。[$^{18}$F]FGABA-Gを雄ウィスターラットに投与し、投与15、30および60分後の各臓器取り込み率(%dose/g 組織)を算出した。[$^{18}$F]FGABA-Gの集積は、脳では、15分後に左大脳0.086%、右大脳0.084%および小脳0.094%となり、60分後でもそれが保持された。一方、肺、肝臓、腎および心臓における集積は投与15分後に肺27.447%、肝臓1.411%、腎0.443%および心臓0.292%を示したが、以後緩和な集積低下が認められた。[$^{18}$F]FGABA-Gはラット脳へ早期に取り込まれ、その後ほぼ一定に保持されることが明かとなった。

Presented by Medical*Online