

**第15回次世代を担う若手のためのフィジカル・ファーマフォーラム
(PPF2017)**

参加・講演申込書

ふりがな 氏名	ヌルマヤ エフェンディ Nurmaya Effendi
所属	金沢大学大学院医薬保健学総合研究科創薬科学専攻
身分あるいは学年	博士後期課程 3 年
性別	女
連絡先住所	〒920-1167 石川県金沢市旭町 2 丁目 4 番 1 1 号 畝田ハウス 101号
電話番号	090-1317-2891
E-mail	nurmaya82@gmail.com
薬学会会員 番号	
その他連絡 事項	

該当するものに○印を付けてください。

参加登録区分	日本薬学会会員（一般）	[]
	日本薬学会非会員（一般）	[]
	日本薬学会会員（学生）	[]
	日本薬学会非会員（学生）	[○]
一般講演希望の有無	有（次頁の講演申込書もご記入下さい）	[○]
	無	[]

※事務局記入欄

受付日		受付 No.	
-----	--	--------	--

(PPF2017) 一般講演申込書

1. 演題

Synthesis and evaluation of new radiotracers for PDGFR β imaging

2. 所属(プログラムに記載する所属となります。共同研究の場合や発表者が複数の所属を保つ場合は、発表者氏名と所属の右上に上付き数字を付けて区別して下さい)

Pharmaceutical Sciences, Kanazawa University¹, Institute for Frontier Science Initiative, Kanazawa University², Graduate School of Medicine, Dentistry and Pharmaceutical Sciences, Okayama University³, Advanced Science Research Centre, Kanazawa University⁴

3. 発表者氏名(発表者に○をつけて下さい)

○Nurmaya Effendi¹, Kazuma Ogawa^{1,2}, Kenji Mishiro², Takeshi Takarada³, Daisuke Yamada³, Yoji Kitamura⁴, Kazuhiro Shiba⁴, Akira Odani¹

4. 発表者氏名(ふりがな)

ヌルマヤ エフェンディ

5. 演者の身分(学生の方は学年も明記してください)

金沢大学大学院医薬保健学総合研究科創薬科学専攻博士後期課程 3 年

6. 発表分野(分析化学、物理化学、無機・放射のいずれか)。

無機・放射

7. 連絡先

住所: 石川県金沢市旭町 2 丁目 4 番 1 1 号 畝田ハウス 101 号

電話番号: 090-1317-2891

メールアドレス: nurmaya82@gmail.com

Synthesis and evaluation of new radiotracers for PDGFR β imaging

(Pharmaceutical Sciences, Kanazawa University¹, Institute for Frontier Science Initiative, Kanazawa University², Graduate School of Medicine, Dentistry and Pharmaceutical Sciences, Okayama University³, Advanced Science Research Centre, Kanazawa University⁴) ONurmaya Effendi¹, Kazuma Ogawa^{1,2}, Kenji Mishiro², Takeshi Takarada³, Daisuke Yamada³, Yoji Kitamura⁴, Kazuhiro Shiba⁴, Akira Odani¹

【Purpose】

Platelet-derived growth factor receptor β (PDGFR β) is one of transmembrane tyrosine kinase receptors and overexpressed in various malignant tumors. Radiolabeled ligands for PDGFR β could be a convenient tool for imaging of tumor overexpressing PDGFR β . The images can give useful information to expect the effectiveness of therapy. The purpose of this study is to synthesize and evaluate radioiodinated IQP (1-[2-[5-(2-methoxyethoxy)-1*H*-benzo[*d*]imidazol-1-yl]quinolin-8-yl]piperidin-4-amine) derivatives as PDGFR β imaging agents. We designed and synthesized [¹²⁵I][1-[5-iodo-2-[5-(2-methoxyethoxy)-1*H*-benzo[*d*]imidazol-1-yl]quinoline-8-yl]piperidin-4-amine] ([¹²⁵I]IIQP, Fig. 1). Its potential as a PDGFR β imaging agent was evaluated.

【Method】

[¹²⁵I]IIQP was prepared using an iododestannylation reaction (Fig. 1). Cell viability assay, partition coefficient, *in vitro* stability, *in vitro* cellular uptake study using PDGFR β -positive cells (BxPC3-luc) and PDGFR β -negative cells (MCF7), *in vitro* and *in vivo* blocking study, and biodistribution study in mice were performed.

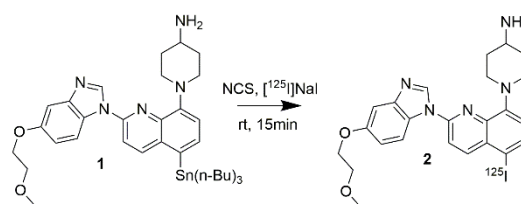


Fig. 1. Radiolabeling of [¹²⁵I]IIQP

【Result and discussion】

Tin precursor (**1**) was synthesized with an overall yield of 6.4%. [¹²⁵I]IIQP was prepared with radiochemical yield of 95.0% and with radiochemical purity of 99.5% after purification using HPLC. The log *P* value of [¹²⁵I]IIQP was 2.71 ± 0.03 . After incubation in 0.1 M PBS pH 7.4 for 24 h, $93.9 \pm 0.4\%$ of [¹²⁵I]IIQP remained intact. [¹²⁵I]IIQP presented the higher accumulation in positive-PDGFR β cells than in negative-PDGFR β cells. The uptake in positive-PDGFR β cells was significantly reduced by co-culture with an excess amount of PDGFR β ligands. [¹²⁵I]IIQP demonstrated tumor uptake (1.29 %ID / gram) in BxPC3-luc tumor-bearing mice at 1 h postinjection. Pretreatment of an excess amount of IQP significantly decreased the tumor uptake of [¹²⁵I]IIQP. It means that the tumor uptake is PDGFR β -specific. These results indicate that radioiodinated IQP derivatives can be promising PDGFR β imaging agents.