

《技術報告》

ドパミン D₂ 受容体イメージング剤 ¹²³I-IBF の 第 1 相臨床試験 (第 2 報)

脳内薬物動態およびその定量法の検討

米倉 義晴* 定藤 規弘* 土田 龍郎** 植松 秀昌**
中村 聡* 大西 良浩*** 山本 和高** 石井 靖**

* 福井医科大学高エネルギー医学研究センター

** 福井医科大学医学部附属病院放射線科

*** 日本メジフィジックス株式会社

要旨 健康成人男子 12 例を対象とした (S)-5-ヨード-7-N-[(1-エチル-2-ピロリジニル)メチル]カルボキサミド-2,3-ジヒドロベンゾフラン (¹²³I) (¹²³I-IBF) 注射液 (以下, 本剤) の第 1 相臨床試験において, 本剤の脳内薬物動態を検討した. 本剤の特異的結合を示す定量的指標である線条体 / 前頭葉カウント比 (-1) (St/Fc - 1) は, 本剤投与後 90 ~ 120 分および 180 ~ 210 分にそれぞれ 1.81 ± 0.19 および 2.21 ± 0.39 であった. これらの時間点における St/Fc - 1 は, 動脈採血に基づく入力関数および 3-コンパートメントモデル解析から得られた分布容積比による結合能 (Vd 比 - 1) と良好な相関を示した. また, 線条体および参照領域の時間 放射能曲線を用いて曲線近似法から求めた本剤のドパミン D₂ 受容体 (D₂-R) 結合能 (BPR) も, Vd 比 - 1 と良好な相関を示した. 一定の形状の関心領域を用いるテンプレート ROI は, フリーハンドで設定した ROI に比べ, 術者内または術者間の再現性が良好であった. 以上のことから SPECT を用いて非侵襲的かつ簡易的に D₂-R 結合能を評価できることが示され, 本剤は D₂-R 結合能の評価に適した放射性薬剤であると考えられた.

(核医学 36: 155-168, 1999)