

放射薬剤分野における利用の 現状と展望

京都大学大学院薬学研究科

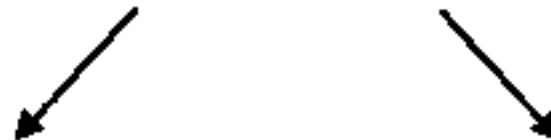
佐治 英郎

放射性医薬品(放射性薬剤)

核医学診療に用いられる放射性化合物

放射性医薬品

radiopharmaceuticals



[放射能]

radioactive

+

[医薬品]

pharmaceuticals

放射性医薬品

体外使用(インピトロ)

診断

ラジオアッセイ(高感度性の利用)

ホルモン、酵素、生理活性物質の血液中濃度の測定

体内使用(インピボ)

診断

PET、SPECT用放射性医薬品(物質透過性の利用)

(γ 線放出核種、短半減期)

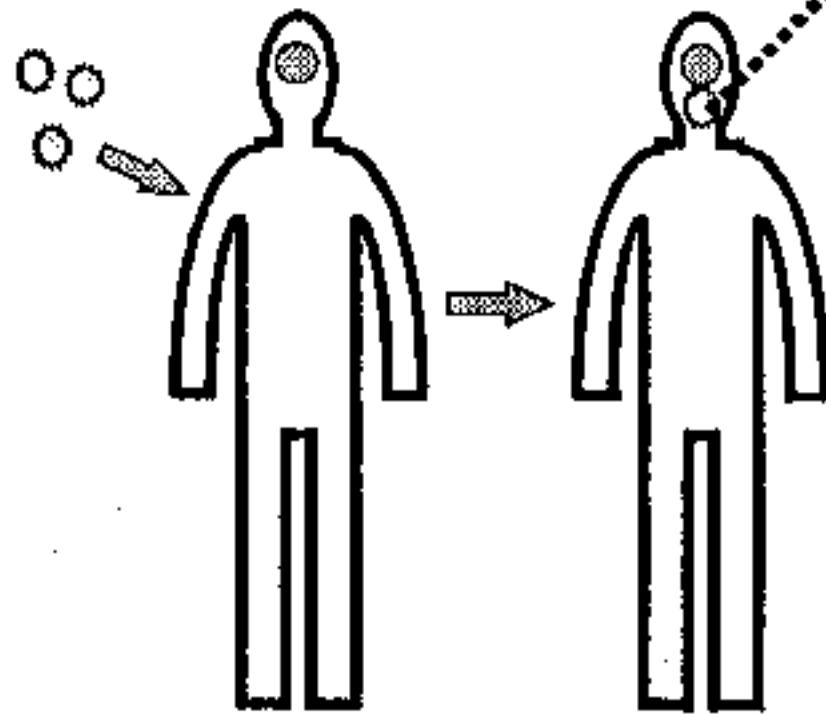
治療

内用放射線治療薬(細胞障害作用の利用)

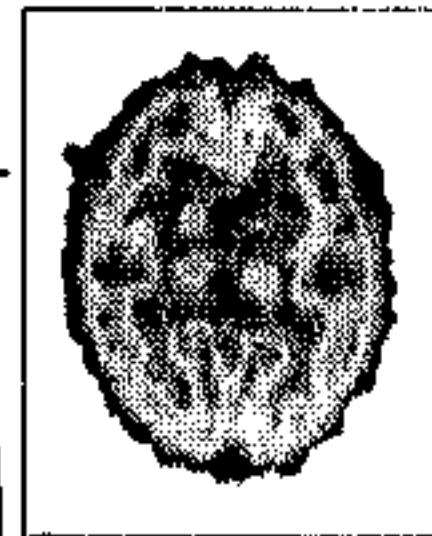
(β^- 線放出核種)

核医学診断

RI標識化合物
(放射性医薬品)



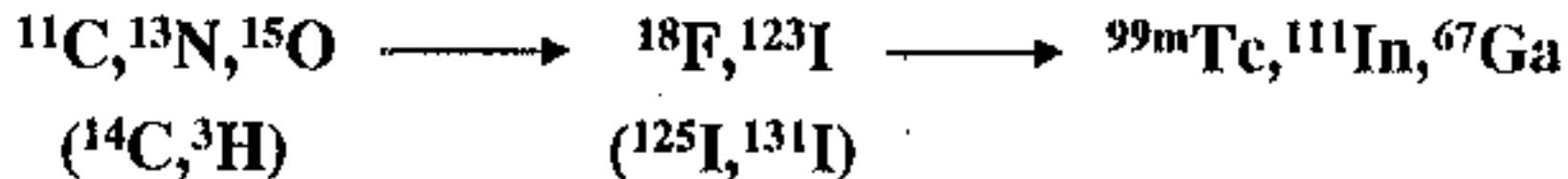
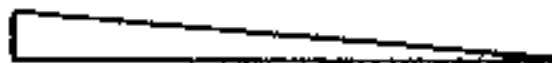
PET
or
SPECT



画像診断

放射性医薬品開発

Homogeneity



Availability、 $t_{1/2}$

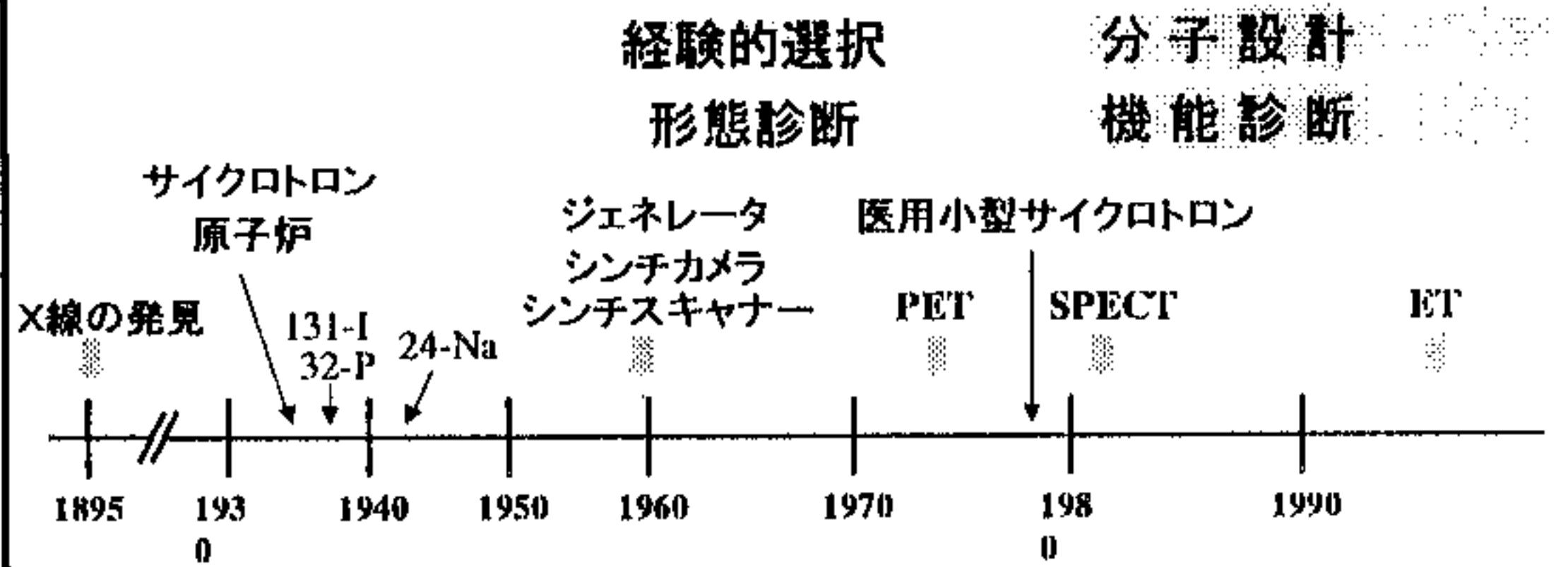
PET

SPECT

院内調製(小型サイクロトロン)

市販、院内調製(ジェネレータ)

インビボ放射性医薬品開発



第1世代 SPECT製剤

(^{131}I 製剤)
($^{99\text{m}}\text{Tc}$ 製剤:
 TeO_4 - $\text{Tc}-\text{DTPA}$,
 Tc -リシン酸)

PET製剤

(^{15}N 素ガス,
 ^{15}O -水、
 ^{18}F DG、
 ^{11}C -MSP)

第2世代 SPECT製剤

($\text{Te}-\text{HM}-\text{PAO}$,
 $^{67}\text{Ga}-\text{MAG3}$,
 $^{123}\text{I}-\text{IMP}$,
 I -受容体製剤)

新世代 放射薬剤

($\text{In}-\text{Te}$ -ペプチド、
タンパク質、
cDNA、治療薬、
 Tc -レセプター
製剤)

主なインビオ診断用放射性医薬品

Heart

Cardiac Out Put ^{99m}Tc -RBC,
 ^{99m}Tc -DTPA-HSA

Myocardial Blood Flow ^{201}TI ,
 ^{99m}Tc -MIBI, $^{13}\text{NH}_4^+$

Energy Metabolism ^{18}F -BMIPP,
 ^{11}C -acetate

Myocardial Adrenoreceptor $^{2\beta}\text{I}$ -MIBG

Myocardial Infarction :
 ^{99m}Tc -pyrophosphate

Liver

Reticuloendothelial System :
 ^{99m}Tc -Sn-colloid, ^{99m}Tc -phytate

Hepatocytes ^{99m}Tc -GSA

Hepatobiliary System ^{99m}Tc -PHMT,
 ^{99m}Tc -HIDA

Bone

Bone Metabolism :

^{99m}Tc -MDP, ^{99m}Tc -HMDP

Thyroid

^{131}I , $^{99m}\text{TcO}_4^-$



Brain

Blood Volume ^{99m}Tc -DTPA-HSA, ^{99m}Tc

Blood Flow : ^{123}I -IMP, ^{99m}Tc -HM-PAO,
 ^{99m}Tc -ECD, ^{133}Xe , H_2^{15}O

Energy Metabolism ^{18}F -FDG, ^{15}O ,

Central Nervous System :
 ^{11}C -N-Methylspiperone,

Lung

Blood Flow ^{99m}Tc -MAA,
 ^{99m}Tc -HAM, ^{133}Xe , ^{81m}Kr

Perfusion ^{99m}Tc -Gas

Ventilation ^{133}Xe , ^{81m}Kr

Kidney

GFR : ^{99m}Tc -DTPA,

Tubular Secretion :

^{123}I -OIH, ^{99m}Tc -MAG,
 ^{99m}Tc (III)-DMS

Tumor

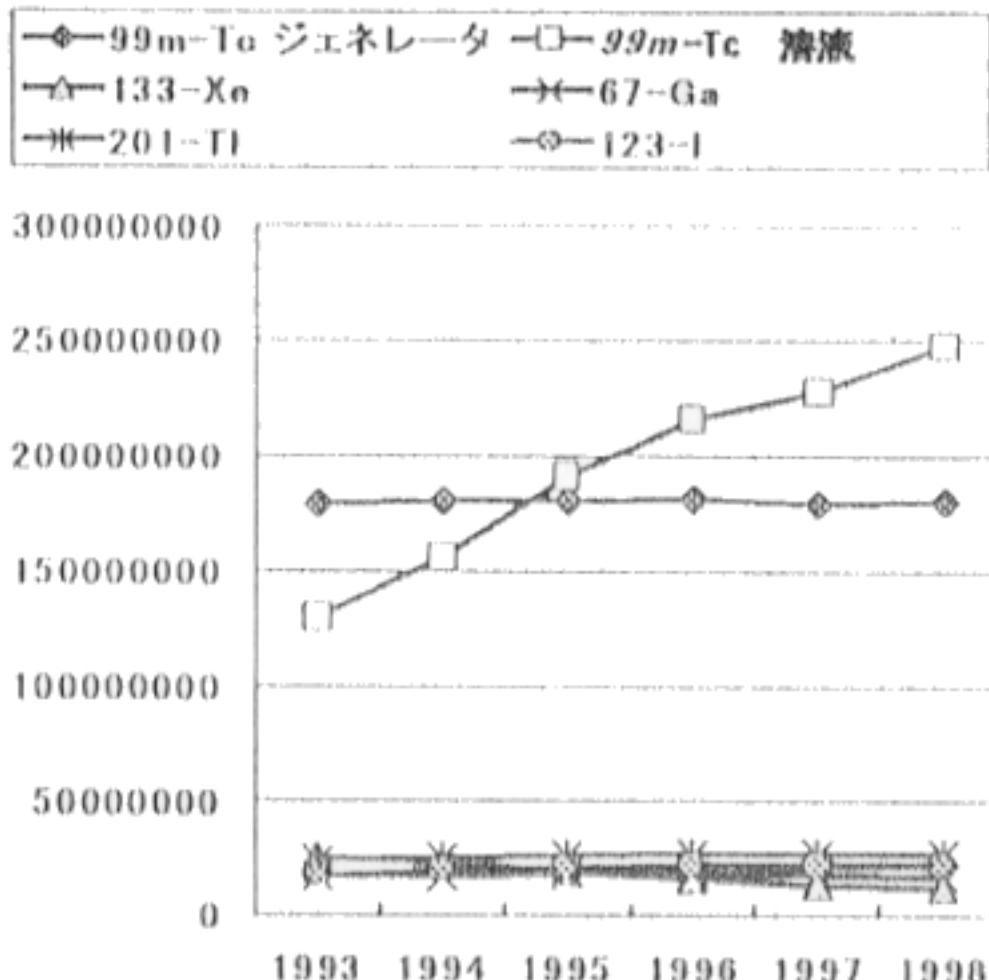
^{67}Ga -citrate, ^{99m}Tc -MDP, ^{201}TI ,

^{99m}Tc (V)-DMS,

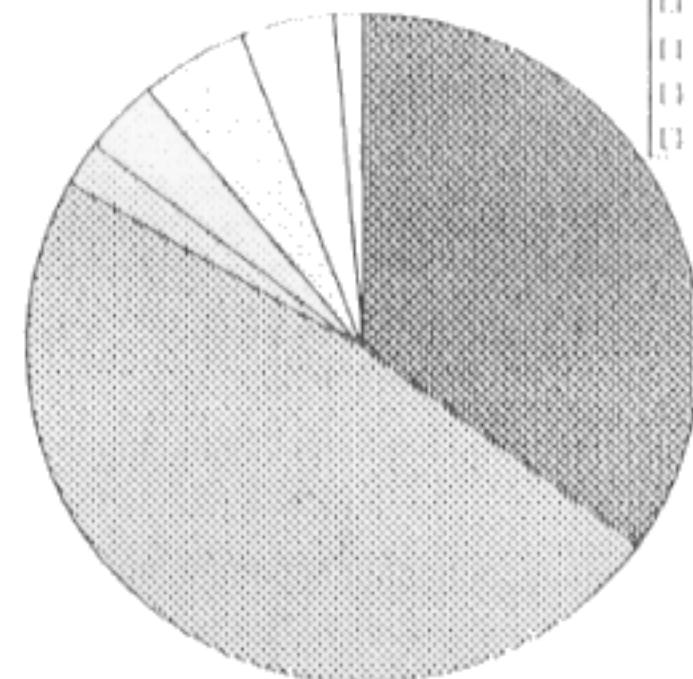
^{99m}Tc , ^{113}In -Antitumor antibody,

^{123}I -MIBI, ^{18}F -FDG

インビボ放射性医薬品の供給量



(1998年度)



(日本アイソトープ協会より)

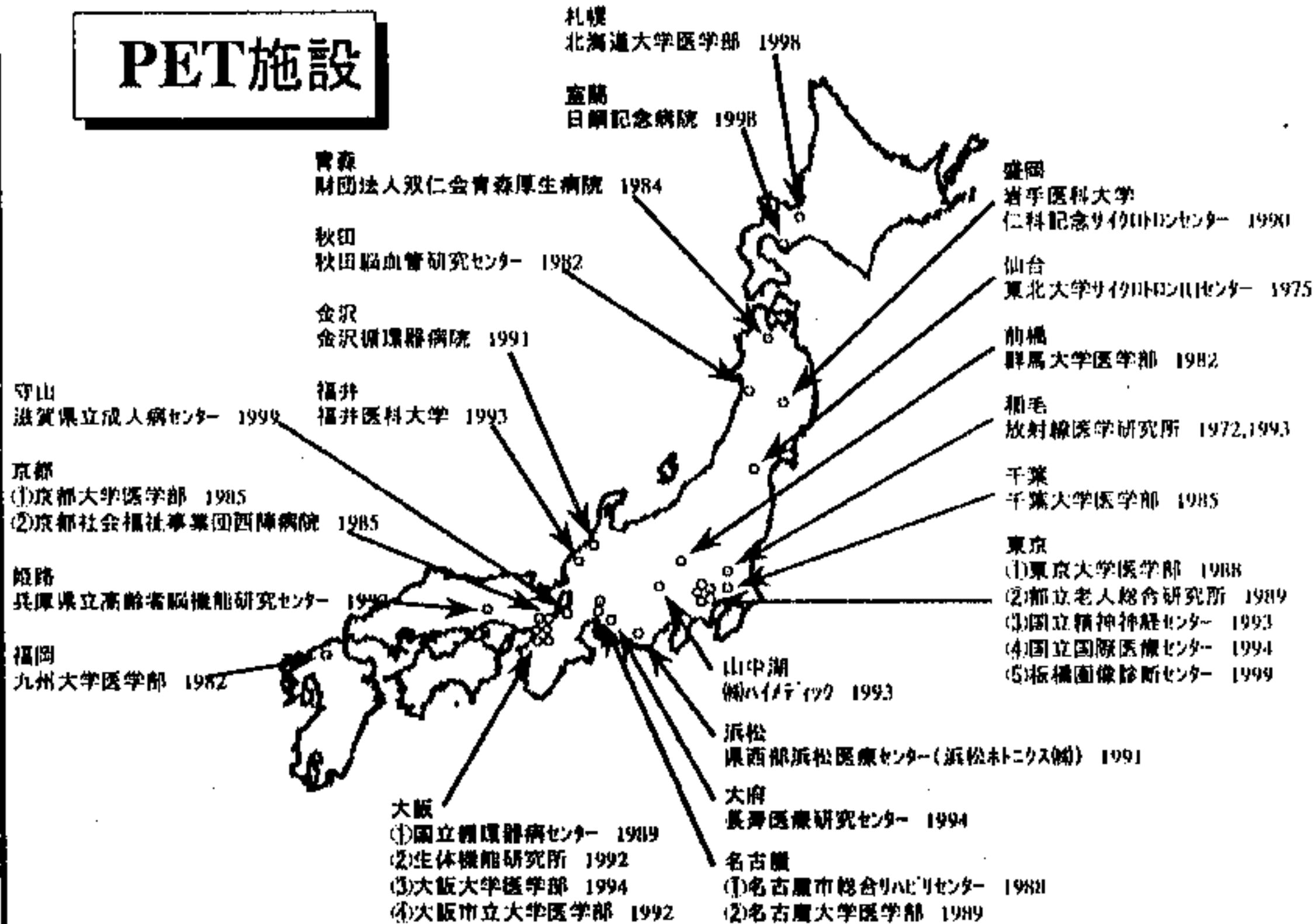
* 各国の放射性医薬品の使用状況の特色

日本: ^{99m}Tc 溶液、 ^{99m}Tc ジェネレータ製剤、 ^{123}I

米国: ^{99m}Tc ジェネレータ製剤

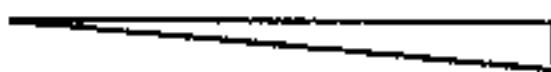
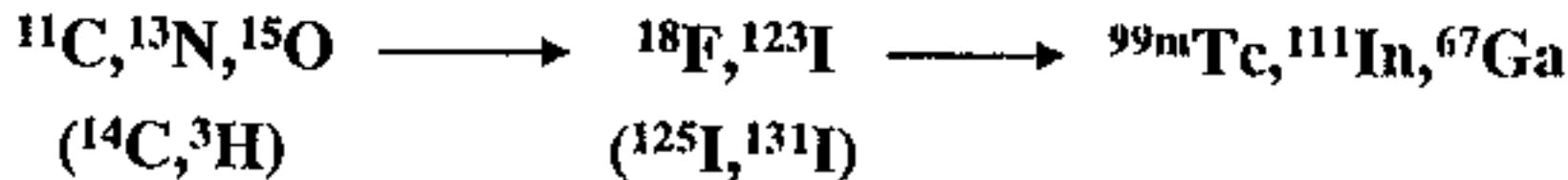
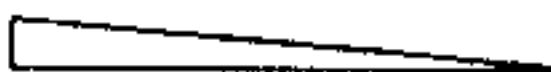
欧州: ^{99m}Tc ジェネレータ製剤、(^{123}I)

PET施設



放射性医薬品開発

Homogeneity



Availability、 $t_{1/2}$

PET

SPECT

院内調製(小型サイクロトロン)

市販、院内調製(ジェネレータ)

今後の放射性医薬品の製造・研究開発

- ・新しい放射性医薬品の研究開発
創薬研究
- ・人材の育成
- ・体制の整備・充実

今後の放射性医薬品の開発

診断薬

PETおよびSPECTの特徴を生かした放射性医薬品

➡ ET(Emission Tomography)放射性医薬品

分子イメージング(高機能性放射性医薬品)

エネルギー代謝機能

神経伝達機能

遺伝子機能

酵素活性

組織環境

➡ 質的診断、早期診断 ➡ 予防医学

(新しい生命科学: *in vivo human biochemistry*)

治療薬

がん治療、疼痛緩和(QOLの向上)

核種の開発、組織への選択的分布

人材の育成・確保

- ・研究者、教育者
- ・薬剤師

医療機関での専属薬剤師(品質管理、院内製剤)

- ・専門薬剤師(米国:薬剤師会で認定)

- ・教育システムの充実

カリキュラムの整備

- ・放射性医薬品取扱医療機関での薬剤師等
への専門教育
- ・研究者、専門薬剤師

体制の整備・充実(1)

- ・RI製造・供給体制

- * ^{99m}Tc の安定供給

- 複線的供給体制((n,f) 、 (n,γ))

- * PET放射性医薬品の周辺施設への供給

- 短半減期(PETNet(米)、サテライトPET(独))

- * 研究用RIの供給

- 安価で安定な供給

体制の整備・充実(2)

・新薬開発研究体制

- * 系統的な研究
- * 幅広い周辺技術を包含した総合研究
(放射性医薬品学、生理学、生化学、合成化学、
医薬品化学、薬剤学、薬理学、--)
➡ 放射性医薬品創薬研究所、研究プロジェクト
(産官学共同体制)

- * 施設、設備の充実
動物用PET・SPECTの開発、設置
(MRI／CTとの併用)

・法整備

- * クリアランスレベルの設定
臨床用、研究用短半減期RI廃棄物
- * 院内製剤

今後の放射性医薬品の製造・研究開発

- ・新しい放射性医薬品の研究開発

- 創薬研究

- ・人材の育成

- ・体制の整備・充実

- ➡ 日本から世界に発信する
新しい放射性医薬品の開発