

464 Tc-99m HMDP：新しい骨シンチ製剤の開発 林 美規, 高橋啓悦, 葉杖正昭 (日本メジフィジックス 技術部)

骨シンチ製剤として最も重要な要素は、骨への集積性が高く、血中及び軟組織からのクリアランスが早い事であると考えられる。さらに、腫瘍などの病変部位に特異的であれば理想的であると思われる。これらは使用するキレート剤の性質に大きく依存する事はいまでもなく、現在もなお、多大の努力が払われ開発が行われている。製剤化にあたっては、開発されたキレート剤をどのような組成で使用するかが重要であり、適当な組成にする事により、はじめてその化合物の特徴をひき出す事が可能となる。HMDPは骨への親和性が高く、反面カルシウム塩になると溶解度が低下し、網内系に取り込まれる傾向があり、リン酸量を低くせねばならない。また還元剤のスズ量は、一般的にはできるだけ押さえる事が望ましいが、低くしすぎると、放射線分解による標識率の低下をひきおこすため、安定化剤等の導入を考えねばならない。このような性質をふまえ、組成が決定されるが、さらにリン酸化合物の場合、最終pHにより、標識体の代謝が変化する事がわかった。これは、最終的にできる錯体の化学形による可能性も考えられ、さらに研究する必要がある。

465 塩化インジウム (^{111}In)；骨髄スキャニング剤の開発 高橋啓悦, 林美規, 葉杖正昭 (日本メジフィジックス, 技術部)

In-111 は、軌道電子捕獲により崩壊し、0.17、及び0.24MeVの γ 線を放出し、しかも半減期67.44時間と放射性医薬品への利用に際して、優れた物理的性質を有する核種である。1973年、Lilienらは、 $^{111}\text{InCl}_3$ の骨髄への集積性について検討を行い、 $^{111}\text{InCl}_3$ の骨髄スキャニング剤としての有用性を示唆した。また、その後の多くの研究により、骨髄への取り込みが、網内系を反映するコロイドとは異なり、Feに類似した挙動で活性骨髄に取り込まれるため、造血能を評価し得ることが報告されている。

我々は、その毒性、動物体内分布等について検討を加えて有用性を確認する一方、安定供給体制を整え現在治験を実施中である。

本製剤の毒性は極めて低く、しかも他の臓器に比較し骨髄に多く取り込まれることが、ラット体内分布実験及びマウスのオートラジオグラフィーから判明した。また、化学形の異なるインジウムについて検討した結果、 $^{111}\text{In}(\text{OH})_3$ も骨髄に取り込まれるものの、 $^{111}\text{InCl}_3$ とは明らかに異なる体内分布を示すことが判明した。

466 ヨード123標識OIHの開発 真田高和, 松嶋裕明, 葉杖正昭 (日本メジフィジックス 技術部)

現在、腎機能検査用製剤として、 ^{131}I ーヒップラン [^{131}I ーOIH] が使用されているが、今回、我々はイメージの質的向上、患者への被曝軽減が期待される ^{123}I ーOIHを開発した。

半減期(13時間)の短い I-123 標識方法としては、短時間でかつ標識効率の高い方法が要求される。そのため、我々は、溶融法による同位体交換反応を用いる標識方法を研究し、種々の検討の結果、ある特定の条件下で再現性がよくしかも標識効率の高い安定した ^{123}I ーOIHの製造方法を確立した。さらに動物における代謝実験、品質試験法などの検討を終了して、現在、臨床治験中である。

ウサギにおける経時的イメージング実験において、良好な腎動態イメージが得られ、本剤は、腎動態機能診断剤として有用であることが認められた。今後、腎動態イメージのみでなく、局所レノグラム、機能イメージング等により、従来供給されて来た製剤に比して、より豊かつ精度の高い情報が得られることが期待される。

467 アマレックスTSHの基礎的検討 滝本徹男, 伊東正三 (科研化学株式会社、放射性医薬品部)

特異性の高い抗体と、固相化した第二抗体の導入により、迅速かつ正確に血中TSH量を測定しうるアマレックスTSHを開発したので報告する。

本キットは ^{125}I ーTSH液、抗TSH抗体液、アマレックス第二抗体懸濁液(微小プラスチック粒子に固相化した第二抗体を懸濁させた液)及び標準TSHヒト血清(7水準、 $0 \sim 100 \mu\text{U}/\text{mL}$)から成り、それぞれ色分けされている。検体量は $200 \mu\text{L}$ 、反応時間は 37°C で3時間(あるいは16時間、 ^{125}I ーTSHは遅延添加)、 B/F 分離はアマレックス第二抗体懸濁液を添加し、10分間反応させた後、速心分離して行う。

本キットの測定感度は3時間アッセイ法で $1.0 \mu\text{U}/\text{mL}$ (16時間アッセイ法で $0.7 \mu\text{U}/\text{mL}$)、精度はアッセイ内9%以下、アッセイ間10%以下、euthyroidとhypothyroidの境界域での測定精度が優れていた。検体をゼロ標準血清で希釈したときの測定値は理論値とよく一致し、また添加回収率は93~108%と良好であつた。抗TSH抗体のFSH, LH, HCG, TRHに対する交叉性は、それぞれ0.15%, 0.23%, <0.05%, <0.02%と極めて小さかつた。