

研究报告

# $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-RGD dimer和 $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-PEG4-RGD dimer的制备及生物评价

史继云 余子璘 贾兵 赵慧云 王凡

北京大学医学同位素研究中心, 中国原子能科学研究院同位素研究所 北京大学医学同位素研究中心 北京大学医学同位素研究中心 北京大学医学同位素研究中心, 中国原子能科学研究院同位素研究所

收稿日期 2006-11-6 修回日期 2007-9-24 网络版发布日期: 2007-11-21

**摘要** 制备 $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-RGD dimer和 $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-PEG4-RGD dimer, 并比较4个PEG分子的引入对标记条件以及标记化合物体外稳定性的影响, 以及对标记化合物的药代动力学性质和小鼠体内生物分布的影响。TLC和HPLC分析结果表明, 在pH 6.0和pH 4.0条件下100℃反应15-20 min, 两种标记化合物的标记率均大于95%, 并在生理盐水体系中, 二者均保持良好的稳定性。HPLC的分析结果和脂水分配系数  $\log P_{ow}$ 的测定结果显示 $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-PEG4-RGD dimer的脂溶性有所提高。引入4个PEG分子没有显著改变标记化合物的药代动力学性质和小鼠的体内生物分布。

**关键词**  [\$^{177}\text{Lu}\$](#)  [RGD二聚体](#) [PEG](#)

分类号

## Preparation and Evaluation of $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-RGD dimer and $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-PEG4-RGD dimer

### Abstract

$^{177}\text{Lu}$  DOTA Bz RGD dimer and  $^{177}\text{Lu}$  DOTA Bz PEG4 RGD dimer were prepared, and the effect of PEG4 on labeling conditions and in vitro stability as well as pharmacokinetic properties and biodistribution in normal mice for the radiolabeled compounds was compared. The results of TLC and HPLC show that the labeling yield of two radiolabeled compounds was more than 95% under optimal conditions (pH 4.0 and pH 6.0, respectively, reacting at 100 °C for 15–20 min). The two radiolabeled compounds show pretty good stability in saline. HPLC analyses and  $\log P_{ow}$  values revealed that introducing of PEG4 increased the lipophilic character of radiolabeled compounds, but had no significant changes on pharmacokinetic properties and biodistribution in normal mice.

**Key words**  [\$^{177}\text{Lu}\$](#)  [RGD dimer](#) [PEG](#)

DOI

通讯作者 王凡 [wangfan@bjmu.edu.cn](mailto:wangfan@bjmu.edu.cn)

### 扩展功能

#### 本文信息

- ▶ [Supporting info](#)
- ▶ [\[PDF全文\]\(175KB\)](#)
- ▶ [\[HTML全文\]\(0KB\)](#)
- ▶ [参考文献](#)

#### 服务与反馈

- ▶ [把本文推荐给朋友](#)
- ▶ [文章反馈](#)
- ▶ [浏览反馈信息](#)

#### 相关信息

- ▶ [本刊中 包含“ \$^{177}\text{Lu}\$ ”的 相关文章](#)
- ▶ [本文作者相关文章](#)

· [史继云 余子璘 贾兵 赵慧云 王凡](#)