

进行了对比分析:正常=0,轻度稀疏=1,明显稀疏=2,严重减少=3,缺损=4。

两种示踪剂的运动试验结果没有明显差别(^{201}Tl 缺损区为61%, $^{99\text{m}}\text{Tc-MIBI}$ 为58%)。静息 $^{99\text{m}}\text{Tc-MIBI}$ 的异常摄取(打分1~4)为55%室壁节段, ^{201}Tl 标准再分布显像亦为55%室壁节段异常。再注射法的早期缺损为55%,3~4小时延迟显像为54%($P=\text{NS}$)。标准 ^{201}Tl 再分布显像,有75个节段(占19%)为缺损区(4分),同样数目的缺损段也见于 $^{99\text{m}}\text{Tc-MIBI}$ 静息显像,可是, ^{201}Tl 再注射法显像早期缺损区为70个(占18%),延迟显像降为62个(占16%), $P<0.05$ 。因此,3小时后的静息 ^{201}Tl 延迟显像,可以探测出更多的可逆性灌注缺损节段,也就是说,静息 ^{201}Tl 延迟显像对检测心肌存活更为敏感。这一发现可能对选择心肌存活的示踪剂及示踪技术有意义。

(冯郁新摘 刘秀杰校)

100 $^{99\text{m}}\text{Tc-tetrofosmin}$:一种新的心肌灌注显像剂的体内分布、剂量学 and 安全性[英]/Higley B...//J Nucl Med. -1993, 34(1). -30~38

$^{99\text{m}}\text{Tc-1,2}$ 双[双(2-乙氧基乙基)磷基]乙烷(又名 tetrofosmin 或 P53)是一种新的心肌灌注显像剂。实验研究了其体内分布、安全性和剂量学。

方法:12名健康男性志愿者,平均年龄 28 ± 4 (22~35)岁。平均体重 $71\pm 100\text{kg}$ 。在 tetrofosmin 冻干药盒小瓶内加 $^{99\text{m}}\text{TcO}_4^-$ 约6ml(190~370MBq),轻摇小瓶使之完全溶解并置于室温(15~25℃)15min。RCP 用纸层折法,展开剂为丙酮:二氯甲烷=36:65。平均 RCP 为 $96\%\pm 2\%$,常规在2h内使用。

每一志愿者静注140~170MBq/2.4~5ml 两次,总累积化学剂量(静息和运动相)占一瓶总含量的88%~162%。测量静注前后不同时相的脉搏、体温、血压和心电图。采集静注前后若干时相的血、尿及粪便样本,分别测定其放射性

计数并计算百分数。

体内分布显像两个中心采用不同的技术。全身显像 Northwick Park 用 IGE 400AT γ 相机。静息显像 Aberdeen 用 IGE 500A Maxicamera。

结果:无严重副反应,仅1例静息相静注(总量的80%)后即感微热并有轻度恶心(12~24h)。两次静注后均无心电图异常,亦无血压和体温变化。

血液清除快,静注后10min 已少于注射剂量的5%。静息相尿清除约比运动相高50%,48h 后清除量相等。粪清除运动相比静息相低。48h 全身清除静息相 $72\%\pm 5.5\%$ 和运动 $67\%\pm 6.3\%$ 。尿粪排泄分别约为排出总放射性的50%。

早在静注后5min 和以后2h 获得高质量心肌图像。大多数测试者(10/12静息和运动相)静注后5min 早期显像即有足够诊断价值,30min 时为全部。运动相体内分布与静息相明显不同的是肝、膀胱和唾液腺放射性降低而骨骼肌放射性增加。两个中心定量体内分布资料很相似,仅运动相5min 肝摄取不同。心肌摄取快且滞留良好,大多(静息相9/12和运动相10/12)心肌摄取超过1.1%。心肺比值高,心肝比值中等。

给予1 100MBq $^{99\text{m}}\text{Tc-tetrofosmin}$ 后计算有效剂量,3.5h 膀胱排空期时为 $8.9\times 10^{-3}\text{mSv/MBq}$ (静息相)和 $7.1\times 10^{-3}\text{mSv/MBq}$ (运动相)。1~4.8h 增加的有效剂量 $<15\%$ 。接受剂量最高的脏器是排泄道(胆囊、大肠、小肠、膀胱和肾)。性腺睾丸较低为 3.5mSv/1 100MBq (静息和运动相),卵巢为 10.9mSv/1 100MBq (静息相)和 7.9mSv/1 100MBq (运动相)。

(钱忠豪摘 蒋长英校)

101 $^{99\text{m}}\text{Tc(V)}\text{-DMSA}$ 药盒快速制备:评价其用于肿瘤及转移灶闪烁显像[英]/Chauhan UPS...//J Nucl Med Biol. -1992, 19(8). -825~830

$^{99\text{m}}\text{Tc(V)}\text{-DMSA}$ 是一个很有希望的对肿

瘤特异的显像剂,它的生物学分布与 ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA 完全不同,且用于制备 ^{99m}Tc (V)-DMSA 的药盒还没有商品化。本实验介绍它的制备,并评价它在动物模型及癌症病人中的显像效果。

^{99m}Tc (V)-DMSA 药盒是由 DMSA 药盒制备的。快速地将 1ml 水、1.1mg DMSA 和 1.26mg NaHCO_3 混合均匀,再向此溶液加 0.75mg 抗坏血酸和 0.2mg 的 SnCl_2 ,溶解后,用 1N HCl 将 pH 调至 2.5,溶液用 220nm 微孔滤膜过滤,冷冻干燥,在 N_2 气保护下密封保存。此药盒贮存在 4~7℃ 可达 3 个月。用时向药盒加入 0.2ml 3.5% NaHCO_3 ,混匀,使 pH 值提高至 8.5,然后加 2~3ml (5~20mCi) ^{99m}Tc -高锝酸盐。对于制备 ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA,只加 ^{99m}Tc -高锝酸盐,不加 NaHCO_3 。

鉴定结果表明 ^{99m}Tc (V)-DMSA ($R_f=0.6$) 及 ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA ($R_f=0$) 的产率均大于 99%;两种放射性药物在体外都是稳定的,二者在 24h 内无降解。在体内,给兔子注药后 4h 取血, ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA 有 5% 降解, ^{99m}Tc (V)-DMSA 有 7% 降解,但随着时间增长,甚至到 24h 没有发现进一步的降解;两种放射性药物在体内外与血浆蛋白的结合率明显不同。在体外, ^{99m}Tc (V)-DMSA 结合率仅 60%,而 ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA 高达 98%。体内结果与体外相似,前者为 60%,后者为 98%。因此, ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA 在血中清除率比 ^{99m}Tc (V)-DMSA 要快;在小鼠体内生物学分布实验中,二者也是明显不同的, ^{99m}Tc (V)-DMSA 在骨及肌肉中比 ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA 多,而在肝肾中比 ^{99m}Tc (Ⅲ)-DMSA 少。最后给一期和二期肿瘤病人 185~740MBq (5~20mCi) ^{99m}Tc (V)-DMSA,在 1~3h 内用 γ 相机定位显像恶性肿瘤部位,评价 ^{99m}Tc (V)-DMSA 的临床效果表明,它不仅可用于软组织瘤的显像,还可用于骨、脑、肝中转移灶的显像。

(刘静波编 韩佩珍校)

102 ^{123}I 标记心房肽及其衍生物:初步结果 [英]/Wolf H...//Eur J Nucl Med. -1993, 20 (4). -297~301

对心房肽 (ANP) 标记物的研究可以了解 ANP 的体内定量分布及某些疾病的体内放射性药物分布,评价 ANF (心纳素) 的最佳 ^{123}I 标记条件,研究各种条件下动物实验中放射性药物体内动力学。

方法:以 Iodogen 法标记 rANF 及其衍生物心房肽 Ⅲ (AP_3)、酪氨酸心房肽 I (TAP_2)、Urodilatin (URO)。向铺有 Iodogen 的试管中加 100 μl 含心房肽的缓冲液及 111MBq ^{123}I ,室温, pH4~9, Iodogen 1~20 μg ,反应时间 1~20min。用二种方法分离纯化标记物:(1) Sep-Pak 反相层析法;(2) 高压液相层析法。210nm 检测光密度,以薄层层析法检测放化纯度。注射单碘标记的 ANF 或其衍生物于兔,用动态 γ 相机做动态闪烁显像图,每 5min 一帧,历时 100min,共 20 帧。以 ROI 技术做各种器官的时间-活性曲线。

结果:最佳标记条件为 10 μg Iodogen, 10 μg 肽(溶于磷酸盐缓冲液), pH=7.2, 反应 60min。Sep-Pak 柱纯化:第一峰为 ^{123}I , 第二峰为单碘标记 ANF 或其衍生物。HPLC 法纯化:游离碘 [RT 14.8min], 未标记的肽 [RT 248~28min], 单碘标记物 [RT 30.1~35.7min]。酪氨酸的双碘标记 <1%, 二种分离方法效果相同。无菌过滤后产率为 71%~79%, 放化纯 >98%。实验兔注射标记物 100min 后,甲状腺只摄取总剂量的 0.6% \pm 0.2%, ^{123}I -ANF 和 ^{123}I -URO 的甲状腺摄取量 100min 后缓慢增加 0.1%~0.2%, 而 ^{123}I - AP_3 , ^{123}I - TAP_2 注射后 50min 时摄取量最多, 这提示标记物降解很少。肾、肝中标记物逐渐减少, 头部 ^{123}I -ANF, ^{123}I - AP_3 和 ^{123}I - TAP_2 积聚增加, 而 ^{123}I -URO 积聚减少。100min 后, ^{123}I -ANF, ^{123}I - AP_3 , ^{123}I - TAP_2 的摄取量分别为 16%, 12.8%, 10%。

结果表明, Iodogen 法似乎是 ANF 及其衍生物的最佳 ^{123}I 标记方法, 标记物的产率及放化纯均很高。Sep-Pak 柱分离法比 HPLC 法简便、