



In Vivo Studies ^{99m}Tc -Levofloxacin Freeze Dried Kits in *Salmonella typhi*, *Pseudomonas aeruginosa*, and *Escherichia coli*

Shabnam SHAHZAD ¹, Muhammad A. QADIR ¹, Rashid RASHEED ²,
Shahzad ANWAR ³ & Mahmood AHMED ¹

¹ Institute of Chemistry, University of the Punjab, Lahore, Pakistan

² Gujranwala Institute of Nuclear Medicine and Radiotherapy, Gujranwala, Pakistan

³ Solution Environmental and Analytical Laboratory, Lahore, Pakistan

SUMMARY. Radio-pharmaceuticals are used as a leading device for the detection of infections or inflammations in human beings. Levofloxacin, a 3rd generation fluoroquinolone derivative, labeled with ^{99m}Tc ; developed freeze dried kits and utilized as potential infection imaging agents. Kits are produced with higher labeling efficiency and great stability than levofloxacin kits previously produced which have high colloidal content and need HCl as well as heating for their development. Whilst we have employed a simple method in which kits are developed at room temperature without HCl and heating with low colloidal content. After optimization of reaction conditions, maximum labeling efficiency was obtained when 1.0 mg levofloxacin, 100 μg SnCl_2 and 300 μg D-penicillamine were labeled with 10 mCi sodium pertechnetate. Preclinical assessments of radiolabeled antibiotic were performed including purity, stability, and pharmacokinetic investigations in animals. Kits were highly stable at room temperature and in serum at 37 °C for 6 h. *In vivo* studies showed excellent uptake of activity at infection site by *Pseudomonas aeruginosa*, *Salmonella typhi*, and *Escherichia coli*. The target to non-target ratios indicated that this kit of levofloxacin may be used for infection diagnosis.

RESUMEN. Los radiofármacos se utilizan como dispositivo principal para la detección de infecciones o inflamaciones en seres humanos. La levofloxacina, un derivado de la fluoroquinolona de tercera generación, fue marcado con ^{99m}Tc y sus kits liofilizados se desarrollaron como un potencial agente para obtener imágenes de infección causadas por bacterias susceptibles. Los kits se producen con mayor eficiencia y estabilidad que los kits de levofloxacina producidos previamente que tienen alto contenido coloidal y necesitan HCl, así como calefacción para su desarrollo. En este trabajo hemos empleado un método simple en el que se desarrollan kits a temperatura ambiente, sin HCl ni calefacción y con bajo contenido coloidal. En estas condiciones se obtuvo la máxima eficiencia cuando 1,0 mg de levofloxacina, 100 μg de SnCl_2 y 300 μg de D-penicilamina se marcaron con 10 mCi de pertechnetato de sodio. Se realizaron evaluaciones preclínicas del antibiótico radiomarcado incluyendo pureza, estabilidad e investigaciones farmacocinéticas en animales. Los kits fueron altamente estables a temperatura ambiente y en suero a 37 °C durante 6 h. Estudios *in vivo* mostraron una excelente absorción de la actividad en el sitio de infección por *Pseudomonas aeruginosa*, *Salmonella typhi* y *Escherichia coli*. Las relaciones de no-diana indican que este kit de levofloxacina puede ser utilizado para el diagnóstico de infecciones bacterianas.

KEY WORDS: lipophilicity, packgen, radioligand, scintigraphy, ^{99m}Tc .

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: shabnamshahzadkhan@gmail.com