

28AB-am404S

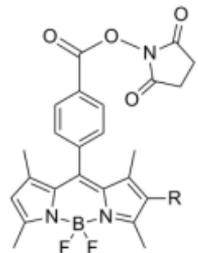
放射性ヨウ素標識 BODIPY を用いたタンパク質の新規 RI/蛍光デュアルラベル法の開発

○池畑 裕貴¹, 小野 正博¹, 吉村 優志¹, 丁寧¹, 渡邊 裕之¹, 佐野 紘平^{1,2}, 佐治 英郎¹ (京大院薬,²京大病院)

【目的】近年、分子イメージング研究領域において、単一の分子に複数の検出素子を付与したマルチモダル分子イメージングプローブの開発が注目されている。本研究では、蛍光色素として汎用されている BODIPY を母核に選択し、これに放射性ヨウ素 (¹²⁵I)、およびタンパク質との結合部位として、活性化エステル (*N*-ヒドロキシスクシンイミド) を導入した、¹²⁵I-BODIPY-NHS を設計・合成し、そのタンパク質の RI/蛍光デュアルラベル化試薬としての有用性について検討を行った。

【方法】常法により活性エステル構造を有する BODIPY 誘導体 (H-BODIPY-NHS, I-BODIPY-NHS) (図) を合成した。酸化剤の存在下、H-BODIPY を [¹²⁵I]NaI と反応後、逆相 HPLC 法により分離・精製を行い、放射性ヨウ素 (¹²⁵I) 標識体 (¹²⁵I-BODIPY-NHS) を得た。¹²⁵I-BODIPY-NHS とウシ血清アルブミン (BSA) を結合させ、PD10 カラムを用いたゲル濾過クロマトグラフィー (GPC) にて BSA 画分を分離・精製し、その放射能および蛍光強度を測定した。

【結果・考察】H-BODIPY-NHS と [¹²⁵I]NaI との標識反応により、1 つのピロール環に選択的に ¹²⁵I が導入された ¹²⁵I-BODIPY-NHS が 48% の放射化学的収率で得られた。¹²⁵I-BODIPY-NHS を BSA と反応後、GPC により精製した BSA 画分には、放射能と蛍光が同時に検出された。この結果は、BSA の RI/蛍光のデュアルラベル体の生成を支持するものであり、¹²⁵I-BODIPY-NHS が様々な疾患標的指向性タンパク質の RI/蛍光デュアルラベル化試薬として有用であることが示された。



R = H (H-BODIPY-NHS)
R = I (I-BODIPY-NHS)

図. BODIPY 誘導体の化学構造