

CNIC-00916

SMC-0112

CN9600993

中国核科技报告

CHINA NUCLEAR SCIENCE
AND TECHNOLOGY REPORT

肾显像剂^{99m}Tc-PAHIDA 的代谢特性与诊断使用

STUDY ON THE METABOLIC PECULIARITIES
OF RENAL RADIOTRACER ^{99m}Tc-PAHIDA
AND DIAGNOSTIC USE

(In Chinese)



中国核情报中心
原子能出版社

China Nuclear Information Centre
Atomic Energy Press

VOL 27 No 1 1



朱寿彭：苏州医学院放射毒理学教授，博士研究生导师。放射损伤研究室主任。1952年毕业于浙江医学院，1958年毕业于苏联医学科学院放射医学专业研究生，获医学博士学位。

Zhu Shoupeng: Professor of Radiotoxicology and advisor of doctoral candidate, Suzhou Medical College. Director of the Laboratory of Radiation Injury. Graduated from Zhejiang Medical College in 1952 and graduated from the Soviet Academy of Medical Science as a postgraduate of radiation medicine speciality in 1958 and had gotten degree of Medical Doctor.

CNIC-00916

SMC-0112

肾显像剂 ^{99m}Tc -PAHIDA 的代谢特性 与诊断使用

朱寿彭 王六一 伦明跃

(苏州医学院)

摘 要

用放射示踪术研究了肾显像剂 ^{99m}Tc -PAHIDA 摄入体内的代谢特性与临床诊断使用。观察表明, ^{99m}Tc -PAHIDA 在体内呈优势定位于肾脏,而在其后依次为心脏、胃肠道、肝、脾、股四头肌、脂肪、睾丸和脑组织。尤其值得指出的是,当该肾显像剂的摄入量愈低时,则其在肾脏的选择性浓集程度就愈高。同时其与血浆蛋白的结合程度就愈低。 ^{99m}Tc -PAHIDA 可迅速经肾脏排出体外,而且由尿色层分析放射自显影观察得到一个放射峰,从而证明 ^{99m}Tc -PAHIDA 在体内是以原形经尿排除的。

**STUDY ON THE METABOLIC PECULIARITIES
OF RENAL RADIOTRACER ^{99m}Tc -PAHIDA
AND DIAGNOSTIC USE**
(In Chinese)

Zhu Shoupeng Wang Liuyi Lun Mingyue
(SUZHOU MEDICAL COLLEGE)

ABSTRACT

The metabolic peculiarities of renal radiotracer ^{99m}Tc -PAHIDA and diagnostic use were studied. The results of the radioactive tracing study showed that ^{99m}Tc -PAHIDA was distributed predominantly in kidney, and then in heart, gastrointestinal tract, liver, spleen, musculus quadriceps femoris, adipose tissue, testes and brain. It should be noted that when smaller dose of this agent was given, more ^{99m}Tc -PAHIDA was concentrated in kidney and, at the same time, the level of its binding to plasma protein was lower. The experimental results indicated that ^{99m}Tc -PAHIDA was rapidly excreted in urine. Autoradiochromatographic examination of the urine showed a single radioactive peak corresponding to the authentic ^{99m}Tc -PAHIDA, indicating that ^{99m}Tc -PAHIDA was excreted in the unchanged form.

PAHIDA 的全称为对-〔(双-羧甲基)-氨基羧氨基〕马尿酸,是为替代邻碘马尿酸(OIH)而研制的具有肾小管分泌性能的新一代肾显像剂^[1,2]。我们对本院自行合成,并用^{99m}Tc进行标记的^{99m}Tc-PAHIDA 肾显像剂进行了摄入体内后的代谢特性与临床诊断使用关系的研究。

1 实验方法

实验研究使用的以^{99m}Tc 标记的 PAHIDA,其比放射性活度为 2 MBq/1.2 ml/10 mg,该肾显像剂的^{99m}Tc 标记率达 99.0%。实验观察共选用 BALB/c 纯品系的成年雄性小白鼠 45 只,体重在 20±2 g 之间。分组进行了如下研究:

1.1 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 的体内定位特性比较

设计分三个实验组,每组 5 只动物。探究了由尾静脉分别弹丸注入机体小剂量、中等剂量和大剂量的(即 3.7×10^2 , 18.5×10^2 和 92.5×10^2 Bq/g 体重)不同放射性活度^{99m}Tc-PAHIDA 后 5 min 的体内定位特性比较研究。各组动物由颈动脉放血处死后,迅速解剖剥离出肾、肝、脾、心、股四头肌、脂肪、睾丸、脑和胃肠道等组织,用扭力天平准确称取各组织标本 500 mg,分别放置到预先标号的平杯形井型闪烁杯中,在 EKCO 井型闪烁计数器内进行放射性活度测定^[3]。探测所用的晶体为井型 NaI(Tl) 晶体。

1.2 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 的体内血浆蛋白结合力比较

观察分三个实验组进行。同前所述由尾静脉弹丸注入小、中、大剂量的^{99m}Tc-PAHIDA,5 min 后分别处死各组动物,取肝素抗凝全血,放置于分离管中经离心分离出血浆及血液有形成分。随即取血浆,加入 10%三氯醋酸溶液,使血浆蛋白析出,分离后,沉淀经水洗,制取血浆蛋白结合力的测量标本^[4]。

1.3 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 的体内排除动态比较

另取三个实验组的 BALB/c 纯品系雄性小白鼠,弹丸注入低、中、高三种不同放射性活度的^{99m}Tc-PAHIDA 剂量同前。然后经 5 min 和 120 min 的不同间隔收集小白鼠的尿液,制作测量标本,测定其排除动态比较。

1.4 ^{99m}Tc-PAHIDA 的体内排除形式研究

机体摄入^{99m}Tc-PAHIDA 5 min 和 120 min 后,分别收集各实验小白鼠的尿液,作放射性色层分析^[5]。随后将实验获得的标本按接触法加薄保护层与高敏感度的乳胶片一同放入暗盒中,经过低温干燥曝光 48 h 后,取出标本作显影、制止、定影和水洗等步骤处理后,即可得到与放射性色层分析标本上放射性核素的分布定位完全相对应的宏观放射自显影像。

2 实验结果及讨论

2.1 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 的体内定位特性与诊断使用关系

BALB/c 纯品系雄性小白鼠尾静脉弹丸注入不同放射性活度的^{99m}Tc-PAHIDA 后 5 min,取出体内肾、肝、脾、心、股四头肌、脂肪、睾丸、脑和胃肠道,并进行它们的定位比较(如表 1 所示)。由表 1 可见,无论摄入体内的^{99m}Tc-PAHIDA 是小剂量、中等剂量还是大剂量,均呈现优势选择性定位于肾脏,体内各观察器官组织部位的定位水平顺序,在注入^{99m}Tc-PAHIDA 不同放射性活度时,基本上是一致的:即主要定位于肾脏,其后依次为心脏、胃肠道、肝脏、脾脏、股四头肌、脂肪和睾丸,而脑组织中由于有血脑屏障的存在,

其含量是最低的。尤其值得指出的是，从实验中观察到，当注入^{99m}Tc-PAHIDA 的放射性活度愈低时，则其在肾脏中的选择性浓集的程度就愈高。这个结果启示我们，在以能得到肾显像为原则的基础上，建议在临床诊断中使用的^{99m}Tc-PAHIDA 量愈小愈好。因为这样既能减少病员的放射性吸收剂量，且能达到更呈选择性定位于肾脏的目的。

表 1 不同剂量的^{99m}Tc-PAHIDA 由静脉注入机体后 5 min 的体内定位比较

注入的放射性活度 (Bq/g)	观察动物数	各观察器官组织(以每克组织含放射性活度与每克组织理论上平均分配放射性活度比值计)								
		肾	肝	脾	心	股四头肌	脂肪	睾丸	脑	胃肠道
3.7×10 ² (小剂量)	5	7.68 ±0.63	1.02 ±0.09	0.64 ±0.15	1.62 ±0.09	0.75 ±0.13	0.40 ±0.16	0.27 ±0.05	0.14 ±0.05	1.06 ±0.18
18.5×10 ² (中等剂量)	5	6.56 ±1.59	1.01 ±0.03	0.75 ±0.08	1.47 ±0.15	0.73 ±0.06	0.47 ±0.09	0.27 ±0.04	0.15 ±0.02	1.20 ±0.06
92.5×10 ² (大剂量)	5	5.25 ±0.68	0.93 ±0.06	0.72 ±0.05	1.44 ±0.09	0.57 ±0.16	0.37 ±0.13	0.33 ±0.24	0.13 ±0.02	1.12 ±0.06

2.2 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 的体内血浆蛋白结合特性与诊断使用关系

观察结果列于表 2 中。由表 2 可见，当由尾静脉弹丸注入给 BALB/c 纯品系雄性小白鼠不同放射性活度的^{99m}Tc-PAHIDA 后 5 min 阶段，观察到^{99m}Tc-PAHIDA 与血浆蛋白结合的百分率是：在小剂量时为 6.65±0.87%；中等剂量时为 8.38±1.05%；而大剂量时则为 11.42±1.73%。由此可见，当使用肾显像剂^{99m}Tc-PAHIDA 的用量愈大时，则其与血浆蛋白的结合百分率就愈高，因此，其失活反应也就愈严重。所以，从减少^{99m}Tc-PAHIDA 的失活反应率来考虑，在以能得到肾显像为原则的基础上，建议在临床诊断中使用该肾显像剂时，以用量愈低愈好。

表 2 不同剂量的^{99m}Tc-PAHIDA 由静脉弹丸注入机体 5 min 时与血浆蛋白的结合力比较

注入放射性活度(Bq/g)	观察动物数	与血浆蛋白结合的百分率
3.7×10 ² (小剂量)	5	6.65±0.87
18.5×10 ² (中等剂量)	5	8.38±1.05
92.5×10 ² (大剂量)	5	11.42±1.73

2.3 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 的尿排特性与诊断使用关系

不同放射性活度的^{99m}Tc-PAHIDA 由尾静脉弹丸注入到 BALB/c 纯品系雄性小白鼠体内的尿排动态比较如表 3 所示。观察表明，无论机体摄入小剂量、中等剂量还是大剂量的^{99m}Tc-PAHIDA，都能快速的经肾脏由尿排除。即使在机体摄入的放射性活度不同时，在随后的 5 min 和 120 min 阶段，也没在尿排速度与尿排比值上呈现出明显差异。因此，从减少机体的放射性核素摄入的吸收剂量来考虑，^{99m}Tc-PAHIDA 的临床诊断使用剂量，在能得到肾显像的基础上，亦以使用小剂量为宜。

表3 不同剂量^{99m}Tc-PAHIDA 由静脉弹丸注入机体后的尿排动态比较

注入放射性活度(Bq/g)	观察动物数	不同时间的尿排量(以排除放射性活度占注入总放射性活度比值计)	
		5 min	120 min
3.7×10 ² (小剂量)	5	34.58±20.61	55.47±29.75
18.5×10 ² (中等剂量)	5	35.49±16.55	50.72±18.34
92.5×10 ² (大剂量)	5	33.24±14.73	44.82±21.55

2.4 ^{99m}Tc-PAHIDA 的排除形式与诊断使用的关系

实验所得色层分析宏观放射自显影像如图1所示。由图1可见无论机体由尾静脉弹丸注入^{99m}Tc-PAHIDA 后5 min收集的尿样,还是在120 min收集的尿样,色层分析放射自显影的观察结果都得到一个放射峰。从而可以证明^{99m}Tc-PAHIDA 经体内是由原形排除的^[6]。因此,不需要考虑肾显像剂^{99m}Tc-PAHIDA 在诊断使用过程中的分解问题。



A B
图1 机体由静脉弹丸注入^{99m}Tc-PAHIDA 后收集5 min和120 min尿液的色层分析放射自显影图
低温干燥曝光48 h。
A: 5 min尿样; B: 120 min尿样。

参加本项研究的还有王国林、赖冠华、杨占山、曹根发、杨淑琴和钟慎斌等同志。

参 考 文 献

- [1] Chervu L R, et al. J. Nucl Med., 1984, 25: 1111
- [2] Summerville D A, et al. J. Nucl. Med., 1987, 28, 907
- [3] 朱寿彭等. 中华骨科杂志, 1987, 7 (2): 140
- [4] 朱寿彭等. 核技术, 1991, 14 (11): 695
- [5] 朱寿彭等. 医用同位素示踪技术. 北京: 原子能出版社, 1989. 66
- [6] 朱寿彭等. 中国药理学报, 1981, 2 (4): 266

(京)新登字 077 号

图书在版编目(CIP)数据

肾显像剂^{99m}Tc-PAHIDA 的代谢特性与诊断使用 =
STUDY ON THE METABOLIC PECULIARITIES OF
RENAL RADIOTRACER ^{99m} Tc-PAHIDA AND DI-
AGNOSTIC USE/朱寿彭等著. —北京:原子能出版社,
1994. 11

ISBN 7-5022-1310-4

I. 肾… I. 朱… II. 肾显像剂-代谢特性-诊断使用
IV. R322. 2

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (94) 第 13365 号



原子能出版社出版发行

责任编辑:孙凤春

社址:北京市海淀区阜成路 43 号 邮政编码:100037

中国核科技报告编辑部排版

核科学技术情报研究所印刷

☆

开本 787×1092 1/16 · 印张 1/2 · 字数 7.5 千字

1994 年 11 月北京第一版 · 1994 年 11 月北京第一次印刷

CHINA NUCLEAR SCIENCE & TECHNOLOGY REPORT

This report is subject to copyright. All rights are reserved. Submission of a report for publication implies the transfer of the exclusive publication right from the author(s) to the publisher. No part of this publication, except abstract, may be reproduced, stored in data banks or transmitted in any form or by any means, electronic, mechanical, photocopying, recording or otherwise, without the prior written permission of the publisher, China Nuclear Information Centre, and/or Atomic Energy Press. Violations fall under the prosecution act of the Copyright Law of China. The China Nuclear Information Centre and Atomic Energy Press do not accept any responsibility for loss or damage arising from the use of information contained in any of its reports or in any communication about its test or investigations.

ISBN 7-5022-1310-4



9 787502 213107 >