

《技術報告》

糖代謝型腫瘍イメージング剤 ^{18}F -FDG
{2-フルオロ-2-デオキシ-D-グルコース (^{18}F)} 注射剤の開発
非臨床試験結果

猪野 宣人* 島田 隆介* 加奈川 優* 鈴木 徳昭*
近藤 進* 白神 宜史* 伊藤 修* 東 眞*

* 日本メジフィジックス株式会社 研究開発本部創薬研究所

要旨 Hamacher らの方法に準拠した ^{18}F -FDG の製造法を確立し、非臨床試験を行った。規格および安定性試験の結果より、 ^{18}F -FDG 注射剤の包装単位：185 MBq (2 ml); 検定時、貯法：室温、有効期限：検定時より 4 時間、放射化学的純度：95% 以上、とした。FDG のラットおよびイヌの静脈内単回投与毒性試験を実施したところ、重篤な毒性徴候を惹起するものではなく、安全性が確認された。ラットにおける薬物動態試験の結果、主に集積した臓器は脳 (3.0~3.3%ID/臓器; 投与後 30 分) と心臓 (4.2~5.8%ID/臓器; 投与後 1~3 時間) であった。また、担癌 (コロシ 26) マウスにおける薬物動態試験の結果、腫瘍内への集積は投与後 1 時間で最大 ($10.9 \pm 3.5\%$ ID/g, 脳以外の臓器中で最大濃度) となり、3 時間点までほぼ同程度であった。一方、ラットにおける薬物動態および Mejia らのヒトによるデータを基に、MIRD 法に従ってヒトに外挿した吸収線量を計算した結果、本剤の吸収線量は既存の放射性医薬品と同等もしくはそれ以下であった。以上より、本剤は腫瘍イメージング剤として安全性および有効性が示唆され、臨床における有用性が期待される。

(核医学 36: 467-476, 1999)