

526 ヨード123標識IMPの開発

伊藤 修, 佐久間 陽, 上田信夫, 葉杖正昭
(日本メジフィジックス, 技術部)

脳イメージング用の放射性医薬品の開発は核医学分野で広く待望されてきたが, これまで一般的に使用されてきた^{99m}Tc-pertechnetate, ^{99m}Tc-DTPA, ^{99m}Tc-glucoheptonate では血液脳関門が破壊されない限り脳へは集積せず満足するものではなかった。

1980年にWinchellらは, 血液脳関門が正常である場合にも脳イメージングが可能である, I-123 塩酸N-イソプロピル-p-ヨードフェニルアンフェタミン (IMP) の開発に成功し, 製剤化がすすめられてきた。

¹²³I-IMPの標識はI-123と塩酸N-イソプロピル-p-ヨードアンフェタミンとの同位体交換反応により行う。

ラットにおける動物実験では静注後, この製剤は速かに脳に集積し, その後180分まで脳内に一定にとどまり脳イメージを得ることができる。また, マウス, ラットにおけるI-123塩酸N-イソプロピル-p-ヨードアンフェタミンの急性毒性試験においても本剤が十分な安全性を有することが確認された。

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。

527 Tc-99mジェネレータの開発

松嶋裕明, 真田高和, 真狩好亨, 田中芳正, 葉杖正昭 (日本メジフィジックス, 技術部)
山田英夫, 小寺和男, 飯沼光壽 (日本メジフィジックス, 学術部)

Tc-99mジェネレータの最大の特長は, 生理食塩液により随時かつ容易に^{99m}TcO₄⁻を溶出できるという点にある。その製造において重要なことは, 常に理論的な放射能が得られ, 化学的, 放射化学的および核的純度の高い^{99m}TcO₄⁻が溶出しうようアルミナカラムを含む溶出系の製造技術を確認することにある。

今回, 我々はこの溶出系について, 海外からの導入技術をベースに独自の検討を加えると共に機構面, デザイン面にも新しい考察を加えて, 以下に列記するような特長を有するジェネレータを開発したので紹介する。

1. 自動一貫製造システムを確立し, 全数の溶出検査を可能にした。
2. 溶出効率が安定しており, 高品質の^{99m}TcO₄⁻が常に得られる。
3. ドライタイプで, シンプルな構造であるためコンパクトである。
4. セカンダリーシールドに入れることにより, 十分なしゃへいが出る。

528 リポソームの放射性診断薬への応用に関する基礎的検討

荻原 泉, 小島周二 (帝京大薬 放射), 久保寺昭子 (東理大薬 放射)

近年, リポソームは薬剤キャリアーとして広く注目され, ターゲティング療法への応用も期待されている。我々はリポソームに放射性核種を封入し, 放射性診断薬として応用すべく, 各種病態モデルを用いて基礎的検討を試みた。

multilamellar vesicle (MLV), small unilamellar vesicle (SUV) は常法により作製し, loading 法で⁶⁷Gaを封入した。病態モデルとして, 四塩化炭素投与による肝傷害, イソプロテレノール投与による心傷害, およびエールリッヒ固型癌, 吉田肉腫を用いた。

リポソームは, *in vivo* で主に肝・脾などの網内系に捕捉され, 他組織への分布は一般に低いことが知られている。四塩化炭素により肝傷害を起こした場合, 肝へのMLVの取込みは対照群と比べ低下する傾向が認められた。一方, イソプロテレノール投与群では, 心臓へのMLVの取込みは逆に顕著な上昇を示した。また, 担癌動物においては, SUVを用いることにより高い腫瘍集積性を得ることができた。

リポソームは, 粒径や表面電荷等の性状の違いにより *in vivo* での動態を異にするため, これらの因子の操作により, 臓器特異性の高い診断薬への応用が期待される。

529 短寿命RI標識化合物自動合成装置の開発

篠原 真, 中西博昭, 西山 力, 岩永政也
(島津製作所)

我々は, 現在, 小型サイクロトロンで生成された短寿命RIを原料として, 標識化合物を自動合成する装置を開発中であり, これらは,

1. ターゲット準備から, 化合物合成までの自動化。
2. 保守・管理の容易さ。

に重点をおいて設計されている。

標識化合物自動合成装置, 及びその付属装置として下記の物を開発中である。

1. RIガス製造装置
¹¹C, ¹⁵O, ¹⁸Fで標識されたRIガスの製造を行なう。
2. 吸気ガス供給装置
患者に供給するRIガス濃度を一定に保ち, 同時にガスの品質管理も行なう。
3. プリカーサ自動合成装置
様々な人体投与用化合物の標識を行なう際の原料となるH¹¹CN, ¹¹CH₃I, H¹¹CHOを合成する。