

## 【研究概要】

難治性がん治療を目指した $\alpha$ 線放出核種アスタチン-211 標識薬剤の開発

(角永 悠一郎)

申請者は、 $\alpha$ 線放出核種アスタチン-211 ( $^{211}\text{At}$ ) 標識 FAPI のデザイン・合成・生物学的評価を行った。FAPI は、がん周囲に存在するがん間質に過剰発現している FAP 選択的に結合し、阻害する分子である。本課題にて合成した4つの  $^{211}\text{At}$ -FAPI 化合物は、どれも FAP  $\alpha$  選択的な細胞内在化を示した。最も FAP  $\alpha$  選択性の高かった  $^{211}\text{At}$ -FAPI を、動物に投与した。その結果、腫瘍への集積および抗腫瘍効果が認められた。 $^{211}\text{At}$ -FAPI 投与動物の異様な体重変化も認められず、副作用も少ないことが伺えた。