

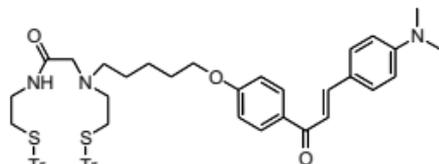
26N-pm02

脳内アミロイドイメージングのための ^{99m}Tc 標識カルコン誘導体の合成と評価
○池岡 諒一¹, 小野 正博^{1,2}, 原武 衛¹, 中山 守雄¹(¹長崎大院医歯薬, ²京大院薬)

【目的】脳内に蓄積したアミロイド β (A β)の生体イメージングはアルツハイマー病の診断に繋がると考えられる。我々はこれまでに、放射性ヨウ素標識カルコン誘導体が有望な A β イメージングプローブとして機能し得ることを報告してきた。本研究では、臨床診断において最も汎用性の高い放射性核種である ^{99m}Tc を用いた A β イメージングプローブの開発を目的として、カルコンを基本骨格とする ^{99m}Tc 標識化合物を合成し、その有用性について検討した。

【方法】 ^{99m}Tc 標識前駆体(Tr-MAMA-CH)は、アルドール縮合反応でカルコン骨格を形成後、1,5-dibromopentane を用いてアルキル鎖及び ^{99m}Tc との錯形成部位である Tr-MAMA を導入することにより合成した(図)。Tr 基を脱保護後、 ^{99m}Tc -glucoheptonate との配位子交換反応により ^{99m}Tc -MAMA-CH を作製した。A β (1-42)凝集体を用いたインビトロ結合実験により、A β 結合性を検討した。また、脳移行性を評価するため、正常マウスを用いた体内放射能分布実験を行った。

【結果及び考察】Tr-MAMA-CH を ^{99m}Tc 標識した結果、放射化学的収率 80%、放射化学的純度 95%以上で目的とする ^{99m}Tc -MAMA-CH を得た。また、 ^{99m}Tc -MAMA-CH は分取溶液中で 24 時間以上安定であった。 ^{99m}Tc -MAMA-CH は放射性ヨウ素標識体と同様に A β (1-42)凝集体への結合親和性を示した。しかし、正常マウス体内放射能分布実験において、顕著な脳移行性は認められなかった。以上の結果より、カルコンを基本骨格とする ^{99m}Tc 標識 A β イメージングプローブの開発には、脳移行性の向上のためのさらなる改良が必要であると考えられた。



Chemical structure of Tr-MAMA-CH