

538 ^{123}I 及び $^{99\text{m}}\text{Tc}$ 標識 ネオ糖蛋白質を用いた肝シンチグラフィの検討

河 相吉, 中沢 緑, 小島通真, 西山 豊,
長谷川武夫, 田中敬正, 久保田佳嗣*, 鮫島美子*,
田代 裕** (関西医大 放, 3内*, 1生**)
鷲野弘明 (日本メジ)

ネオ糖蛋白質は肝実質細胞に特異的に存在する受容体に捕獲され、肝細胞内のライソゾームで分解される。我々は第28回本総会で、正常家兎における $^{99\text{m}}\text{Tc}-\text{Gal}_{27}-\text{HSA}$ について報告したが、今回は、 ^{123}I 及び $^{99\text{m}}\text{Tc}$ 標識 $\text{Gal}_{30}-\text{HSA}$ を、正常及びD-galactosamin投与急性肝障害ラットに静注し検討した。経時的な臓器放射活性の測定によると、 ^{123}I と $^{99\text{m}}\text{Tc}$ では排泄経路に差がみられたが、肝集積は同等であり、 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ 標識で十分な肝イメージ、放射能-時間曲線を得た。心での clearance T_{1/2} と肝の uptake T_{1/2}, T_{max} は、急性肝障害ラットでは有意に延長した。又、Binding Assay により直接測定した肝の受容体数とこれらの指標はよく相関した。肝ネオ糖蛋白質の減少する肝疾患に対して $^{99\text{m}}\text{Tc}-\text{Gal}-\text{HSA}$ は有用な検査法となり得ると考えられた。

540 $\text{N}-^{11}\text{C}-\text{メチルスピベロン}$ の合成

田中 明, 飯尾真弓 (住友重機械工業)
井上 修, 鈴木和年, 山崎統四郎 (放医研臨床)

近年、ドーパミンレセプタのマッピング剤として、 ^{11}C 又は ^{18}F で標識したスピベロン及びメチルスピベロンの有用性が注目されている。我々は $^{11}\text{C}\text{H}_3\text{I}$ から $\text{N}-^{11}\text{C}-\text{メチルスピベロン}$ を迅速かつ高収率で合成したので報告する。 $^{11}\text{C}\text{H}_3\text{I}$ は N-アルキル化に有用な物質で、今まで多くの放射性医薬品の合成に用いられている。しかし、スピベロンは目的部位以外に3級アミンが存在することにより、通常の条件で反応させると、副反応が発生し、目的物の収率は低下する。そこで、我々はスピベロンを強塩基で処理し、メチル化反応を触媒の存在下において、無水系溶媒中で行なうことにより、目的物を5分以内に90%以上の収率で得ることを可能にした。又、放射化学的純度は100%に近いものである。原料と目的物との分離は分取カラムを用いた高速液体クロマトグラフィを使用し、溶出液を減圧乾固した。所要時間は $^{11}\text{C}\text{H}_3\text{I}$ の合成を含めて50分である。

539 $^{11}\text{C}-\text{CoenzymeQ}_{10}$:新しい心筋イメージング剤
石渡喜一, 井戸達雄, 高橋俊博, 三浦由香,
川島孝一郎, 谷内一彦, 門間 桂, 岩田 錠
(東北大, サイクロ)

我々は、先にミトコンドリアの電子伝達系の構成成分である coenzymeQ₁₀ (CoQ₁₀)を ^{11}C で標識化し、ニコール60 (HCO-60)を用いて製剤化したが、血中濃度が高く組織への移行がきわめておそかつた。今回、 $^{11}\text{C}-\text{CoQ}_{10}$ をレシチンにてより製剤化したところ、心臓への集積が著しく高まつたので報告する。

$^{11}\text{CH}_3\text{I}$ によるメチル化で $^{11}\text{C}-\text{CoQ}_{10}$ を合成した。これを大豆レシチンにより可溶化し、ラットで体内分布を調べた。血中からきわめて速く組織へ移行した。リポソームの性質を反映して肝及び脾への集積は高かつたが、心への集積はこれらにつき、血中濃度の5~10倍に達した。心筋への集積は、ランゲンドルフ標本による *in vitro* 実験でオートラジオグラフィーによつても確かめられた。また、胎盤の透過性も HCO-60 で製剤化したものに比べて良くなり、胎盤においては心への集積が最も高かつた。

以上のことから、レシチンを用いて製剤化した $^{11}\text{C}-\text{CoQ}_{10}$ は、心筋のイメージングに有用なポジトロントレーザとしてその応用が期待される。

541 代謝交換型トレーサーにおけるキャリア効果とその応用

井上 修, 入江俊明, 山崎統四郎 (放医研臨床)
伊藤高司 (日本医大)

著者等はトレーサー基質の脳内での代謝による化学形変換を利用して、脳内酵素活性を推定する方法を開発しており、 $^{11}\text{C}-\text{N}, \text{N}$ ジメチルフェネチルアミンが MAO-B 活性評価に適したトレーサーである事を見出した。この方法においては、脳内の基質濃度を変える事によって代謝速度が変化する事が予想される。一般に酵素反応速度は基質濃度 [S] が km と等しい時点で、キャリーフリーの状態の $1/2$ に低下する。In Vivoにおける基質の代謝速度は酵素量、内在性基質濃度、内在性 Inhibitor 濃度によって変化し、特に内在性 Inhibitor の増減によりその酵素活性の調節が行なわれている可能性が大きい。内在性 Inhibitor 量の増加は見かけ上の km 値の上昇をもたらすので、代謝速度を $1/2$ に低下させるのに必要な基質濃度は高くなる。従って、このようなトレーサーを用いるに際して、キャリア効果をうまく併用すると、種々の生理条件下における酵素活性の調節に関して有用な情報がとれる可能性がある。以上の観点から、 $^{14}\text{C}-\text{DMPEA}$ の体内動態についてキャリア効果を検討し、その有用性と限界について考察した。