

# 28W-am06S

放射性ヨウ素標識薬剤の新たな標識母体としてのヨウ化アルキル

○鷲谷 奈菜<sup>1</sup>, 鈴木 博元<sup>1</sup>, 田中 浩士<sup>2</sup>, 佐藤 由衣<sup>1</sup>, 龍田 真帆<sup>2</sup>, 稲田 慎之介<sup>2</sup>, 上原 知也<sup>1</sup>, 荒野 泰<sup>1</sup> (<sup>1</sup>千葉大院薬, <sup>2</sup>東工大物質理工)

【背景・目的】放射性ヨウ素標識化合物の合成では、酸化剤の存在下で芳香族炭素に放射性ヨウ素を結合する方法が生体内で安定な標識体の作製に汎用されている。これに対して、アルキル炭素にヨウ素を結合したヨウ化アルキルは、一般に生体内で容易に脱離することから、放射性ヨウ素標識薬剤の母体には使用されていない。本研究では生体内で安定な新規ヨウ化アルキルの作製を目的として、下図 (III) に示す構造の化合物を合成し、その生体内安定性を検討した。

【方法】化合物 (I) (Nph 体,  $R_2 = \text{naphthylmethoxy}$  および Niz 体,  $R_2 = 2\text{-nitroimidazole}$ ) を合成し、そのアセトニトリル溶液に  $\text{Na}^{125}\text{I}$  を添加し、 $120^\circ\text{C}$  で 1 時間反応させて (II) を得た。(II) を精製後、酸性溶液中でアセタール基を除去して目的物 (III) を得た。化合物 (II) および (III) は非放射性ヨウ素体を合成し、その TLC および HPLC 挙動の比較から標識体の構造を確認した。(III) を正常マウスに投与し、その体内動態及び尿中放射活性の分析結果から放射性ヨウ素の生体内安定性を評価した。

【結果・考察】酸化剤非存在下、Nph 体では放射化学的収率 91.9%、Niz 体では 87.3% の高収率で (II) を与えた。(III) をマウスに投与したところ、Nph 体、Niz 体とも脱ハロゲン化の指標となる胃や甲状腺への集積量は低値であった。Nph 体は主に尿中へと排泄され、HPLC の尿中放射活性の分析結果にて遊離の I<sup>-</sup> の生成割合は 5% 程度であった。以上の結果から、(III) は生体内で安定に存在することを示唆し、放射性ヨウ素を始めとする放射性ハロゲンの新たな標識母体としての可能性を示す。

