

文章编号: 0253-9950(2002)03-0164-05

# $^{125}\text{I}$ 标记多巴胺 $\text{D}_3$ 受体 显像剂的合成

薛井泉, 朱爱芝, 柴之芳

中国科学院 高能物理研究所 核分析技术重点实验室, 北京 100039

**摘要:** 制备了 $^{125}\text{I}$ 标记的具有多巴胺  $\text{D}_3$  受体潜在活性的核药物 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT(7-羟基-2-(N-丙基-N-3- $^{125}\text{I}$ -碘-2-烯丙基)氨基四氢萘满)。从化合物2,7-二羟基萘开始,经过多步反应合成出 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT的前体,并对它进行 $^{125}\text{I}$ 标记。 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT经分离纯化后,检测结果为:放射化学产额为57%,放化纯度大于86%。

**关键词:** 多巴胺;  $\text{D}_3$  受体显像剂;  $^{125}\text{I}$  标记

**中图分类号:** O503 **文献标识码:** A

多巴胺  $\text{D}_3$  受体亚型是最引人注目的多巴胺受体亚型之一。它主要分布在哺乳动物大脑中与认知和情感功能相关的边缘脑区,特别是嗅结节、马列加氏岛和前脑基质的侧坐核隔膜,而且与抗精神病药物具有很高的亲和性,具有特殊的神经药理学意义<sup>[1]</sup>。多巴胺  $\text{D}_3$  受体亚型分子克隆成功,引起了科研工作者们对  $\text{D}_3$  受体功能研究的兴趣。国外科学家在开发大量  $\text{D}_3$  受体的激动剂和拮抗剂方面,都有不同程度的成功。其中最引人注意的是氨基四氢萘满类化合物,如 DPAT(7-羟基-2-(N,N-二丙基)氨基四氢萘满)等的合成。Kung 等<sup>[2-4]</sup>对不同放射性核素标记的多巴胺受体的配体进行了大量的研究。

7-羟基-2-(N-丙基-N-3- $^{125}\text{I}$ -碘-2-烯丙基)氨基四氢萘满(7-OH-PIPAT)具有较好的多巴胺  $\text{D}_3$  受体亲和性和选择性,若选用正电子核素进行标记,可发展为较好的多巴胺  $\text{D}_3$  受体的 PET 显像剂。但是,国内对  $\text{D}_2$  受体亚型的研究较多,对  $\text{D}_3$  受体亚型的研究还处于起步阶段,关于 7-OH-

PIPAT的制备国内尚未见报道。本文从简单的化合物开始,经多步反应合成出 $^{125}\text{I}$ 标记的多巴胺  $\text{D}_3$  受体显像剂 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT。

## 1 实验部分

### 1.1 主要仪器与试剂

恒温磁力搅拌器,江苏泰县姜埝无线电厂生产;XZ-6 旋转蒸发器,宁波市风华整流设备厂生产;MASPECII 质谱仪(ZAB-HS);AR  $\times 400$  核磁共振谱仪(BRUKER);高效液相色谱仪(WATERS);平面锗  $\gamma$ -谱仪(CANBERRA)。

2,7-二羟基萘,3-氯丙炔,三溴化硼,正三丁基烯(Fluka),碘甲烷,金属钠,正丙胺,氰硼氢化钠,均为北京化学试剂公司产品; $\text{Na } ^{125}\text{I}$ ,中国原子能科学研究院产品。

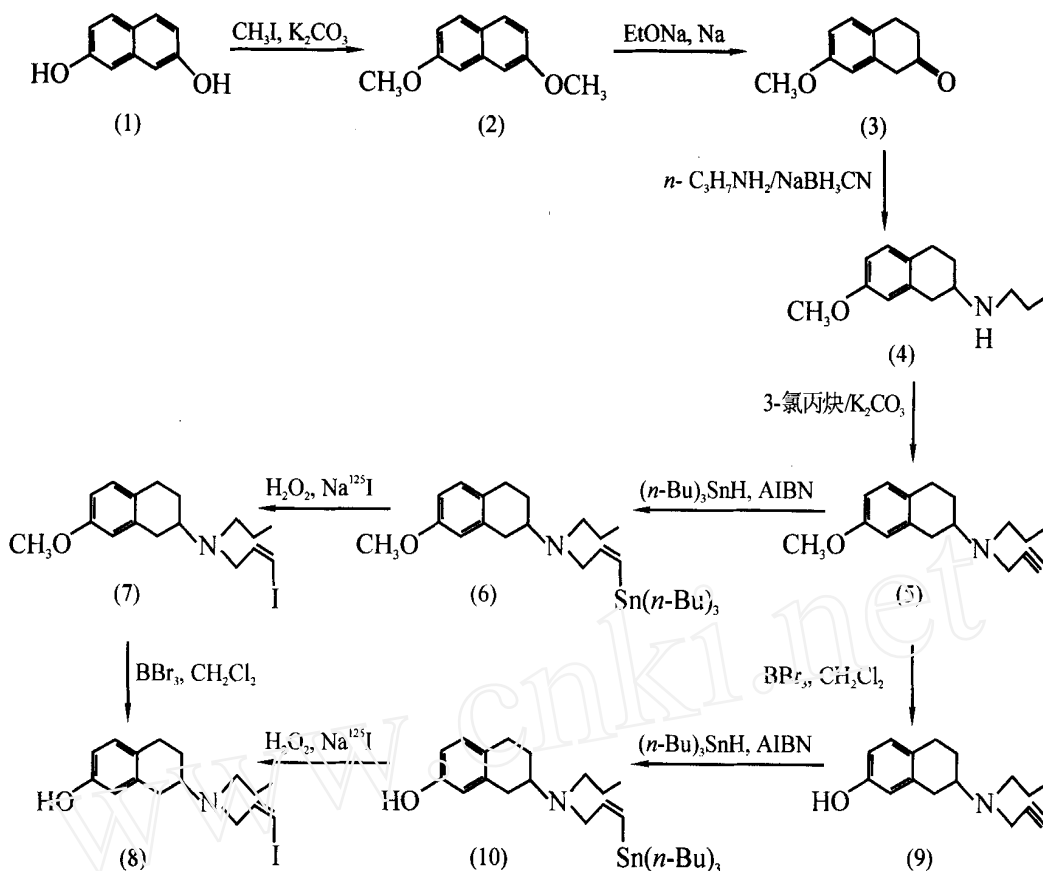
### 1.2 PIPAT的合成

从简单化合物2,7-二羟基萘开始,经7步反应得到稳定化合物 PIPAT。合成路线如下:

收稿日期:2002-03-13; 修订日期:2002-04-26

基金项目:国家重大基础研究规划项目(G1999054000);中国科学院知识创新工程项目(U-516-3)

作者简介:薛井泉(1970—),男,满族,吉林磐石人,工程师,放射化学专业。



**1.2.1 2,7-二甲氧基萘(2)的制备** 在 500 mL 圆底烧瓶中,加入 24.0 g (0.15 mol) 2,7-二羟基萘(1), 250 mL 无水乙醇和 41.4 g (0.30 mol)  $\text{K}_2\text{CO}_3$  及 30 mL (0.5 mol) 碘甲烷。混合物回流搅拌过夜,停止反应,冷却至室温。反应瓶内出现大量针状晶体。过滤,水洗,用乙醇重结晶,得白色针状晶体化合物 2,7-二甲氧基萘(2) 18 g,产率为 64%。 $^1\text{H}$ NMR (400 Hz,  $\text{CDCl}_3$ ) 分析结果为 ( ) : 7.66(d, Ar —H, 2H), 7.06(s, Ar —H, 2H), 6.98(dd, Ar —H, 2H), 3.90(s, — $\text{OCH}_3$ , 6H)。

**1.2.2 7-甲氧基四氢萘酮(3)的制备** 在 500 mL 圆底烧瓶中,加入 13.0 g (70 mmol) 化合物(2)和 200 mL 无水乙醇,混合物加热至 100 $^\circ\text{C}$ ,回流,分次快速加入金属钠丝 18 g (0.78 mol),升温至 110 $^\circ\text{C}$ ,搅拌回流至金属钠全部消失,停止反应并冷却至室温。加入 300 mL 体积比为 1:1 的去离子水和浓盐酸,在 80~90 $^\circ\text{C}$  下搅拌溶解 30 min,乙醚萃取,蒸干,得粗产物。用饱和  $\text{NaHSO}_3$  纯化,得桔红色油状化合物 7-甲氧基四氢萘酮(3) 6.3 g,产率为 52%。快原子轰击质谱(FAB-MS)分析结果为 ( $m/z$ ): 176 (M) (100%);

$^1\text{H}$ NMR (400 Hz,  $\text{CDCl}_3$ ) 分析结果为 ( ) : 7.15 (d, Ar —H, H), 6.77(dd, Ar —H, H), 6.67(d, Ar —H, H), 3.79 (s, — $\text{OCH}_3$ , 3H), 3.56 (s, — $\text{CH}_2$ —, 2H), 3.00 (t, — $\text{CH}_2\text{CH}_2$ —CO, 2H), 2.54 (t, — $\text{CH}_2\text{CH}_2$ —CO, 2H)。

**1.2.3 7-甲氧基-2-(N-丙基)氨基四氢萘满(4)的制备** 在 500 mL 圆底烧瓶中,加入 3.6 g (20 mmol) 化合物(3), 5 mL 正丙胺, 4 mL 乙酸, 50 mL 乙醇和 1.5 g 氰硼氢化钠。 $\text{N}_2$  气保护下,室温搅拌反应 48 h。滴加浓盐酸,得到化合物(4)的盐酸盐沉淀。用  $\text{NaOH}$  溶液溶解沉淀, $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  萃取,水洗,干燥,减压蒸干,得棕黑色油状化合物 7-甲氧基-2-(N-丙基)氨基四氢萘满(4) 3.5 g,产率 78%。鉴定结果如下: FAB-MS ( $m/z$ ): 161 (40%), 220 (M+1) (100%);  $^1\text{H}$ NMR (400 Hz,  $\text{CDCl}_3$ , ) : 7.00 (d, Ar —H, H), 6.70 (dd, Ar —H, H), 6.61 (d, Ar —H, H), 3.76 (s, — $\text{OCH}_3$ , 3H), 3.00~2.70 (m, — $\text{CH}_2\text{ArCH}_2$ —, — $\text{NCH}$ —, — $\text{NHCH}_2$ —, 7H), 2.08 (m, — $\text{NH—CH}_2$ — $\text{CH}_2$ —, 2H), 1.58 (m, bex, — $\text{CH}_2$ —, 2H), 0.96 (t, — $\text{CH}_3$ , 3H)。

**1.2.4 7-甲氧基-2-(N-丙基-N-炔丙基)氨基四氢**

萘满(5)的制备 在 50 mL 圆底烧瓶中,加入 1 g (4.56 mmol) 化合物(4), 4.0 mL 70% (36 mmol) 3-氯丙炔, 0.78 g  $K_2CO_3$  和 8 mL 丙酮。 $N_2$  气保护下, 0 搅拌反应过夜。蒸干丙酮, 溶于  $CH_2Cl_2$ , 水洗, 饱和 NaCl 溶液洗, 干燥, 蒸干得粗产物 2.0 g。粗产物经柱色谱纯化(硅胶,  $V$ (己烷)

$V$ (乙酸乙酯) = 3 : 1) 得化合物 7-甲氧基-2-(*N*-丙基-*N*-炔丙基) 氨基四氢萘满(5) 0.87 g, 产率 74%。鉴定结果如下: FAB-MS ( $m/z$ ): 161 (100%), 256 ( $M+1$ ) (35%);  $^1H$ NMR (400 Hz,  $CDCl_3$ , ) : 6.92 (d, Ar—H, H), 6.61 (dd, Ar—H, H), 6.55 (d, Ar—H, H), 3.69 (d, —OCH<sub>3</sub>, 3H), 3.47 (s, —NCH<sub>2</sub>—C(CH<sub>3</sub>)=CH, 2H), 2.93 ~ 2.54 (—CH<sub>2</sub>ArCH<sub>2</sub>—, —NCH<sub>2</sub>—, —NCH—, 7H), 2.11 (t, —C(CH<sub>3</sub>)=CH, H), 2.05 (m, H), 1.56 (m, 1H), 1.45 (m, hex, —CH<sub>2</sub>—, 2H), 0.85 (t, —CH<sub>3</sub>, 3H)。

1.2.5 7-甲氧基-2-(*N*-丙基-*N*-3-<sup>1</sup>三丁基锡基-2-<sup>1</sup>烯丙基) 氨基四氢萘满(6)的制备 在 50 mL 圆底烧瓶中, 加入 0.3 g (1.16 mmol) 化合物(5), 40.6 mg (0.28 mmol) 偶氮二异丁氰, 1 mL (3.7 mmol) 三丁基锡和 20 mL 干燥的四氢呋喃。 $N_2$  气保护下, 70~80 搅拌回流反应 2 h。蒸干溶剂, 得粗产物, 经柱色谱纯化(硅胶,  $V$ (己烷)  $V$ (乙酸乙酯) = 3 : 1) 得化合物 7-甲氧基-2-(*N*-丙基-*N*-3-<sup>1</sup>三丁基锡基-2-<sup>1</sup>烯丙基) 氨基四氢萘满(6) 0.37 g, 产率 57.7%。鉴定结果为: FAB-MS ( $m/z$ ): 258 (55%), 550 ( $M+1$ ) (100%);  $^1H$ NMR (400 Hz,  $CDCl_3$ , ) : 6.90 (d, Ar—H, H), 6.60 (dd, Ar—H, H), 6.54 (d, Ar—H, H), 6.05 (d, HC=CHSn, H), 5.96 (m, HC=CHSn, H), 3.79 (d, —OCH<sub>3</sub>, 3H), 3.76 (m, —NCH<sub>2</sub>—CH=CHSn, 2H), 2.80 ~ 2.48 (—CH<sub>2</sub>ArCH<sub>2</sub>—, —NCH<sub>2</sub>—, —NCH—, 7H), 1.42 ~ 0.76 (m, Bu<sub>3</sub>Sn, hex, —CH<sub>2</sub>—, 29H), 0.86 (t, —CH<sub>3</sub>, 3H)。

1.2.6 7-羟基-2-(*N*-丙基-*N*-3-<sup>1</sup>碘-2-<sup>1</sup>烯丙基) 氨基四氢萘满(8)的制备 在 50 mL 圆底烧瓶中, 加入 0.4 g (1.10 mmol) 化合物(6) 和 15 mL  $CHCl_3$ , 室温下搅拌, 缓慢滴加 I<sub>2</sub> 的  $CHCl_3$  饱和溶液, 至碘的颜色不再消失为止。搅拌过夜, 加入 4 mL 1 mol/L KF 和 4 mL 5% NaHSO<sub>3</sub>。分离出有机相, 干燥, 蒸干, 粗产物经柱色谱纯化(硅胶,  $V$ (己烷)  $V$ (乙酸乙酯) = 3 : 1) 得化合物 7-甲氧基-2-(*N*-丙基-*N*-3-<sup>1</sup>碘-2-<sup>1</sup>烯丙基) 氨基四氢萘满

(7) 80 mg, 产率 28.5%。在 50 mL 圆底烧瓶中, 加入 80 mg 化合物(7) 和 10 mL 干燥的  $CH_2Cl_2$ , 冰盐浴冷却至 -10, 滴加 0.2 mL  $BBr_3$  (0.72 mmol)。室温搅拌反应过夜。蒸干易挥发物质, 溶于 5 mL 水, 用 10% NaOH 调 pH = 9.0, 然后用 1 mol/L HCl 调 pH = 8.0,  $CH_2Cl_2$  萃取混合物, 水洗, 干燥, 蒸干。粗产物经柱色谱纯化(硅胶,  $V$ (己烷)  $V$ (乙酸乙酯)  $V$ (NH<sub>3</sub>·H<sub>2</sub>O) = 80 : 20 : 1) 得化合物 7-羟基-2-(*N*-丙基-*N*-3-<sup>1</sup>碘-2-<sup>1</sup>烯丙基) 氨基四氢萘满(8) 50 mg, 产率 65%。鉴定结果如下: FAB-MS ( $m/z$ ): 244 (100%), 372 ( $M+1$ ) (100%);  $^1H$ NMR (400 Hz,  $CDCl_3$ , ) : 6.94 (d, Ar—H, H), 6.60 (m, —CH=CHSn, H), 6.59 (dd, Ar—H, H), 6.55 (d, Ar—H, H), 6.34 (d, —CH=CHSn, H), 4.75 (—OH, H), 3.47 (—CH<sub>2</sub>—C(CH<sub>3</sub>)=C, 2H), 3.00 (CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>—CH<sub>2</sub>N—, 2H), 2.85 ~ 2.74 (m, —CH<sub>2</sub>ArCH<sub>2</sub>—, —NCH—, 5H), 2.58 (—N—CH<sub>2</sub>—, 2H), 2.03 ~ 2.11 和 1.50 ~ 1.55 (m, —CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, 2H), 1.43 ~ 1.50 (m, hex, —CH<sub>2</sub>—, 2H), 0.85 (t, —CH<sub>3</sub>, 3H)。

1.2.7 7-羟基-2-(*N*-丙基-*N*-炔丙基) 氨基四氢萘满(9)的制备 在 50 mL 圆底烧瓶中, 加入 0.6 g (2.3 mmol) 化合物(5) 和 50 mL 干燥的  $CH_2Cl_2$ , 冰盐浴冷却至 -10, 滴加 2 mL  $BBr_3$  (7.2 mmol), 室温搅拌反应过夜。蒸干易挥发物质, 溶于 10 mL 水, 用 10% NaOH 调 pH = 9.0, 然后用 1 mol/L HCl 调 pH = 8.0,  $CH_2Cl_2$  萃取混合物, 水洗, 干燥, 蒸干得粗产物 0.65 g。粗产物经柱色谱纯化(硅胶,  $V$ (己烷)  $V$ (乙酸乙酯) = 1 : 1) 得化合物 7-羟基-2-(*N*-丙基-*N*-炔丙基) 氨基四氢萘满(9) 0.52 g, 产率 92%。鉴定结果如下: FAB-MS ( $m/z$ ): 244 ( $M+1$ ) (100%);  $^1H$ NMR (400 Hz,  $CDCl_3$ , ) : 6.92 (d, Ar—H, H), 6.61 (dd, Ar—H, H), 6.55 (d, Ar—H, H), 4.74 (—OH, H), 3.47 (s, —NCH<sub>2</sub>—C(CH<sub>3</sub>)=CH, 2H), 2.93 ~ 2.54 (—CH<sub>2</sub>ArCH<sub>2</sub>—, —NCH<sub>2</sub>—, —NCH—, 7H), 2.11 (t, —C(CH<sub>3</sub>)=CH, H), 2.05 (m, H), 1.56 (m, 1H), 1.45 (m, hex, —CH<sub>2</sub>—, 2H), 0.85 (t, —CH<sub>3</sub>, 3H)。

1.2.8 7-羟基-2-(*N*-丙基-*N*-3-<sup>1</sup>三丁基锡基-2-<sup>1</sup>烯丙基) 氨基四氢萘满(10)的制备 在 50 mL 圆底烧瓶中, 加入 0.3 g (1.2 mmol) 化合物(9), 40.6 mg (0.28 mmol) 偶氮二异丁氰, 1 mL (3.7 mmol) 三丁基锡和 20.0 mL 干燥的四氢呋喃。

N<sub>2</sub>气保护下,70~80℃搅拌回流反应2 h。蒸干溶剂,得粗产物0.65 g。粗产物经柱色谱纯化(硅胶, V(己烷) : V(乙酸乙酯) = 1 : 1)得化合物7-羟基-2-(N-丙基-N-3-<sup>125</sup>碘-2-烯丙基)氨基四氢萘满(10)0.33 g,产率50%。鉴定结果如下: FAB-MS (m/z): 244 (90%), 535 (M + 1) (100%); <sup>1</sup>HNMR (400 Hz, CDCl<sub>3</sub>, δ): 6.90 (d, Ar-H, H), 6.60 (dd, Ar-H, H), 6.54 (d, Ar-H, H), 6.05 (d, C=C-HSn, H), 5.96 (m, HC=C-HSn, H), 4.74 (s, -OH, H), 3.76 (m, -NCH<sub>2</sub>-C=C-HSn, 2H), 2.80~2.48 (s, -CH<sub>2</sub>-Ar-CH<sub>2</sub>-, -NCH<sub>2</sub>-, -NCH-, 7H), 1.42~0.76 (m, Bu<sub>3</sub>Sn, hex, -CH<sub>2</sub>-, 29H), 0.86 (t, -CH<sub>3</sub>, 3H)。

**1.2.9 7-羟基-2-(N-丙基-N-3-<sup>125</sup>碘-2-烯丙基)氨基四氢萘满(8)的制备** 在50 mL圆底烧瓶中,加入化合物(10)0.33 g和15 mL CHCl<sub>3</sub>,室温下搅拌,缓慢滴加I<sub>2</sub>的CHCl<sub>3</sub>饱和溶液,至碘的颜色不再消失为止。搅拌反应过夜,加入4 mL 1 mol/L KF和4 mL 5% NaHSO<sub>3</sub>。分离有机相,干燥,蒸干,粗产物经柱色谱纯化(硅胶, V(己烷) : V(乙酸乙酯) : V(NH<sub>3</sub>·H<sub>2</sub>O) = 50 : 50 : 1),得化合物7-羟基-2-(N-丙基-N-3-<sup>125</sup>碘-2-烯丙基)氨基四氢萘满(8)30 mg,产率13%。鉴定结果同1.2.6。

### 1.3 <sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT的放射性标记

<sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT的碘标记通过碘代锡反应完成。在含50 μL (1 mg/mL)三丁基锡前体化合物(10)的乙醇溶液、50 μL 1 mol/L HCl和111 MBq的Na<sup>125</sup>I混合溶液中,加入50 μL 3% H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>,室温反应

15 min。加入100 μL (300 mg/mL) NaHSO<sub>3</sub>溶液终止反应,加入100 μL饱和NaHCO<sub>3</sub>溶液中和,反应混合物用乙酸乙酯萃取3次,每次1 mL。在水浴中用N<sub>2</sub>气吹干,残余物溶于少量甲醇。用HPLC分离,紫外检测器(λ = 254 nm), Waters C18柱(3.9 mm × 300 mm)分离,流动相为 V(甲醇) : V(水) = 4 : 1。收集含<sup>125</sup>I-OH-PIPAT的组份,水浴中用N<sub>2</sub>气吹干,残余物溶于生理盐水。用体积比为3 : 1的己烷-乙酸乙酯混合物为展开剂,硅胶板展开,平面锗-谱仪测量产物活度,计算放化产率及放射化学纯度。

## 2 结果和讨论

### 2.1 PIPAT及其中间体的合成、纯化及检测

所有的中间体和最终产物都采用FAB-MS法和<sup>1</sup>HNMR法进行结构鉴定,证明是本文所需产物并且有很好的纯度。从产物的产率和标记的安全性两方面考虑,采用两种合成路线,第一种合成路线是先进行碘标记,再脱甲氧基;第二种合成路线是先脱掉甲氧基,再进行碘标记。两种方法相比较,第一种方法的产率较高,用于稳定化合物合成;第二种方法产率比第一种方法低,但用于<sup>125</sup>I标记时,缩短了标记流程,并且能满足后续实验要求。

### 2.2 <sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT的分离及放化纯度检测

化合物PIPAT标准色谱图示于图1。从图1可见,PIPAT的保留时间 $t_R$ 为4.36 min。<sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT分离谱示于图2。图2中4.37 min处峰为<sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT,收集4.2~4.5 min组

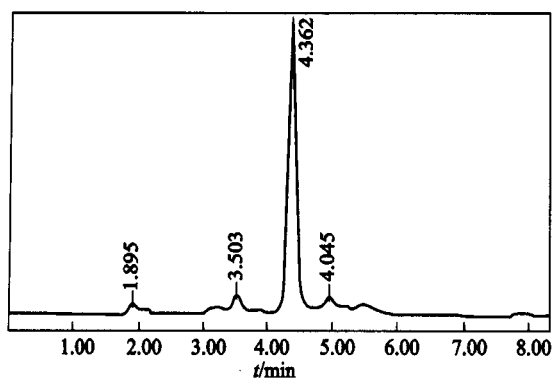


图1 PIPAT的标准色谱图

Fig. 1 The standard chromatogram of PIPAT

色谱条件(Chromatographic conditions):

Waters C18柱(3.9 mm × 300 mm),

流动相(Mobile phase): V(CH<sub>3</sub>OH) : V(H<sub>2</sub>O) = 4 : 1

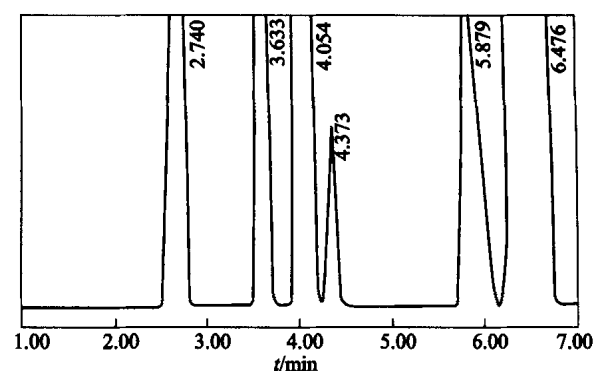


图2 <sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT分离谱图

Fig. 2 The separation chromatogram of

<sup>125</sup>I-7-OH-PIPAT

色谱条件同图1(Chromatographic conditions

are same as in Fig. 1)

份,测得 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT 的活度为 62.9 MBq,放化产额为 57%。用  $V$ (己烷) $:V$ (乙酸乙酯) = 3:1 混合物为展开剂,硅胶板展开, $\text{I}^-$  的  $R_f$  为 0, PIPAT 的  $R_f$  为 0.2~0.3。3 组实验测得 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT 放化纯度分别为 93%,90%和 86%。于一周和两周后检测 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT 的放化纯度,未见明显变化。HPLC 分离放化纯度可达 99%,但是本实验受仪器条件所限,只有通用的紫外检测器,而没有放射性检测器, $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT 只有纳克水平,检测灵敏度不够,使组份的收集困难,放化产率和纯度都偏低。

### 3 结 论

本文从简单化合物 2,7-二羟基萘开始,经多步反应合成出了 $^{125}\text{I}$  标记的具有多巴胺  $\text{D}_3$  受体潜在活性的核药物 $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT。虽然合成步骤较多,但起始原料价廉易得,所得产物能满足进一步实验的要求。

### 参考文献:

- [1] BOUTHENET M L, SOUIL E, MARTRES M P, et al. Localization of Dopamine  $\text{D}_3$  Receptor mRNA in the Rat Brain Using in Situ Hybridization Histochemistry: Comparison With Dopamine  $\text{D}_2$  Receptor mRNA [J]. Brain Res, 1991, 564:203~219.
- [2] CHUMPRADIT S, KUNG M P, VESSOTSKIE J M, et al. Synthesis, Resolution and Radioiodination of  $S(-)$  trans-5-hydroxy-2-[ $N$ - $n$ -propyl- $N'$ -(3- $^{125}\text{I}$ -iodo-2- $^{125}\text{I}$ -propenyl) amino] tetralin ( $S(-)$  trans-5-OH-PIPAT): a New  $\text{D}_2$ -Like Dopamine Receptor Ligand [J]. J Labeled Compd Radiopharm, 1995, 36:1 051~1 062.
- [3] VESSOTSKIE J M, KUNG M P, CHUMPRADIT S, et al. Characterization of [ $^{125}\text{I}$ ]  $S(-)$  5-OH-PIPAT Binding to Dopamine  $\text{D}_2$ -Like Receptors Expressed in Cell Lines [J]. Neuropharmacology, 1997, 36:999~1 007.
- [4] FOULON C, KUNG M P, KUNG H F. Synthesis of ( $R, S$ )-2- $^{125}\text{I}$  trans-7-hydroxy-2-[ $N'$ -(3- $^{125}\text{I}$ -iodo-2- $^{125}\text{I}$ -propenyl)- $N$ - $n$ -propyl] Aminotetralin (trans-7-OH-PIPAT) [J]. J Med Chem, 1993, 36:1 499~1 500.

## SYNTHESIS OF $^{125}\text{I}$ LABELLED DOPAMINE $\text{D}_3$ RECEPTOR IMAGING AGENT

XUE Jing-quan, ZHU Ai-zhi, CHAI Zhi-fang

Laboratory of Nuclear Analytical Techniques, Institute of High Energy Physics,  
the Chinese Academy of Sciences, Beijing 100039, China

**Abstract:**  $^{125}\text{I}$  labeled radiopharmaceutical  $^{125}\text{I}$ -PIPAT having selective and affinitive to dopamine  $\text{D}_3$  receptor is synthesized. Preparation of  $^{125}\text{I}$ -7-OH-PIPAT is from multi-step reactions. The radiochemical yield is 57%. The radiochemical purity is higher than 86%.

**Key words:** dopamine;  $\text{D}_3$  receptor imaging agent;  $^{125}\text{I}$