

ヒト脳内ベンゾジアゼピンセレプターの画像化

篠遠 仁*, 山崎 統四郎*, 井上 修*, 伊藤 高司*,
鈴木 和年*, 橋本 謙二, 館野 之男*, 池平 博夫*

Journal of Nuclear Medicine, 27, 1593-1599 (1986)

Visualization of Specific Binding Sites of Benzodiazepine in Human Brain

Hitoshi SHINOTOH*, Toshiro YAMASAKI*, Osamu INOUE*, Takashi ITOH*,
Kazutoshi SUZUKI*, Kenji HASHIMOTO, Yukio TATENO*, and Hiroo IKEHIRA*

ABSTRACT: Using ^{11}C -labeled Ro15-1788 and positron emission tomography, studies of benzodiazepine binding sites in the human brain were performed on four normal volunteers. Rapid and high accumulation of ^{11}C activity was observed in the brain after i.v. injection of [^{11}C] Ro15-1788, the maximum of which was within 12 min. Initial distribution of ^{11}C activity in the brain was similar to the distribution of the normal cerebral blood flow. Ten minutes after injection, however, a high uptake of ^{11}C activity was observed in the cerebral cortex and moderate uptake was seen in the cerebellar cortex, the basal ganglia, and the thalamus. The accumulation of ^{11}C activity was low in the brain stem. This distribution of ^{11}C activity was approximately parallel to the known distribution of benzodiazepine receptors. Saturation experiments were performed on four volunteers with oral administration of 0.3-1.8 mg/kg of cold Ro 15-1788 prior to injection. Initial distribution of ^{11}C activity following injection peaked within 2 min and then the accumulation of ^{11}C activity decreased rapidly and remarkably throughout the brain. The results indicated that [^{11}C] Ro15-1788 associates and dissociates to specific and nonspecific binding sites rapidly and has a high ratio of specific receptor binding to nonspecific binding in vivo. Carbon-11 Ro15-1788 is a suitable radioligand for the study of benzodiazepine receptors in vivo in humans.

抄録 ^{11}C -Ro 15-1788 とポジトロンエミッショントモグラフィーを用いて、生きたヒト脳ベンゾジアゼピンレセプターの研究を4人の正常人について行った。 ^{11}C -Ro 15-1788 静注後、速くかつ高い放射能の集積が脳においてみられた。投与初期のトレーサの分布は正

常脳血流の分布と相似するものであった。しかし、投与10分後、放射能の高い取り込みが大脳皮質、基底核、視床でみられた。脳幹部の放射能は低かった。放射能の分布はベンゾジアゼピンレセプターの分布と相似するものであった。次に、 ^{11}C -Ro 15-1788 静注前にコールドのRo 15-1788 (0.3-1.8mg/kg) を服用することにより飽和実験を行った。放射能の集積はコントロール実験と比較して脳全体において急速に減少した。これらの結果より、 ^{11}C -Ro 15-1788 は *in vivo* でも特異的結合の割合が大きいため、生きたヒト脳ベンゾジアゼピンレセプター研究のための優れたラジオリガンドであると考えられる。

* Division of Clinical Research, National Institute of Radiological Sciences.

放射線医学総合研究所, 臨床研究部