

-73- ^{99m}Tc 標識化合物の腫瘍親和性に関する総合的検討

金大 核

○伊藤和夫, 小林 真, 久田欣一,
利波紀久

金大 医短大
安東 醇

我々の教室ではこれまでに数多くの RI 化合物の腫瘍親和性に関する基礎的並びに臨床的成績について報告して来た。更に、現在の核医学診断領域における ^{99m}Tc 標識化合物の意義について鑑みる時、 ^{99m}Tc 標識化合物による腫瘍スキヤンの可能性とその方向性を見出す事が必要と考へ、基礎的検討を加えたので報告する。

目的：各種 ^{99m}Tc 標識化合物のエネルギー担癌マウスの体内分布からみた腫瘍親和性に関する基礎的検討 (^{99m}Tc 標識化合物)：今回検討した ^{99m}Tc 標識化合物は、 ^{99m}Tc -pertechnetate ($^{99m}\text{TcO}_4$)、 ^{99m}Tc -Human Serum Albumin (^{99m}Tc -HSA)、 ^{99m}Tc -Diphosphonate (^{99m}Tc -EHDP)、 ^{99m}Tc -Dimercaptosuccinate (^{99m}Tc -DMSA)、 ^{99m}Tc -Trasylol (^{99m}Tc -TSL)、 ^{99m}Tc -Diethyl Stilbestrol Diphosphate (^{99m}Tc -DSDP)、 ^{99m}Tc -L-Asparaginase (^{99m}Tc -LASP)、 ^{99m}Tc -Bleomycin (^{99m}Tc -BLM)、 ^{99m}Tc -ConcanavallineA (^{99m}Tc -ConA)、 ^{99m}Tc -Urokinase (^{99m}Tc -UK) 及び ^{67}Ga -Mannitol の 11 種類と ^{67}Ga -citrate である。

動物実験：ddy 系マウス大腿部皮下にエネルギー担癌腹水腫を移植し、直径 1 cm 程度の結節を形成した時に実験に用いた。注射液は静注した後、1 時間、3 時間、5 時間及び 24 時間の 3~4 点につき各々 4~5 匹のマウスの平均値 (% dose/gm. of tissue wt.) ± 標準偏差を求めた。更に、担癌マウスの経時的イメージについて検討した。

結果：絶対的腫瘍組織集積率、腫瘍/血液比、腫瘍/筋肉比の値の順は次のような結果であつた。腫瘍組織集積率： ^{99m}Tc -HSA > ^{99m}Tc -DSDP > ^{99m}Tc -TSL > ^{99m}Tc - O_4 > ^{99m}Tc -Mannitol > ^{99m}Tc -LASP > ^{99m}Tc -ConA > ^{99m}Tc -UK > ^{99m}Tc -DMSA > ^{99m}Tc -BLM > ^{99m}Tc -EHDP。腫瘍/血液比： ^{99m}Tc -BLM > ^{99m}Tc -Mannitol > ^{99m}Tc -EHDP > ^{99m}Tc -ConA > ^{99m}Tc -TSL > ^{99m}Tc -DMSA > ^{99m}Tc -DSDP > ^{99m}Tc -UK > ^{99m}Tc -LASP > ^{99m}Tc - O_4 > ^{99m}Tc -HSA。腫瘍/筋肉比： ^{99m}Tc -Mannitol > ^{99m}Tc -DMSA > ^{99m}Tc -HSA > ^{99m}Tc -ConA > ^{99m}Tc -LASP > ^{99m}Tc -UK > ^{99m}Tc -TSL > ^{99m}Tc -DSDP > ^{99m}Tc -BLM > ^{99m}Tc - O_4 > ^{99m}Tc -EHDP。尚 ^{67}Ga -citrate の 24 時間値と各 ^{99m}Tc 標識化合物の 1 時間値及び 3 時間、さらに担癌マウスのイメージについてはスライドで示したい。

結論：腫瘍組織の組織線溶能に関連した ^{99m}Tc 標識物質は血中クリアランスも比較的遅い為適当でない。 ^{99m}Tc の物理的半減期を考慮に入れた場合、labeled compounds としては、血中クリアランスの早い物質が望ましい。

-74- F-18 による標識合成法の最近の進歩について

放医研

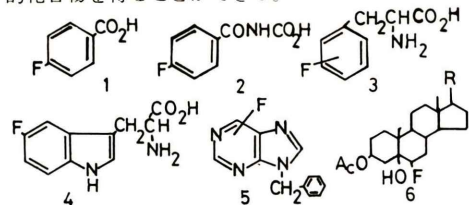
○入江俊章, 福士 清, 館野之男, 櫻田義彦
理 研
野崎 正

サイクロトロン生産短寿命核種の核医学的応用の開発には、それらの核種による標識合成法の確立が重要である。我々は、種々の化合物の標識合成を臨床的応用を最終目的として、(1) 比放射能、(2) 化学反応、(3) 操作時間、安全性、簡便化 等の面から検討を行った。

〔核反応〕 a : $^{20}\text{Ne}(\text{d}, \alpha)^{18}\text{F}$, b : $^{20}\text{Ne}(\text{p}, \alpha\text{n})^{18}\text{F}$, c : $^{16}\text{O}(\alpha, \text{pn})^{18}\text{F}$ の反応から、carrier-free で、a, b 法は非水、c 法は水溶液として ^{18}F を得ることができる。収率、合成面から、a の核反応による方法が最適であると考えられる。

〔交換溶出試薬〕 ^{18}F の導入には、ハロゲン交換、同位体交換が用いられる。a, b 法については、 AgF 、ジアゾニウム塩、 BF_3 -ether complex を target 管内で、有機溶媒中、半自動的に交換溶出した。c 法による ^{18}F も石英砂により、高収率で非水、carrier-free で trap でき、これを有機合成に利用できることが判明した。

〔合成操作〕 Ag^{18}F はヨード化した化合物とのハロゲン交換、ジアゾニウム塩 - ^{18}F は Shiemann 分解により、目的部位へ ^{18}F を導入し、合成操作により ^{18}F - 標識目的化合物を得ることができる。



1~4 はジアゾニウム塩から、5 はハロゲン交換、6 は BF_3 -ether complex との反応によって臨床応用可能な高比放射能 (~数百 $\mu\text{Ci}/\text{mg}$) で得ることができた。さらに 3, 4 は反応溶液から、短時間で酸、塩を分離精製し遊離アミノ酸注射用蒸留水溶液として得ることが可能になり、また 4 については、酵素法により、光学分割合成し、L 型を得ることに成功した。1, 2 は腎、3, 4 は脾、5 は腫瘍、6 は副腎スキヤニング剤としての目的で合成を検討したものである。他の短寿命標識法としては $^{123}\text{Xe} \rightarrow ^{123}\text{I}$, $^{77}\text{Kr} \rightarrow ^{77}\text{Br}$ による cholesterol の excitation labeling について検討を行った。応用面については、別に報告する。