



Федеральное медико-биологическое агентство России

III Международная научно-практическая конференция

**АКТУАЛЬНЫЕ ПРОБЛЕМЫ РАЗРАБОТКИ, ПРОИЗВОДСТВА  
И ПРИМЕНЕНИЯ РАДИОФАРМАЦЕВТИЧЕСКИХ ПРЕПАРАТОВ**

РАДИОФАРМА-2019  
18-21 июня 2019 г. Москва

ТЕЗИСЫ ДОКЛАДОВ



Москва, 2019

## ОСТЕОТРОПНЫЙ РАДИОФАРМАЦЕУТИК $^{188}\text{Re}$ НА ОСНОВЕ НОВОЙ АМИНОДИФОСФОНОВОЙ КИСЛОТЫ

Е.А. Жогин<sup>1</sup>, Г.С. Цебрикова<sup>2</sup>, А.А. Ларенков<sup>3</sup>, В.П. Соловьев<sup>2</sup>, В.В. Рагулин<sup>4</sup>,  
А.О. Малышева<sup>3</sup>, О.Е. Клементьева<sup>3</sup>, Е.А. Лямцева<sup>3</sup>, М.В. Жукова<sup>3</sup>, Г.Е. Кодина<sup>3</sup>,  
В.Е. Баулин<sup>2,4</sup>, А.Ю. Цивадзе<sup>2</sup>

<sup>1</sup>Российский технологический университет - МИРЭА, Москва

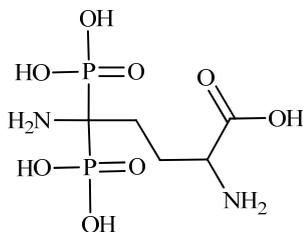
<sup>2</sup>Институт физической химии и электрохимии им. А.Н. Фрумкина РАН, Москва

<sup>3</sup>ФГБУ ГНЦ ФМБЦ им. А.И. Бурназяна ФМБА России, Москва

e-mail: [anton.larenkov@gmail.com](mailto:anton.larenkov@gmail.com)

<sup>4</sup>Институт физиологически активных веществ РАН, Черноголовка

С целью получения новых синтетически доступных органических лигандов для радиофармпрепаратов  $^{188}\text{Re}$  с повышенным накоплением в костных тканях модифицирован синтез 2,5-диамино-5,5-дифосфоновалериановой кислоты (DADP5) [1]. Аминодифосфоновая и аминокислотная группы в составе этого лиганда могут как участвовать в связывании радионуклида, так и осуществлять его транспорт к костным тканям.



DADP5

Методом потенциметрического титрования с помощью программы CHEMQUI определены константы диссоциации кислоты DADP5 и построена диаграмма распределения протонированных форм кислоты в зависимости от pH. В процессе расчетов были учтены процессы самоассоциации кислоты с образованием димерных форм. Наличие димерных структур обнаружено также и в газовой фазе методом MALDI.

Методом радио-ТХХ исследовано взаимодействие  $^{188}\text{Re}$  с DADP5. Обнаружено, что хроматографическая система ITLC-SG – ацетон демонстрирует наилучшую воспроизводимость результатов и разделение несвязанного  $^{188}\text{Re}$  и комплекса  $^{188}\text{Re}$ -DADP5, выход которого составил

не менее 95%.

Характер биологического распределения препарата  $^{188}\text{Re}$ -DADP5 оценивали на основании данных прямой радиометрии *in vivo*. Обнаружена остеотропность  $^{188}\text{Re}$ -DADP5 и повышенное накопление его в местах костных переломов – моделях онкологических патологий. Коэффициент дифференциального накопления (КДН) для полученного препарата  $^{188}\text{Re}$ -DADP5 сопоставим и даже немного превышает КДН для известных препаратов «Золерен,  $^{188}\text{Re}$ » и «Фосфорен,  $^{188}\text{Re}$ ».

[1] Цебрикова и др., ЖОХ 2018:88(9), 1431-1437.

Работа выполнена в рамках государственных заданий 2019 года ИФХЭ РАН и ИФАВ РАН и при финансовой поддержке РФФИ (гранты № 18-33-00685 и № 19-03-00262). Потенциметрические исследования выполнены за счет средств РФФ (грант № 19-13-00294).