

# 放射性同位元素を利用したがんの診断・治療薬の開発

日本原子力研究開発機構 量子ビーム応用研究部門  
RI 医療応用研究グループ  
渡辺 智

現在、放射性同位元素（RI）は、がんの診断・治療に利用されています。図1に示す様に、がん細胞に特異的に集積する化合物にRIを標識して体内に投与すると、がん細胞にRIを集積させることができます。透過力の強い $\gamma$ 線を放出するRIであれば、PET(Positron Emission Tomography)などの装置を使うことにより体の外から $\gamma$ 線の検出ができ、がんの画像診断が可能になります。一方、 $\alpha$ 線や $\beta$ 線を放出するRIの場合には、これら粒子が、がん細胞に対して局所的にエネルギーを与えて殺傷するため、がんの治療が可能になります。原子力機構では、このようなRIを用いたがんの診断及び治療に用いる薬剤の開発を進めています。

RIを用いたがんの診断に関しては、PETによる優れたがんの診断能が高く評価されています。現在、PET用薬剤の中では、 $^{18}\text{F}$ -FDG ( $^{18}\text{F}$ -フルオロデオキシグルコース)が、最も広く臨床で用いられています。しかし、グルコースの代謝を反映している $^{18}\text{F}$ -FDGは、がん以外に脳や炎症部位などに集積するため、その部位のがん診断が難しいという問題があります。そこで、 $^{18}\text{F}$ で標識したアミノ酸誘導体など、がんに対する特異性が高いPET診断薬が開発されましたが、 $^{18}\text{F}$ の半減期が約2時間と非常に短いことに加え、これらの薬剤は $^{18}\text{F}$ -FDGに比べて合成収率が低いことから、販売目的での大量製造が難しく製薬会社からの供給は困難です。このため、 $^{18}\text{F}$ を製造するサイクロトロンを導入した病院で合成する必要があり、限られた施設でしか使えませんでした。そこで、原子力機構では、半減期16.2時間の $^{76}\text{Br}$ を用いて、製薬会社から各病院への供給が可能で、がんに対する特異性が高いPET診断薬の開発を進めてきました。現在までに、 $^{76}\text{Br}$ の製造法を開発し、神経内分泌腫瘍の診断への応用が期待される $^{76}\text{Br}$ -MBBG ( $^{76}\text{Br}$ -*m*-ブロモベンジルグアニジン)やアミノ酸トレーサとして幅広いがんの診断への応用が期待される $^{76}\text{Br}$ -BAMT ( $^{76}\text{Br}$ -3-ブromo- $\alpha$ -メチルチロシン)の合成を行うとともに、動物を用いたPETイメージングにより腫瘍が明瞭に描写されることを確認し、PET薬剤としての有用性を明らかにしました。

一方、RIを用いたがんの治療については、近年国内で利用が可能になってきました。しかし、現在、国内で用いることができるRIは、 $^{89}\text{Sr}$ 、 $^{90}\text{Y}$ 、 $^{131}\text{I}$ の3核種のみであるため、さらに様々なRIの利用が期待されています。原子力機構では、治療用の $\beta$ 線だけでなく、治療状況のモニタリングが可能な $\gamma$ 線も放出する $^{177}\text{Lu}$ に注目し、その製造法の開発、抗体への標識及び動物実験によるがんの治療実験を行って腫瘍増殖抑制効果を確認し、がん治療薬としての有用性を明らかにしました。

本オープンセミナーでは、RIを用いた診断・治療の概要について紹介するとともに、原子力機構で進めてきた薬剤開発の詳細についてお話したいと思います。

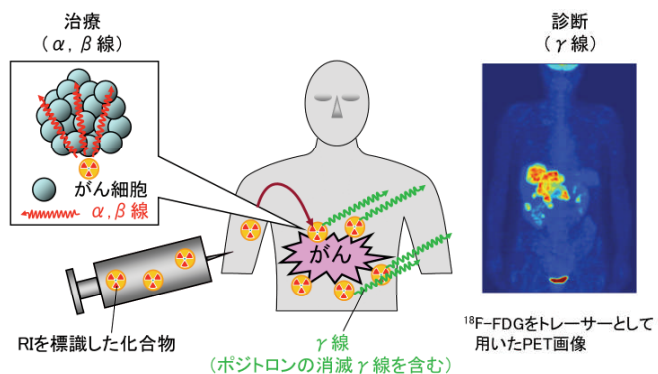


図1 RIを利用したがんの診断・治療の概要