

用、標識方法の改善(例えば、リンカーの導入)、EDTAなどのキレート剤による<sup>111</sup>Inの追い出しなどが考えられる。F ab や IgG の異なるアイソタイプを投与する検討も行われている。

(3) 腫瘍への集積が低すぎる：高い比放射活性の標識抗体を用いる方法、腫瘍細胞表面を均一にするためのBRM剤の併用投与、血管透過性を増

やす工夫、標識抗体の投与経路などが検討されている。

(4) 抗・投与抗体の生成が影響を及ぼさないか？：ヒト抗体、キメラ抗体の投与、または、免疫抑制剤の併用などを考えている。

以上の点を踏まえ、今後のRadioimmunodetectionの方向についても触れたい。

### 《教育講演 3》

## 放射性医薬品

横山

陽 (京都大学薬学部放射性薬品化学)

<sup>11</sup>C, <sup>13</sup>N, <sup>15</sup>O, <sup>18</sup>F ポジトロン RI の核医学応用で、局所血流変化、神経系受容体機能変化、さらには、グルコース、高級脂肪酸のエネルギー代謝機能変化などの生理、生化学的変化を診断する機能診断薬剤が、脳、心疾患を主な対象として開発され、放射性医薬品は新時代を迎えることになったが、この研究は、ポジトロン RI 標識放射性医薬品にとどまらず、直ちに、<sup>123</sup>I, <sup>99m</sup>Tc 標識放射性医薬品に波及し、現在、すでに対応する数多くの化合物が開発され、また開発されようとしている。

一方、こうした標識薬剤の開発および臨床成果は各 RI 標識化合物の基礎研究の充実を促し、最近では、各 RI の性質を意図的に生かした新しい放射性医薬品開発の動向がみられる。生体物質の構成元素の RI である<sup>11</sup>C, <sup>13</sup>N 標識化合物では、酢酸、アルコール、オリゴペプチド等の低分子化

合物に代表される母体化合物構造保持の各種標識化合物の合成と、基本的な体内動態の探索、また、合成には有利であるが、異種元素の導入を基本とする<sup>18</sup>F, <sup>123</sup>I 標識化合物では、その特徴を生かした局所 pH 変化、酸素濃度変化、酵素活性変化などのより広範な生理、生化学的機能変化の診断薬剤の開発である。また、<sup>99m</sup>Tc 標識化合物では、コンパクトな化学構造の錯体を基本とする、医薬品研究ではじめての金属錯体のドラグデザインが進歩してきた。さらに、ポジトロン金属 RI を含めて、金属錯体独特の性質を医薬品開発に結びつけようとする新しい動向もみられる。

これらとは別に、RI 標識単クローニング抗体によるがんの診断、治療の研究も活発となった。

このように、放射性医薬品は本格的なインビボ生理学、生化学を基盤とする時代に入り、さらに、一步前進しようとしている。