

瘤特异的显像剂,它的生物学分布与 $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA 完全不同,且用于制备 $^{99m}\text{Tc}$  (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。

$^{99m}\text{Tc}$  (V)-DMSA 药盒是由 DMSA 药盒制备的。快速地将 1ml 水、1.1mg DMSA 和 1.26mg  $\text{NaHCO}_3$  混合均匀,再向此溶液加 0.75mg 抗坏血酸和 0.2mg 的  $\text{SnCl}_2$ ,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  $\text{N}_2$  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%  $\text{NaHCO}_3$ ,混匀,使 pH 值提高至 8.5,然后加 2~3ml (5~20mCi)  $^{99m}\text{Tc}$ -高锝酸盐。对于制备  $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA,只加  $^{99m}\text{Tc}$ -高锝酸盐,不加  $\text{NaHCO}_3$ 。

鉴定结果表明  $^{99m}\text{Tc}$  (V)-DMSA ( $R_f=0.6$ ) 及  $^{99m}\text{Tc}$  (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, $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA 有 5% 降解, $^{99m}\text{Tc}$  (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, $^{99m}\text{Tc}$  (V)-DMSA 结合率仅 60%,而  $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA 高达 98%。体内结果与体外相似,前者为 60%,后者为 98%。因此, $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA 在血中清除率比  $^{99m}\text{Tc}$  (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, $^{99m}\text{Tc}$  (V)-DMSA 在骨及肌肉中比  $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA 多,而在肝肾中比  $^{99m}\text{Tc}$  (Ⅲ)-DMSA 少。最后给一期和二期肿瘤病人 185~740MBq (5~20mCi)  $^{99m}\text{Tc}$  (V)-DMSA,在 1~3h 内用  $\gamma$  相机定位显像恶性肿瘤部位,评价  $^{99m}\text{Tc}$  (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  $^{123}\text{I}$  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  $^{123}\text{I}$  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 ( $\text{AP}_3$ )、酪氨酸心房肽 I ( $\text{TAP}_2$ )、Urodilatin (URO)。向铺有 Iodogen 的试管中加 100 $\mu\text{l}$  含心房肽的缓冲液及 111MBq  $^{123}\text{I}$ ,室温, pH4~9, Iodogen 1~20 $\mu\text{g}$ ,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  $\gamma$  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 $\mu\text{g}$  Iodogen, 10 $\mu\text{g}$  肽(溶于磷酸盐缓冲液), pH=7.2, 反应 60min。Sep-Pak 柱纯化:第一峰为  $^{123}\text{I}$ , 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%,  $^{123}\text{I}$ -ANF 和  $^{123}\text{I}$ -URO 的甲状腺摄取量 100min 后缓慢增加 0.1%~0.2%, 而  $^{123}\text{I}$ - $\text{AP}_3$ ,  $^{123}\text{I}$ - $\text{TAP}_2$  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  $^{123}\text{I}$ -ANF,  $^{123}\text{I}$ - $\text{AP}_3$  和  $^{123}\text{I}$ - $\text{TAP}_2$  积聚增加, 而  $^{123}\text{I}$ -URO 积聚减少。100min 后,  $^{123}\text{I}$ -ANF,  $^{123}\text{I}$ - $\text{AP}_3$ ,  $^{123}\text{I}$ - $\text{TAP}_2$  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  $^{123}\text{I}$  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、

经济。显像发现,头部对 ANF 及其衍生物的摄取稳定增加。

(袁洪卫摘 刘秀明校)

103  $^{201}\text{Tl}$  运动试验中潘生丁灌注对红细胞 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率的影响[英]/Rodeny...// Eur J Nucl Med. -1992,19(12). -1050~1053

50例患者被随机地分为潘生丁组和单纯运动实验组(分别为30例和20例),并在开始实验前和给药后3~4小时测定病人的体外红细胞 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率。

方法:用注射器取全血5ml,加入含有 $10\mu\text{g}$  亚锡离子的焦磷酸亚锡,室温孵育10分钟,用生理盐水洗涤两次,再加入 $800\text{MBq}$   $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -高锝酸盐孵育10分钟,用生理盐水洗涤两次,标记率可根据洗涤前后的放射性强度计算。再对另外51例病人(36例潘生丁灌注,15例单纯运动试验)进行体内红细胞 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率测定。方法是静脉注入含有 $1\text{mg}$  亚锡离子的焦磷酸亚锡,20分钟后取全血5ml,加入 $800\text{MBq}$  的 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -高锝酸盐溶液,经孵育、洗涤后测定其放射性强度,最后按洗涤前后的放射性计算其标记率。

结果表明,体外红细胞 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率在潘生丁灌注和单纯运动试验之间以及运动试验前后之间无显著差异(分别为 $93\% \pm 4\%$ 和 $91\% \pm 4\%$ ;  $93\% \pm 4\%$ 和 $92\% \pm 4\%$ )。在体内红细胞 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率的测定中,潘生丁组和运动实验组也无显著差别(分别为 $87\% \pm 19\%$ 和 $90\% \pm 6\%$ )。

以前实验研究发现,潘生丁有抑制红细胞 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率的作用。但据本文资料,在日常临床显像工作中潘生丁灌注不会对红细胞的 $^{99\text{m}}\text{Tc}$  标记率产生影响。有资料表明,静脉给药的潘生丁在体内的血药浓度呈指数下降,其半衰期为 $11 \pm 2.2$ 小时,血浆蛋白结合率高达 $99.14\% \pm 0.24\%$ ,其在血浆和全血中分布的表现容积有明显差异(分别为 $2.43 \pm 1.1\text{L/kg}$  和

$3.38 \pm 1.26\text{L/kg}$ )。据此估计,在本研究中用 $0.56\text{mg/kg}$  潘生丁的剂量下,预计血药浓度大约为 $3 \times 10^{-7}\text{mmol/ml}$ ,大大低于以前实验研究的血药浓度(约为 $10^{-4}\text{mmol/ml}$ )。这可能是本文结果与以往实验研究结果产生差异的原因。

临床上常用氨茶碱来解除潘生丁作用,故作者进而研究了氨茶碱对红细胞标记率的影响。在用和不用氨茶碱的潘生丁组,体外红细胞标记法的标记率分别为 $94\% \pm 3\%$ 和 $92\% \pm 5\%$ ;体内红细胞标记法的标记率分别为 $91\% \pm 4\%$ 和 $82\% \pm 26\%$ ,均无显著性差异。故认为,用氨茶碱解除潘生丁的作用对红细胞标记率亦无显著影响。

(秦 岚摘 管昌田校)

104 肝肾综合征的 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA 和 $^{131}\text{I}$ -OIH 肾图[英]/Halkar RK...// Clin Nucl Med. -1992,17(6). -467~472

一位65岁有肝肾综合征的非甲非乙型肝炎病人,血肌酐 $389\mu\text{mol/L}$ ( $4.4\text{mg/dl}$ )。血胆红素 $90\mu\text{mol/L}$ ( $5.1\text{mg/dl}$ )。静脉注射 $^{131}\text{I}$ -OIH  $11.1\text{MBq}$ ( $300\mu\text{Ci}$ )和 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA  $370\text{MBq}$ ( $10\text{mCi}$ )后,用两个能量窗同时作放射性肾图。见双肾血流量呈对称性减少并延迟。肾实质内有核素滞留而集合系统内无滞留。 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA 肾图曲线先有血管峰,以后持续呈低平曲线,表示 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA 主要在血池内。5小时后延迟显像见膀胱内虽有少量放射性,但 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA 主要还是在肾皮质。 $^{131}\text{I}$ -OIH 肾图曲线呈持续升高型,静脉注射速尿 $40\text{mg}$  后肾图曲线也不下降。

检查结果表明,肝肾综合征的双肾血流量减少,肾实质浓集 DTPA 和 OIH 的速率减慢,核素通过肾实质的时间延长。这些改变是非特异性的,与急性肾小管坏死的肾图相似,但临床病因不同。

(沈钰如摘 马奇晓校)