

研究报告

# $^{177}\text{Lu}$ -DOTA/DTPA-Bz-Cys-RGD dimer的制备及正常鼠体内生物分布

圣锋<sup>1, 2</sup>; 贺巍巍<sup>1</sup>; 刘昭飞<sup>1</sup>; 赵慧云<sup>1</sup>; 贾兵<sup>1, 2</sup>; 王凡<sup>1, 2, \*</sup>

1. 北京大学 医学同位素研究中心, 北京 100083
2. 中国原子能科学研究院 同位素研究所, 北京 102413

收稿日期 2006-11-7 修回日期 2007-8-14 网络版发布日期: 2008-5-27

**摘要** 制备 $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer和 $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer, 并对其体内外性质进行比较。TLC和HPLC分析结果表明, 在pH=5.0和100 °C条件下反应15~20 min, 2种标记物的标记率均大于95%, 并且在室温条件下2种标记物均保持良好的体外稳定性。HPLC分析结果和脂水分配系数lg *P*测定结果证实,  $^{177}\text{Lu}$ -u-DOTA-Bz-Cys-RGD dimer的脂溶性高于 $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer。生物分布实验数据显示, 注射后4 h, 除了血液和脾,  $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer在其它组织中的摄取明显高于 $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer,  $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer的体内稳定性远好于 $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer。Bz-DOTA更适于作为双功能螯合剂用于RGD dimer的 $^{177}\text{Lu}$ 标记。

**关键词** [RGD二聚体](#);  [\$^{177}\text{Lu}\$](#) ; [DOTA](#); [DTPA](#); [生物分布](#)

分类号 [0615.4](#)

## Preparation of $^{177}\text{Lu}$ -DOTA/DTPA-Bz-Cys-RGD Dimer and Biodistribution Evaluation in Normal Mice

SHENG Feng<sup>1, 2</sup>; HE Wei-wei<sup>1</sup>; LIU Zhao-fei<sup>1</sup>; ZHAO Hui-yun<sup>1</sup>; JIA Bing<sup>1, 2</sup>; WAN G Fan<sup>1, 2, \*</sup>

1. Peking University Medical Isotopes Research Center, Beijing 100083, China;
2. Department of Isotopes, China Institute of Atomic Energy, Beijing 102413, China

**Abstract**  $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer and  $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer were prepared, and the *in vitro* and *in vivo* properties were compared. TLC and HPLC show that the labeling yields of two radiolabeled compounds are more than 95% under optimal conditions (pH=5.0, reacting at 100 °C for 15~20 min), and the two radiolabeled compounds show pretty good *in vitro* stability. HPLC analyses and lg *P* values reveal that lipophilicity of  $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer is higher than  $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer. The uptake of  $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer in other tissues is significantly higher than that of  $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer at 4 h postinjection, except for blood and spleen. The *in vivo* stability of  $^{177}\text{Lu}$ -DOTA-Bz-Cys-RGD dimer is much better than  $^{177}\text{Lu}$ -DTPA-Bz-Cys-RGD dimer. Bz-DOTA is an ideal bifunctional chelator for  $^{177}\text{Lu}$  labeling of RGD dimer.

**Key words** [RGD dimer](#);  [\$^{177}\text{Lu}\$](#) ; [DOTA](#); [DTPA](#); [biodistribution](#)

### 扩展功能

#### 本文信息

▶ [Supporting info](#)

▶ [\[PDF全文\]\(142KB\)](#)

▶ [\[HTML全文\]\(0KB\)](#)

▶ [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“\[RGD二聚体;  \\$^{177}\text{Lu}\\$\]\(#\) ” 的相关文章](#)

▶ [本文作者相关文章](#)

· [圣锋](#)

· [贺巍巍](#)

· [刘昭飞](#)

· [赵慧云](#)

· [贾兵](#)

· [王凡](#)

· [—](#)

---

通讯作者 圣 锋<sup>1, 2</sup>