

29-0431 W124-1

放射性ヨウ素アスコルビン酸の開発と副腎機能診断プローブとしての評価

○金城 哲雄¹, 山本 文彦¹, 加藤 裕立¹, 権藤 重喜², 柳瀬 敏彦², 向 高弘¹, 前田 稔¹ (¹九大院薬,²九大院医)

目的 L-アスコルビン酸は生体内の重要な抗酸化物質の1つであり、他に抗腫瘍活性や様々な生化学反応に関与している。我々はアスコルビン酸の生理的機能を利用した核医学診断薬の開発を目指している。今回、アスコルビン酸の C-6 位に ¹³¹I を導入した 6-deoxy-6-[¹³¹I]iodo-L-ascorbic acid (¹³¹I-DIA) の効率的な標識合成法を開発すると共に核医学診断プローブとしての基礎的な評価を行った。

方法・結果 ¹³¹I-DIA は Na[¹³¹I]I と 6-bromo-6-deoxy-L-ascorbic acid とのハロゲン交換反応により、全合成時間 70 分、放射化学的収率 70% で効率よく得られた。健常ラットにおける生体内分布を調べた結果、投与後 60 分において副腎に 14 %dose/g の集積があり、副腎/肝臓比は 10.4、副腎/腎臓比は 6.7 と副腎特異性の高い放射能分布を示した。

さらに副腎機能診断薬としての基礎評価を行った結果、4-アミノピラゾロピリミジン前投与処理で副腎機能を亢進させたラットにおいて、¹³¹I-DIA の副腎への集積はコントロールに比べて約 2 倍であった。副腎皮質癌：Y-1 細胞移植マウスを用いた評価の結果、癌組織に高い集積 (9.0 %dose/g) を示し、腫瘍/血液比は 7.3、腫瘍/筋肉比は 6.6 であった。

考察 以上のことから、¹³¹I-DIA は少なくとも副腎皮質の機能を反映した診断薬として発展性のあるプローブ分子であることが示唆された。現在、副腎髄質機能亢進モデルを用いた評価を行っており、この結果も合わせて報告する予定である。

