



115 亲脂性与^{99m}Tc 标记氨基硫醇生物学分布的相互关系[英]/Papadopoulos M... // Nucl Med Biol. -1993,20(1). -101~104

人工合成的、用异型杂环胺取代的^{99m}Tc-DADT 复合物能够通过血脑屏障,并能在肺中聚积。DADT (或 BAT)的 N₂S₂型氨基乙烷硫醇是一种中性的、可溶于铜溶液的复合物,在 N₂S₂主链上引入一个功能基团,能够影响脑组织对其摄取。本实验研究 DADT 衍生物的脂溶性与脑、肺摄取 DADT 作用关系。

试验:用^{99m}Tc 对其进行标记,Bu₄N^{99m}TcOCl₄作为其产物母体,并通过 ir 和 ur 光谱方法定性。制备时应在氢氟化钠溶液中进行,分配系数的测定是在 pH=7.4 辛酰基磷酸盐缓冲液中进行的。

在体重为 20~25g Swiss Albino 小鼠尾静脉注射^{99m}Tc-DADT 后 2min,将感兴趣的器官取出称重,并在标准几何位置条件下测定其生物学分布。应用非线性最小二乘法确定脂溶性与 DADT 摄取量之间的数学关系。

结果与讨论:异构体 A 的脂溶性高于 B。该复合物吡咯环的 V 和 VI 位被 3,3-二甲基或酚基取代,可使脑摄取减少和血浓度增高,可能是该复合物与血浆蛋白作用的结果;在 N₂S₂主链上介入异丙基-3-甲基-吡咯链,则该复合物在肺、脑中的摄取增加;^{99m}Tc-4-甲基-NEP-DADT 在脑组织中有高度的聚集,而其他的氮杂环取代物在脑组织中仅有较低的摄取;在 DADT 复合物的主链上引入一个取代烷基的吡啶类化合物,则可使该复合物在脑内明显聚集。肺组织对该物的摄取是因为外源性胺与肺细胞的非特异性结合。脑组织对各种 DADT 复合物的摄取量与脂溶性的相互关系可呈现为一个抛物线(PC),在 PC 值为 100~200 的区域显示了该复合物在脑组织中有较高摄取。相反,在肺聚积与^{99m}Tc-DADT 复合物 PC 值之间为一线性相关(r=0.70)。将吡咯-DADT 复合物注入体内,可见该复合物在肺中有较高的摄取,其 PC 值分别为 235 和 250,这些复合物具有较高的脂溶性。

上述结果的意义在于:在 N₂S₂链上选择性地改变一侧胺的功能基,以使其在脑中高度聚集;或者,

仔细地研究这些复合物在肺中的代谢,使其应用于肺显像。

(李小东摘 郑妙鸾校)

116 肝细胞癌治疗剂——¹³¹I-碘化油的制备[英]/Jiunn-Guang LO... // J Appl Radiat Isot. -1992,43 (2). -1431~1435

¹³¹I-碘化油作为肝癌的治疗剂,在肝癌病灶中的放射性强度高于正常组织 3~8 倍,并且贮留时间较长,一年后仍可在肝癌细胞中检测出。现介绍 ¹³¹I-碘化油的制备,并分析反应温度、pH 值对其影响,选择最佳反应条件及贮存条件。

方法:通常,在 25ml 圆底烧瓶内将 Na¹³¹I 与 1ml 乙醇混合,在搅拌和通 N₂ 气条件下,将混合物在 45℃ 和 PEG400(聚乙二醇 400)的油浴中加热至干。干品用 1ml 乙醇放 2~5ml 碘化油溶解,在 80℃ 加热 20 分钟以除去乙醇,为了提高标记率,在 100℃ 下继续加热 30 分钟。以 85% 甲醇作为展开剂,用 ITLC 法测其标记率。所得的放化纯度应不低于 95%。最终产品用 0.2μm 微孔膜过滤灭菌,并用碘化油调节到所需放化浓度。作为改进方法,可将温度从 45℃ 提高到 80℃,此时应考虑到乙醇的干燥速度和 ¹³¹I 的蒸发的影响。

标记效率和产品放化纯度的评价是将不同反应时间和加热温度(100℃, 10min; 80℃, 20min 或 40min; 60℃, 60min)进行搭配组合。pH 值对加热过程中 ¹³¹I 损失的评价用硼酸缓冲液或 0.45% 的 NaOH-乙醇溶液将 Na¹³¹I 溶液的 pH 值调节到 8, 9, 10, 12 来确定。¹³¹I-碘化油的稳定性是通过将其贮存在暗处或亮处,在室温或 2~8℃ 下 4 周后测定其放化纯度、外观变化和 pH 值为评价。用此产品观察了 5 例患者的治疗情况。

结果:最佳反应条件为 100℃, 10 分钟。其标记率可达 95.5% ± 0.7%, 放化纯度为 98.2% ± 2.5%, 在 4℃ 至少可保存 1 个月。体内试验表明,肿瘤病灶与正常肝组织放射性剂量比值为 6.1 ± 2.4, 大多数病情都有不同程度的缓解及肿瘤部分减少。在治疗期间及治疗后,病人无呕吐、肝痛、恶心等副作用,但 WBC 平均减少 20%, 没有病人死于与治疗有关的副作用。

(刘静波摘 熊振潮 顾梅英校)