194　^{11}C－コリンを用いたポジトロンCT検査による脳腫瘍および肺癌の診断について

小坂　昇、原　敏彦（国立国際医療センター放）

^{11}C－コリンは、細胞膜リン脂質の合成速度を画像化する新しいトレーサーであり、これを用いたポジトロンCT検査は、脳腫瘍および肺癌の画像診断法としてきわめて有効である。この薬剤はジメチルアミノエタノールに^{11}C－ヨウ化メチルを溶かし、120℃で5分間反応させた後、反応液を留去し、乾固物を水に溶かしてから陽イオン交換樹脂カートリッジを通過させ、精製した。

この薬剤を実験動物に投与し、放射能分布を測定したところ、血中から各臓器への移行はきわめて速く、5分で血中放射能濃度はほとんど0になった。この性質により安定した組織分布画像が得られた。^{11}C－コリンを脳腫瘍および肺癌の患者に投与し、腫瘍の陽性描出に成功した。

195　末梢性ﾍﾞﾝｿﾞｼﾞｱｾﾞﾋﾟﾝﾚｾﾌﾟﾀｰ結合性放射ﾖｳ素標識 2'-fluoro-4'-iodo-diazepam の開発

窪田慈、佐治英郎、飯田靖彦、高石勇希、加藤弘太、間賀田泰寛、小西淳二、横山陽(京大･医、薬)吉武彬(住化)

最近、ｸﾞﾘｵｰﾏの陽性画像化を目的として末梢性ﾍﾞﾝｿﾞｼﾞｱｾﾞﾋﾟﾝﾚｾﾌﾟﾀｰ(PBR)結合性の4'-I-PK11195を開発し、その有用性を示したが、この化合物はｲﾝﾋﾞﾎﾞで非特異的な結合が高かった。そこで、この点を改善するためにより PBR 親和性の高い化合物の開発を計画し、ｼﾞｱｾﾞﾊﾞﾑを母体とし、これまでの構造－活性相関に関する検討から PBR 親和性の高い化合物として 2'-fluoro-4'-iodo-diazepam(FIDZ) を分子設計しその有用性について基礎的検討を行った。その結果予想通りPBRへの高い親和性を示し、また、C$_6$ glioma 移植ﾗｯﾄで PBRmRNA の発現部位に応じた FIDZ の高い取り込みがみとめられ、FIDZ は、ｸﾞﾘｵｰﾏ画像診断薬として有用であることが示された。

196　In-111標識アンチセンスオリゴマーを用いたがんの分子核医学診断の基礎的検討

渡辺直行、遠藤啓吾 (群大医/核)、沢井宏明、篠塚和夫、尾崎広明 (群大工/応化)、白神宜史 (日本メジ中研)

C-5 に置換基を導入したヌクレオシドであるウラシルを用いてキメラオリゴマーを化学的に合成する方法によりがん原遺伝子の一つであるN-myc の mRNA の転写開始領域に対する 15 mer のフォスフォジエステル結合骨格(o)およびモノチオエステル結合骨格 (s) のアンチセンスオリゴマーを合成した。これにキレート剤である DTPA-anhydride を修飾 ウラシルに抱合し、In-111を標識した。インビトロ および マウス を用いたインビボ実験を行ない、その化学的安定性、生体内分布およびイメージングを検討した。これらの結果よりIn-111標識アンチセンスオリゴマーをプローブとするがんの分子核医学診断の問題点および有用性を述べる。

197　オンカラム FDG 合成に用いるポリマー固定化触媒に関する検討

大崎勝彦，遠藤善丈，山崎茂樹（NKK）
友井正男（横国大工），岩田錬（東北大 CYRIC）

様々な種類の固定化4級塩樹脂を用いて，オンカラム FDG 合成におけるトラップ工程，標識反応工程に関する実験を実施した．トラップ率，標識反応収率に影響を及ぼす因子を検討し，最適操作条件および最適樹脂を探索した．最適な触媒活性基含有量のポリマー固定化ジメチルアミノピリジニウム塩あるいはポリマー固定化トリブチルホスホニウム塩を用いた場合，トラップ率 99%以上，標識反応収率 70-90%(EOB)の良好な結果が得られた．樹脂と触媒活性基との間にスペーサー鎖を導入することにより標識反応収率を向上させることができた．触媒活性基含有量の低い樹脂あるいは DVB 架橋度の高い樹脂を用いるとカラムの詰まりの問題も解決された．

198　3-deoxy-3-[^{18}F]fluoro-*myo*-inositol:[^{18}F]3dFIの合成および体内動態の検討

藤井 亮, 今堀良夫[1], 井戸達雄[2], 脇田員男, 大森義男[1], 楠木 司[1], 長田心示[2], 船木善仁[2], 岩田 錬[2], 上田 聖[1], 金綱隆弘(西陣病院, 京府医大 脳外科[1], 東北大 CYRIC[2])

細胞内情報伝達系におけるPI-turnoverの活動状態をｲﾉｼﾄｰﾙﾘｻｲｸﾘﾝｸﾞの視点から捉えることを目的として^{18}F標識3dFIの合成を行い、体内分布および代謝実験を行った。[^{18}F]3dFIの合成は、DASTに$^{18}F_2$をﾊﾞﾌﾞﾘﾝｸﾞさせ、Quebrachitolとの反応後BBr$_3$による脱ﾒﾁﾙ化を行い、最終的にHPLCにより精製した。合成時間は4時間で、収率:1～3.5％；純度:98%以上で[^{18}F]3dFIが得られた。ﾗｯﾄでの体内分布測定では、脳, 膵臓, 腫瘍(C6glioma)でaccumlation patternを示し、特に腫瘍への集積が顕著であった。代謝測定では、脳, 腫瘍ではPIへの代謝は認められなかったが、膵臓では若干PIへの代謝が認められた。

Presented by Medical*Online