

에스트라디올 유도체의 합성 및 체내분포

Synthesis of estradiol derivatives and their biodistribution.

김상욱, 양승대, 서용섭, 안순혁, 전권수, 최창운, 임상무,
원자력병원

유국현
동국대학교

요 약

최근 수년간 다양한 에스트로겐 수용체에 근거한 방사성의약품들 중에서 estradiol의 17 α -iodovinyl 유도체와 11 β -methoxy유도체가 유방암의 영상화를 통한 진단 시약으로서 가장 좋은 가능성을 나타냄이 보고되어오고 있다. 유방암의 영상에 관한 연구는 곧 에스트로겐 수용체 농도의 측정과 직접적으로 연관을 맺고 있으며, 실제로 에스트로겐 수용체의 농도가 높은 유방암 환자의 경우 이러한 호르몬 therapy를 이용하기도 한다. 본 연구에서는 estradiol 유도체인(17 α ,20E)-and(17 α ,20Z)-21-Iodo-19 norpregna-1,3,5(10),20-tetraene-3,17-diol과(17 α ,20E)-and(17 α ,20Z)-21-Iodo-19norpregna-1,3,5(10),20-tetraene-3,17-diol 3- (methylether)를 합성하여 이 물질들의 분광학적 특성을 연구하였고, 이를 바탕으로 하여(17 α ,20E)-21-Iodo-19norpregna-1,3,5(10),20-tetraene-3,17-diol에 I-123을 표지하였고 표지된 에스트라디올 유도체를 Rat에 주사하여 체내 분포에 관해 연구하였다. 가장높은 자궁섭취율은 3.12%ID/g이었고, 자궁 대 혈액의 섭취비율은 14.2였다.

Abstracts

Among the various estrogen receptor based radiopharmaceuticals that have been developed over the past years as possible imaging agents for breast cancer, 17 α -iodovinyl derivatives of estradiol and 11 β -methoxy estradiol showed the most promising properties. The study for the imaging of breast cancer status is directly related with the measurement of the estrogen receptor concentration. Estrogen receptor measurement also give benefits to the patients who may be treated with hormonal therapy. In this study, we synthesized (17 α ,20E)-and(17 α ,20Z)-21-Iodo-19 norpregna-1,3,5(10),20-tetraene -3,17-diol and (17 α ,20E)-and(17 α ,20Z)-21-Iodo-19norpregna-1,3,5(10),20-tetraene-3,17-diol 3- (methylether), characterized their spectroscopic properties and labelled (17 α ,20E)-21-[¹²³I]Iodo-19 norpregna-1,3,5(10),20-tetraene-3,17-diol. The labelled estradiol derivative was injected to the rats in order to measure its biodistribution. The highest uterus uptake was 3.12%ID/g at 2h post-injection and uterus to blood ratio was 14.2.