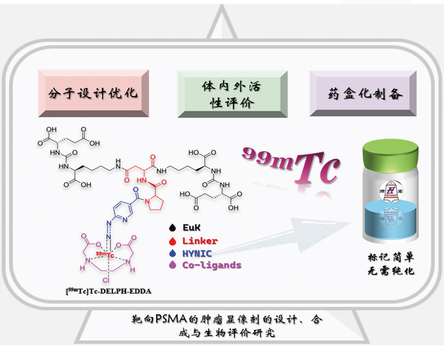
Chinese Nuclear Society CNS 中国核学会
2025 核力创新 明鉴未来
第十七届全国放射性药物与标记化合物学术交流会

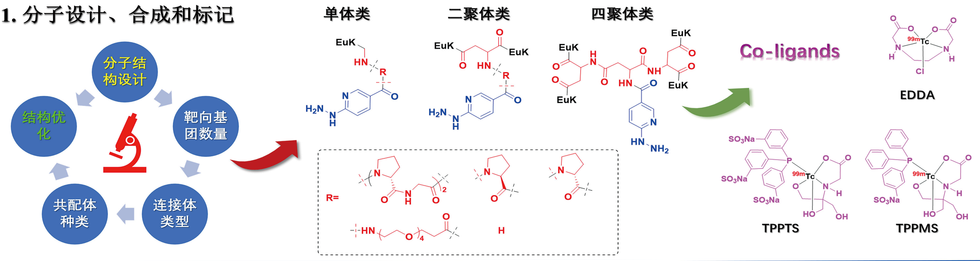
新型^{99m}Tc标记靶向PSMA的二聚体肿瘤显像剂的设计、合成与生物评价研究

李作杰， 张俊波*
北京师范大学化学学院放射性药物教育部重点实验室

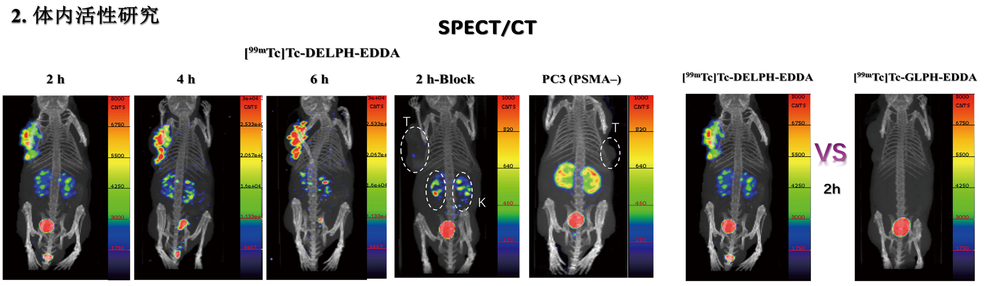
摘要：
前列腺癌（PCa）被认为是仅次于心脏病的男性第二大死亡原因，是一个重要的全球公共卫生问题。靶向前列腺特异性膜抗原（PSMA）示踪剂的开发对改善PCa的诊断和治疗具有巨大的潜力。但探针的灵敏度易受到体内前列腺特异性抗原（PSA）浓度的强烈影响，在肾脏内高摄取以及在某些非靶器官内摄取是限制探针临床进一步应用的主要原因，也是目前PSMA探针的局限性。本研究通过改变靶向基团的数量、连接体的类型以及共配体的组成等策略，设计合成制备了一系列可用于^{99m}Tc标记的靶向PSMA放射性探针，并在体内外进行了生物评价，探索了其作为新型 PCa探针的应用潜力。优选探针[^{99m}Tc]Tc-DELPH-EDDA具有非靶清除快、肾脏摄取低、肿瘤与背景比率高以及在延迟成像方面具有较大的应用潜力，药盒化的成功制备方便了其在临床中的推广应用，具有成为用于PCa诊断新型SPECT显像剂的潜力。

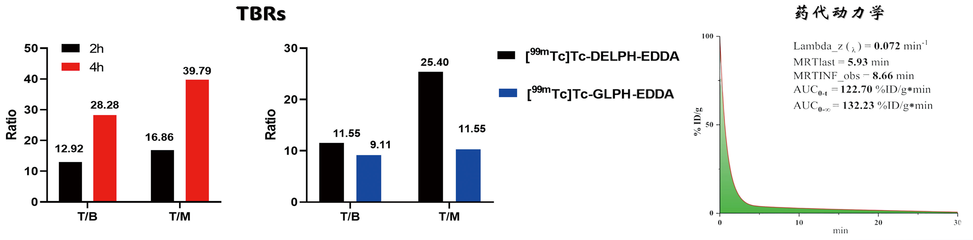


1. 分子设计、合成和标记

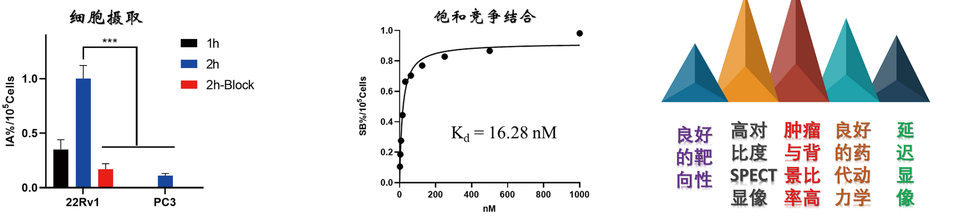


2. 体内活性研究

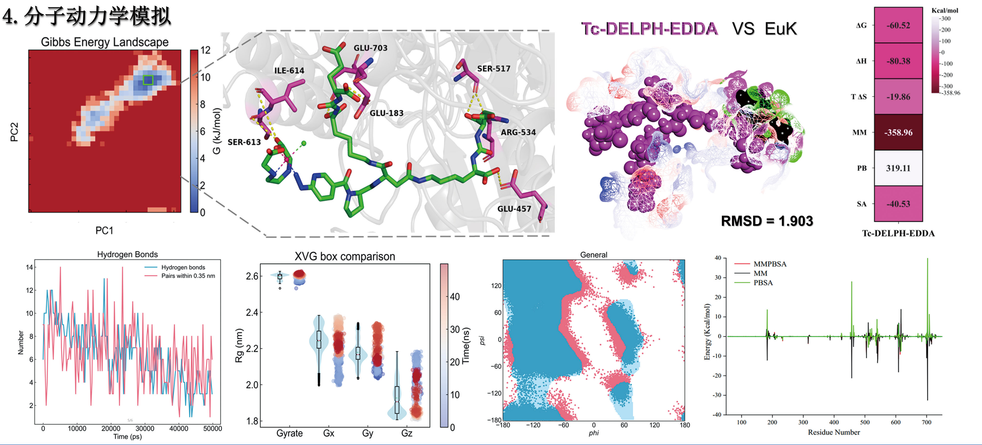




3. 体外活性研究



4. 分子动力学模拟



5.总结

[^{99m}Tc]Tc-DELPH-EDDA

- 良好的靶向性
- 肾脏摄取降低
- 肿瘤与背景比率提升
- 延迟显像
- 药盒化制备