

Title	エチレンジアミンジ酢酸およびその金属錯体の腫瘍親和性
Sub Title	
Author	加留部, 善晴(Karube, Yoshiharu) 松岡, 陸 (Oya, Masato) 大矢, 雅人(Imoto, Takeshi) 井本, 武(Kono, Akira) 河野, 彬(Matsushima, Yoshikazu) 松島, 美一
Publisher	共立薬科大学
Publication year	1983
Jtitle	共立薬科大学研究年報 (The annual report of the Kyoritsu College of Pharmacy). No.28 (1983.) ,p.105- 106
JaLC DOI	
Abstract	
Notes	学会講演要旨
Genre	Technical Report
URL	https://koara.lib.keio.ac.jp/xoonips/modules/xoonips/detail.php?koara_id=AN00062898-00000028-0108

慶應義塾大学学術情報リポジトリ(KOARA)に掲載されているコンテンツの著作権は、それぞれの著作者、学会または出版社/発行者に帰属し、その権利は著作権法によって保護されています。引用にあたっては、著作権法を遵守してご利用ください。

The copyrights of content available on the KeiO Associated Repository of Academic resources (KOARA) belong to the respective authors, academic societies, or publishers/issuers, and these rights are protected by the Japanese Copyright Act. When quoting the content, please follow the Japanese copyright act.

化学修飾シリカゲルを用いた HPLC に関する基礎研究

西野美和子, 田野井淳子, 高井信治*, 高橋浩*, 松島美一, 永田佳子

〔第26回液体クロマトグラフ研究会 (1983年1月, 京都) で発表〕

高速液体クロマトグラフィー (HPLC) の充てん剤として用いられる化学修飾シリカゲルについて修飾基と機能の相関を調べるための基礎的研究を行った。同一のシリカゲルを C₂, C₆, C₁₂, C₁₈ のアルキル基, およびフェニル基で修飾し, フタル酸エステルを試料, 種々の割合のアセトニトリル-水を溶離液として HPLC を行った。充てん剤の修飾基 C 数, 保持時間, *k'* 値, 溶離液組成間の相関を明らかにした。

* 東京大学生産技術研究所

ODS-シリカの合成とそれを用いた HPLC に関する基礎的研究

田野井淳子, 西野美和子, 高井信治*, 鶴 達郎*, 高橋 浩*, 松島美一, 永田佳子

〔第26回液体クロマトグラフ研究会 (1983年1月, 京都) で発表〕

高速液体クロマトグラフィー (HPLC) 用充てん剤として市販されているものは粒子径, 表面積, 修飾の種類等の記載がなく, 同一とされる充てん剤間にも溶離挙動が異なることが屢々ある。物理的, 化学的に正確な性質の分子充てん剤を得る目的で ODS-シリカを合成した。ケイ酸ナトリウムをゲル化, 脱水, 風篩による分級後, オクタデシル化を行った。得られた ODS-シリカについて孔径分布を測定, これを用いてアセトニトリル-水系で多環芳香族化合物の HPLC を行った。

* 東京大学生産技術研究所

エチレンジアミンジ酢酸およびその金属錯体の腫瘍親和性

加留部善晴*, 松岡 睦**, 大矢雅人**, 井本 武**, 河野 彬**, 松島美一

〔日本薬学会 第103年会 (1983年4月, 東京) で発表〕

〔目的〕 我々は担がん動物のシンチグラフィーにおいてエチレンジアミン-*N*, *N*-ジ酢酸 (EDDA) の ^{99m}Tc 標識体が腫瘍を鮮明に描画することを見出し, 発表した。^{99m}Tc-EDDA の腫瘍親和性の機序の研究と新しい腫瘍親和性錯体の検索を目的として, ^{99m}Tc 以外の放射性金属 (⁵¹Cr, ⁵⁷Co, ⁵⁹Fe, ⁶⁷Ga) の EDDA 錯体および ³H 標識 EDDA の腫瘍親和性を調べた。

〔方法〕 EDDA 0.2 mmol/ml 溶液 1 ml (pH 7.0) に, 放射性金属イオン 0.1 ml (50 μCi) を添加し標識した。³H 標識 EDDA は ³H 標識ヨード酢酸を用い合成した。⁵⁷Co EDDA 錯体に 3.3%

H₂O₂ 溶液 50 μ l を添加してオキソ錯体を合成した。エールリッヒ癌移植マウスまたは腫瘍をつくったマウスに標識体を静注し、放射能の組織分布を調べた。

〔結果・考察〕 Fe, Cr, Ga 標識体はいずれも血中放射能が高く腫瘍親和性が低かった。また³HEDDA もがん部位への大きな取り込みはなかった。それに対し ⁵⁷CoEDDA は高い腫瘍親和性を示した。投与後3時間で Tumor/Blood 比が 8.92, Tumor/Muscle 比が 14.51 であった。⁵⁷CoEDDA のオキソ錯体では更にごん集積性が増加し、3時間後の Tumor/Blood 比が 17.13, Tumor/Muscle 比が 27.46 であった。このオキソ錯体は膿瘍にも高い親和性を示した。これらの結果より、二量体または多量体構造の予想される ^{99m}Tc, ⁵⁷Co, ⁵⁷Co オキソ錯体が腫瘍親和性を獲得することが判明した。臨床使用に適する放射性 Co 核種を用いれば、Co オキソ錯体は優れたがん診断剤となるであろう。

* 福岡大学薬学部

** 九州がんセンター

ヒト胃癌組織のチミジンホスホリラーゼの精製とその基質特異性

菅田節朗, 原 泰寛*, 河野 彬*, 松島美一

〔日本薬学会 第103年会 (1983年4月, 東京) で発表〕

〔目的〕 われわれは1-(テトラヒドロ-2-フラニル)-5-フルオロウラシル (テガフル) の5-フルオロウラシル (FU) への分解がヒト肺癌からの粗チミジンホスホリラーゼ (TPase) により触媒されることを報告した。本研究ではヒト胃癌から TPase をより高度に精製し、この事実を定量的に確認するとともに、その他の基質特異性について検討した。

〔実験〕 ヒト胃癌組織のホモジネート上清を硫酸分画 (20~40%) し、Con A-セファローズ, DEAE-セフェセル, ハイドロキシルアパタイトの各カラムクロマトグラフィーで精製した。各精製段階の試料についてチミジン, 5'-デオキシ-5-フルオロウリジン (5'-DFUR), テガフル, ウリジンを基質としたときの酵素活性を生成ピリミジンの HPLC 定量により測定した。

〔結果〕 16 μ M における各基質のチミジンに対する活性比 (%) は精製の初めと終りで、5'-DFUR (11.4→6.5), テガフル (0.018→0.015), ウリジン (10.8→0.22) と変化した。精製試料による TPase の K_m 及び V_{max} (37°, 1 ml あたり, 生成したピリミジン μ mol hr⁻¹ (mg protein)⁻¹) は表のようになった。これらの結果より次の結論を得た。1) ヒト癌組織内におけるテガフルの酵素的分解は主に TPase により触媒され、その活性はチミジンの約 1/100 である。2) TPase はウリジンをもわずかながら分解する。しかし本精製試料の残余のウリジンに対する活性は、主に不純物のウリジンホスホリラーゼによる。

基 質	チ ミ ジ ン	5'-DFUR	テ ガ フ ル	ウ リ ジ ン
K _m (M)	1.68 × 10 ⁻⁴	1.72 × 10 ⁻³	1.33 × 10 ⁻²	4.76 × 10 ⁻²
V _{max}	826	531	7.02	3.47

* 九州がんセンター