

120. 悪性腫瘍親和性 RI 化合物

—RI 標識 Bleomycin について—

九州大学薬学科

河野 彬 小嶋 正治

福岡国立中央病院 前田 辰夫

Bleomycin は扁平上皮ガン 治療薬として知られている, グリコペプチドであり, その薬効発現は有効腫瘍組織への高い親和性に起因すると言われている. また化学的には金属とキレート化学的に強く結合し生体内でその結合ははずれにくいとされている.

そこで著者らはこれを金属ラジオアイソトープ (RI) で標識し担腫瘍マウス, ラットを用いて放射能の体内分布を特に腫瘍親和性の観点から検討した.

標識を試みた RI は ^{59}Fe , ^{65}Zn , ^{64}Cu , ^{57}Co , ^{67}Ga 等でそのうち ^{65}Zn ^{64}Cu , ^{57}Co は Bleomycin と容易に結合した. この反応は中性, 弱酸性領域水溶液中で起り, 薄層クロマトグラフィーで確認し, 結合定数をイオン交換樹脂法で測定した.

標識にキャリアフリーの RI を用いた場合放射能のほとんどすべては Bleomycin 部分に存在するが, 微量の遊離 RI を除くためセファデックス G-10 を用いて精製した. 動物実験はエールリッヒ固型腫瘍マウス等を用いて経時的にその分布状態を臓器別分布, 全身マクロオートラジオグラフィーで調べた. その結果 Bleomycin- ^{57}Co についてかなり腫瘍親和性がみられた. これらの結果について報告する.