

α 線を利用した悪性褐色細胞腫治療薬、 ^{211}At -MABG の開発

国立研究開発法人量子科学技術研究開発機構

量子ビーム科学研究部門 高崎量子応用研究所 放射線生物応用研究部

大島 康宏

悪性褐色細胞腫は主に副腎で発生したがんが他の臓器に転移した疾患であり、国内での患者数は約 600 人と少ないが、患者の 5 年生存率は 50%未満であり、治療後の見通しも悪い。最も効果的な治療として、ベータ線を放出するヨウ素-131 (^{131}I) を用いた放射性薬剤メタヨードベンジルグアニジン (^{131}I -MIBG) による治療が行われているが、根治は難しい。稀な疾患であるため、製薬企業の開発対象となりづらく、現時点で悪性褐色細胞腫を根治可能な治療薬は無い。

最近のがんの核医学治療では、アルファ線を用いた治療が大きく注目されている。ヘリウム原子核であるアルファ線は電子であるベータ線に比べ質量が約 7300 倍と非常に大きいため、物質中を数十 μm しか進めないが、その間に高いエネルギーを物質に付与する。そのため、アルファ線を放出する放射性同位元素 (RI) をがんを集積させることによって、細胞殺傷効果が高く、がん組織周囲への放射線影響を最小限に抑えた治療が期待できる。

我々は、原子力機構所属時から褐色細胞腫を標的とした放射性薬剤の研究開発を進めてきた。これまでに臭素-76 (^{76}Br) を標識したメタブロモベンジルグアニジン (^{76}Br -MBBG) とヨウ素-125 (^{125}I) を標識した ^{125}I -MIBG の体内動態を比較したところ、その特徴はよく似通っており、両化合物とも褐色細胞腫に高集積することを見出した。この結果から、異なる RI を標識した場合でもハロゲン元素であれば、がんへの集積性を維持できる可能性がある。そこで、臭素やヨウ素と同じハロゲン元素であり加速器で製造可能なアルファ線放出 RI であるアスタチン-211 (^{211}At) に着目し、アルファ線を用いた悪性褐色細胞腫治療薬メタアスタトベンジルグアニジン (^{211}At -MABG) の開発に取り組んでいる。本講演では、 ^{211}At -MABG の抗腫瘍効果を中心として、これまでの基礎検討から得られた成果について紹介する。

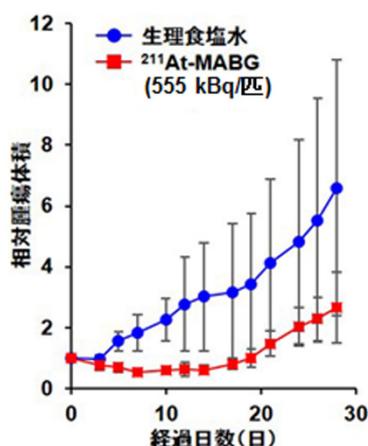


図1 担がんマウスに ^{211}At -MABG または生理食塩水を 1 回投与した後の腫瘍体積の変化。Y 軸は観察開始日の腫瘍体積に対する比を示す。



図2 ^{211}At -MABG または生理食塩水を投与した後、14 日経過後の担がんマウス写真。