

4-ブロム-6-ニトロキパジン：In Vivo における  
5-ヒドロキシトリプタミン  
再取り込み部位研究用の新規リガンド

橋本謙二，五郎丸毅

*Neuropharmacology*, 31, 869-874 (1992)

4-Bromo-6-nitroquipazine: A New Ligand for Studying  
5-Hydroxytryptamine Uptake Sites In Vivo

Kenji HASHIMOTO and Tsuyoshi GOROMARU

**ABSTRACT** The present study was undertaken to evaluate 2 bromo-derivatives (4-bromo-6-nitroquipazine and 6-bromoquipazine) of quipazine as potential ligands for studying 5-hydroxytryptamine (5-HT; serotonin) uptake sites in the brain in vivo. The inhibition experiments of [<sup>3</sup>H] 5-HT uptake into synaptosomes from rat brain and of the binding of [<sup>3</sup>H] 6-nitroquipazine to membranes of rat brain showed that 4-bromo-6-nitroquipazine and 6-bromoquipazine were very potent and selective inhibitors of 5-HT uptake in vitro, very close to that of 6-nitroquipazine. Furthermore, 4-bromo-6-nitroquipazine was about a 2-fold more potent inhibitor of specific binding of [<sup>3</sup>H] 6-nitroquipazine in vivo in the hypothalamus of mouse brain than 6-bromoquipazine. Thus, 4-bromo-6-nitroquipazine seems to be superior to 6-bromoquipazine, as a potent ligand for in vivo imaging of 5-HT uptake sites in the brain.

抄録 脳内のセロトニン取り込み部位に対する強力なリガンドを開発するため，2種の臭素化キパジン誘導体，4-ブロム-6-ニトロキパジン (Br-NQ)及び6-ブロムキパジン (Br-Q)について検討した。ラット脳のスナプトソームへの<sup>3</sup>Hセロトニンの取り込み及びラット脳の膜標品への<sup>3</sup>H-6-ニトロキパジン (NQ)の結合の阻害効果より両化合物を評価した所，NQと同じく Br-NQ及び Br-Qは強力で選択的なセロトニン取り込み阻害作用を有することが明らかとなった。さらに，ラット脳視床下部への in vivo における<sup>3</sup>H-NQの結合阻害効果は Br-Qに比べて Br-NQの方が2倍強力

であり、Br-NQはセロトニン取り込み部位のイメージング剤となりうることが認められた。