

# 30TH-am01

ペプチド標識を目的とする新規テクネチウム-99mトリカルボニル化合物の開発  
○加戸 光<sup>1</sup>, 鈴木 千恵<sup>1</sup>, 上原 知也<sup>1</sup>, 荒野 泰<sup>1</sup> (<sup>1</sup>千葉大院薬)

【目的】放射性核種標識低分子ペプチドを生体に投与すると、腎臓への非特異的な集積が観察される。この問題を解消するために我々は、標識ペプチドが腎細胞に取り込まれる前に、刷子縁膜酵素の作用により、尿排泄性の放射性代謝物であるメタヨウ素馬尿酸、さらには馬尿酸様の構造を有する有機金属放射性レニウム-188 標識化合物 [<sup>188</sup>Re]CpTR-Glyを用いてきたが、いずれも標識後に精製を行うなど標識合成が煩雑である。本検討では、標識が容易で安定なテクネチウム-99mトリカルボニルアクア錯体(<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>(OH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>)を本方法に適用する目的で、その基本概念である尿排泄性の放射性代謝物として遊離される<sup>99m</sup>Tc標識化合物の設計、合成、評価を行った。【方法】[(Pyridin-2-ylmethyl)amino]-acetic acid (PG)を基本骨格に選択し、pyridin環にカルボン酸を付加後、さらにグリシンを結合したGPGを設計、合成した。配位部分の評価を行うために、PGと<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>(OH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>との錯形成および過剰の配位子をHPLCで除いた後の10 mMヒスチジン溶液中の安定性を評価した。次いで、<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>-GPGの Maus体内動態を小動物用SPECT/CT装置で評価した。

【結果】<sup>99m</sup>Tc-PGは<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>(OH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>と100°C、30分の標識条件において、0.01mMの濃度で90%以上の標識率で得られた。本<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>錯体は、ヒスチジン溶液中においても安定に存在し、<sup>99m</sup>Tcの配位子として有用と考えられた。また、小動物用SPECT/CT装置を用いた Maus体内動態の評価より<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>-GPGは投与早期より、腎臓から膀胱へと排泄され、投与1時間半後には膀胱のみが描出された。【結語】<sup>99m</sup>Tc(CO)<sub>3</sub>-GPGは速やかに尿排泄され、標識ペプチド放射性代謝物として有用と考えられる。