

29P1-am166

核医学診断薬を目指した5位置換アスコルビン酸誘導体の合成と放射性ヨウ素標識

加藤 裕立¹, ○木野 友博¹, 山本 文彦¹, 金城 哲雄¹, 向 高弘¹, 前田 稔¹(¹九大院薬)

【目的】生体内では活性酸素(ROS)や酸素ラジカルなどに起因する酸化還元バランスの破綻が、種々の疾患の発生や病態に影響を及ぼすと考えられている。特に脳神経細胞は酸化ストレスによる障害を受けやすい。本研究ではこの脳内酸化還元バランスの変化を画像として描出可能な核医学診断薬の開発を目的としている。

【方法】代表的な抗酸化物質として知られるL-アスコルビン酸(AsA)をリード化合物として5位のヒドロキシル基にヨードベンジル基を導入したヨウ素化アスコルビン酸(5-IBA)を設計し、合成法及び放射性ヨウ素標識法の開発を目指した。またAsAの酸化体は2環性のヘミケタール構造をとって脳へ素早く移行することが知られているので、5-IBAの酸化体5-IBDAは脳移行性の向上が期待される。

【結果と考察】本研究ではAsAを出発物質とした6ステップによる5-IBA合成法を開発した。また¹²⁵Iによる5-IBAの放射性ヨウ素標識に成功した。また5-IBAの酸化体5-IBDAがヘミケタール構造をとることが示唆された。以上の結果よりAsAの5位置換体が合成可能であることが示された。今後5-IBDAの標識合成法の確立を経て動物実験へと展開していく予定である。

