

^{11}C -N, N-Dimethylphenethylamine- α , α -d₂ の
重水素アイソトープ効果：脳内代謝変換速度の減少

橋本 謙二, 井上 修*, 鈴木 和年*,
山崎 統四郎*, 小嶋 正治**

Nuclear Medicine & Biology, 13, 79-80 (1986)

Deuterium Isotope Effect of $^{11}\text{C}_1$ -N, N-Dimethylphenethyl-amine- α ,
 α -d₂; Reduction in Metabolic Trapping Rate in Brain

Kenji HASHIMOTO, Osamu INOUE*, Kazutoshi SUZUKI*,
Toshiro YAMASAKI*, and Masaharu KOJIMA**

ABSTRACT: We synthesized ^{11}C -N, N-dimethylphenethylamine- α , α -d₂ (^{11}C -DMPEA- α , α -d₂) and compared it with the biodistribution of ^{11}C -DMPEA in mice. The incorporation rate of ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂ into mouse brain was almost the same as ^{11}C -DMPEA. However, the production rate of labeled metabolite (^{11}C -dimethylamine) was reduced by substitution of α -hydrogen with deuterium. The radioactivity which remained in the brain 1 hr after injection of ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂ was also significant decreased by pretreatment with various dosages of l-deprenyl, a specific MAO-B inhibitor, in a dosage-dependent manner. It can be seen that ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂ was oxidized by MAO-B at a slow rate than ^{11}C -DMPEA.

抄録 ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂の標識合成を行い、マウスにおける体内分布を調べ、 ^{11}C -DMPEAの体内分布と比較した。投与直後の放射能の脳への取り込みは、 ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂と ^{11}C -DMPEAでは差はみられなかった。しかしながら、代謝物である ^{11}C -ジメチルアミンの生成速度は、 α 位の水素を重水素に置換する事により著明に減少した。 ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂静注1時間後に脳内に残っている放射能は、MAO-B阻害剤であるl-デプレニルの前投与により用量依存的に減少した。これらの事から、 ^{11}C -DMPEA- α , α -d₂は ^{11}C -DMPEAより遅い速度でMAO-Bより酸化されると考えられる。

* Division of clinical Research, National Institute of Radiological Sciences 放射線
医学総合研究所, 臨床研究部

** Faculty of Pharmaceutical Sciences, University of Kyushu 九州大学薬学部