

七. 放射性药物

放射性药物与普通药物之间的最基本的差别就是它含有放射性核素。放射性药物用放射性核素的半衰期比较短,多数是用加速器生产(见表 3-7)。放射性核素发生器是提供短半衰期医用放射性核素重要途径(见表 3-8)。

放射性药物和其他药物一样,在生产过程需要有符合 GMP要求的生成条件,在药品进入临床使用前要进行一系列的鉴定申报程序。

在放射性药物中,放射性核素既可以标记简单的无机化合物、胶体、树脂或玻璃微球等,也可以标记复杂的有机化合物、激素,甚至具有生物活性和免疫活性的抗体之类的大分子。放射性药物包括诊断性药物和治疗性药物。

1. 放射免疫试剂盒

放射免疫分析技术(RIA)是基于免疫分析的特异性与放射性测量的高灵敏性建立的一种超微量分析方法,能够定量检测生物体内活性物质如激素,肿瘤相关抗原,病毒等,成为现代生物、医学研究和临床诊断的重要手段。

在放射免疫分析中放射性示踪剂是这一技术的重要组成部分。绝大多数是用 ^{125}I 标记的示踪剂。

以酶、荧光、电化学发光、化学发光和生物发光等非同位素标记的免疫分析已逐渐取代放射性免疫分析。它具有货架期长,便于自动化检测,在灵敏度方面也可超过放射免疫分析,而且不用放射性同位素。

表 7-1 常用放射免疫分析试剂盒

甲状腺类

试剂盒名称	简称	用途	测定范围
三碘甲腺原氨酸	T ₃ -PR	甲状腺功能检测	0.8~12.3 nmol/L(0.5~8μ g/L)
甲状腺素	T ₄ -PR	甲状腺功能检测	25.7~309nmol/L(20~240μ g/L)
促甲状腺激素	TSH-PR	甲状腺功能检测	1.0~70mIU/L
游离三碘甲腺原氨酸	FT ₃ -PR	甲状腺功能检测	0.75pmol/L
游离甲状腺素	FT ₄ -PR	甲状腺功能检测	0.54~130pmol/L
3,3',5-三碘甲腺原氨酸	rT ₃ -PR	甲状腺功能检测	0.15~6.14nmol/L
甲状腺球蛋白	TG-PR	甲状腺功能检测	10~500 μ g/L
甲状腺激素(纸片)	T ₄ -M	新生儿甲低筛查	10~320 μ g/L
促甲状腺激素(纸片)	TSH-M	新生儿甲低筛查	5~160 mIU/L

糖尿病类

试剂盒名称	简称	用途	测量范围
胰岛素	Ins-PR	糖尿病诊断	5~160 mIU/L
胰高血糖素	Glu-PR	糖尿病、胰高血糖素瘤、胰岛素的鉴别诊断	25~1000 ng/L
C肽	C-P-PR	糖尿病分型及指导用药	0.2~12μ g/L
C肽	C-P-ACT	糖尿病分型及指导用药	0.1~30μ g/L
抗胰岛素抗体	Anti-Ins-PEG	测定人血清中抗胰岛素抗体,指导用药	50 μ l

肿瘤类

试剂盒名称		用途	测量范围
甲胎蛋白	AFP-PR	原发性肝癌的早期诊断和监测	10~400μ g/L
宽范围甲胎蛋白	AFP-PR	原发性肝癌的早期诊断和监测	10~1600μ g/L
甲胎蛋白	AFP-ACT	原发性肝癌的早期诊断和监测	5~800μ g/L
癌胚抗原	CEA-PR	消化道肿瘤特别是结肠癌的诊断及预后判断	5~80μ g/L
癌胚抗原	CEA-ACT	消化道肿瘤特别是结肠癌的诊断及预后判断	2.5~100μ g/L
铁蛋白	Fer-PR	缺铁性贫血, 肿瘤的早期辅助诊断	5~500μ g/L
前列腺特异抗原	PSA-PR	前列腺的早期诊断, 跟踪监测	2.5~100μ g/L
前列腺特异抗原	PSA-ACT	前列腺的早期诊断, 跟踪监测	0.3~40μ g/L
糖类抗原	CA-125	有助于卵巢癌的诊断和监测	13~400U/ml
糖类抗原	CA-50	有助于消化道肿瘤的诊断和监测	0.6~190 U/ml
糖类抗原	CA-15-3	有助于乳腺癌的诊断和监测	9.5~237 U/ml
糖类抗原	CA19-9	有助于消化道肿瘤的诊断和监测	13~245 U/ml

肾功能及肾上腺功能类

试剂盒名称	简称	用途	测量范围
α ₁ -微球蛋白	α ₁ -MG-PR	肾功能检测	25~800μ g/L
β ₂ -微球蛋白	β ₂ -MG-PR	肾功能监测	0.2~10mg/L
白蛋白	Alb-PR	肾功能监测糖尿病病变参考指标	1~32mg/L
免疫球蛋白 G	LgG-DAP	肾功能监测	1~50mg/L
免疫球蛋白 G	LgG-mS	肾功能监测	1~32mg/L
免疫球蛋白 A	LlgA-DAP	用于人尿、分泌液、体液即粪便中 SIgA 含量的测定	0.15~6.4mg/L
TH 糖蛋白	THP-PR	肾功能监测	50~2000μ g/L
醛固酮	ALD-PR	用于肾性高血压、醛固酮增多症疾病的诊断及疗效观察	139~5560pmol/L
皮质醇	F-mSDA	用于鉴别诊断与内分泌及代谢失常有关的一些疾病	10~600μ g/L

肝炎类

试剂盒名称	简称	用途	测量范围
乙肝表面抗原	HBsAg	乙肝表面抗原定性快速检测	血清 100μ l
乙肝表面抗体	HBsAb	乙肝表面抗原定性快速检测	血清 100μ l
乙肝 e 抗原	HBeAg	乙肝 e 抗原定性快速检测	血清 100μ l
乙肝 e 抗体	HBeAb	乙肝 e 抗体定性快速检测	血清 100μ l
乙肝核心抗体	HBcAb	乙肝核心抗体快速检测	血清 100μ l
乙肝表面抗原 表面抗体双检		乙肝表面抗原, 表面抗体双检	血清 200μ l
乙肝表面抗原 表面抗体双检		乙肝表面抗原定性快速检测	血清 200μ l
乙肝核心抗体免疫球蛋白 M	Anti-HBc IgM	乙肝表面抗原聚合人血清白蛋白	血清 1:1000 稀释, 200μ l

乙肝表面抗原聚合人血清白蛋白受体	HBsAg·PHSA·Re	受体定性检测	血清 200μ l
乙肝表面抗原免疫球蛋白 M	HBsAg·IgM	乙肝表面抗原免疫球蛋白 M 定性检测	血清 1:1000 稀释, 200μ l
乙肝核心抗原	HBcAg	乙肝核心抗原定性检测	血清 100μ l
甲肝抗体免疫球蛋白 M	Anti-HAV IgM	甲肝抗体免疫球蛋白 M 定性检测	血清 200μ l
丙肝抗体免疫球蛋白 G	Anti-HCV IgG	丙肝抗体免疫球蛋白 G 定性检测	血清 200μ l

生理、生殖、性激素类

试剂盒名称	简称	用途	测量范围
人绒毛膜促性腺激素	HCG-PR	早孕诊断, 滋养层细胞瘤的诊断及疗效观察	25~2000I U/L
β-亚基人绒毛膜促性腺激素	β-HCG-DAP	早早孕诊断	5~320I U/L
促黄体生成激素	LH-PR	性腺功能检测, 排卵检测	1.5~150I U/L
促卵泡生成激素	FSH-PR	性腺功能检测	1.25~40ml U/L
睾酮	T-mSDA	男性功能的评价	20~2000μ g/dL
孕酮	P-mSDA	妊娠研究	0.2~80μ g/L
雌二醇	E ₂ -PR	性腺功能检测	10~2000ng/L
雌三醇	E ₃ -mSDA	妊娠监测	10~400μ g/L
垂体泌乳素	PRL-PR	性腺功能检测, 特别用于诊断垂体泌乳素分泌性垂体瘤	120~2400mlU/L
胎盘催乳素	HPL-PR	妊娠监测	0.1~10ng/L

其他类

试剂盒名称	简称	用途	测量范围
心钠素	ANF-PR	心血管病的诊断及治疗监测	0.2~10μ g/L
胃泌素	Gastrin-DAP	胃泌素瘤诊断	25~1200ng/L
脱氧核糖核酸抗体	Anti-DNA	系统性红斑狼疮诊断	血清 25μ l
甘胆醇	CG-PR	肝功能早期检测	25~4000μ g/dL
血管紧张素 I	AngI -PR	原发性和继发性高血压分型、诊断及指导治疗用药	100~7800ng/L
血管紧张素 II	AngII -PR	原发性和继发性高血压分型、诊断及指导治疗用药	20~1800ng/L
人表皮生长因子	EGF-PR	胃癌诊断、预后判断及随访	2~80μ g/L
骨钙素	OC-PR	骨代谢研究	1~120μ g/L
降钙素	CT-PR	钙磷代谢研究, 某些癌症的诊断	30~1200ng/L
甲状旁腺素	PTH-M-PR	诊断甲状旁腺癌及骨代谢研究	0.2~10ng/L
瘦素	LEP-PR	早期高血脂症、脂肪肝等脂肪代谢紊乱的灵敏指标	0.25~160μ g/L
吗啡	MP-PR	用于吸毒人群的筛查	2.5~640μ g/L
冰毒	MAP-PR	用于吸毒人群的筛查	50~2000μ g/L

2. ^{99m}Tc 放射性药物

^{99m}Tc 放射性药物在临床核医学诊断中占主导地位，其用量约占临床诊断用放射性药物的 80%。 ^{99m}Tc 放射性药物不仅在临床上可以进行肿瘤阳性定位诊断，同时还可以进行脏器的动态观测，尤其对心脑血管系统疾病的动态研究最引人注目。

表 7-2 各种脏器显像用 ^{99m}Tc 药物

显像剂类别		^{99m}Tc 标记放射性药物名称
神经系统	脑血流灌注显像	锝—99m 伊沙美替($^{99m}\text{Tc}-\text{d,l-HMPAO}$)
		锝—99m 比西酯($^{99m}\text{Tc}-\text{l,l-ECD}$)
	脑肿瘤显像	锝—99m 司它比($^{99m}\text{Tc}-\text{MIBI}$)
	脑池显像	锝—99m 喷替酸($^{99m}\text{Tc}-\text{DTPA}$)
心血管系统	心肌灌注显像	锝—99m 司它比($^{99m}\text{Tc}-\text{MIBI}$)
		锝—99m 替曲膦($^{99m}\text{Tc}-\text{TF}$)
		锝—99m 替膦($^{99m}\text{Tc}-\text{TEBO}$)
		锝—99m N 核络合物($^{99m}\text{Tc}-\text{NOET}$)
	心肌梗塞显像	锝—99m 焦磷酸盐($^{99m}\text{Tc}-\text{PYP}$)
	测定心脏功能	锝—99m 红细胞($^{99m}\text{Tc}-\text{RBC}$)
呼吸系统	肺灌注显像	锝—99m 大颗粒聚合白蛋白($^{99m}\text{Tc}-\text{MAA}$)
		锝—99m 人血清白蛋白微球($^{99m}\text{Tc}-\text{HAM}$)
	肺通气显像	锝—99m 喷替酸气溶解($^{99m}\text{Tc}-\text{DTPA}$ 气溶胶)
消化系统	食道通过显像	锝—99m 硫胶体($^{99m}\text{Tc}-\text{SC}$)
	胃食道反流显像	锝—99m 硫胶体($^{99m}\text{Tc}-\text{SC}$)
	十二指肠—胃反流显像	锝—99m 二乙基依替非宁($^{99m}\text{Tc}-\text{EHIDA}$)
	消化道出血显像	锝—99m 硫胶体($^{99m}\text{Tc}-\text{SC}$)
		锝—99m 红细胞($^{99m}\text{Tc}-\text{RBC}$)
	肝胆动态显像	锝—99m 亚胺二乙酸类($^{99m}\text{Tc}-\text{IDAs}$)
		锝—99m 吡哆氨基类($^{99m}\text{Tc}-\text{PMT}$)
肝血流灌注和血池显像	高锝—99m 酸盐($^{99m}\text{TcO}_4^-$)	
	锝—99m 红细胞($^{99m}\text{Tc}-\text{RBC}$)	
	锝—99m 大分子右旋糖酐($^{99m}\text{Tc}-\text{DX}$)	
肝动脉灌注显像	原发性肝癌显像	锝—99m 大分子聚合白蛋白($^{99m}\text{Tc}-\text{MAA}$)
		锝—99m 吡哆氨基类($^{99m}\text{Tc}-\text{PMT}$)
	肝肿瘤显像剂	锝—99m 亚胺二乙酸类($^{99m}\text{Tc}-\text{IDAs}$)
		锝—99m 葡庚糖酸盐($^{99m}\text{Tc}-\text{GH}$)
泌尿生殖系统	肾脏动态显像	五价锝—99m 二巯基丁二酸($^{99m}\text{Tc}(\text{V})-\text{DMSA}$)
		锝—99m 二巯基丁二酸($^{99m}\text{Tc}-\text{DMSA}$)
		锝—99m 喷替酸($^{99m}\text{Tc}-\text{DTPA}$)
	高锝—99m 硫替肽($^{99m}\text{Tc}-\text{MAG}_3$)	
	肾灌注，功能和形态显像	锝—99m 葡庚糖酸盐($^{99m}\text{Tc}-\text{GH}$)

	睾丸血流灌注显像	锝—99m 盐酸($^{99m}\text{TcO}_4^-$)
	输卵管显像	锝—99m 大颗粒聚合血蛋白($^{99m}\text{Tc-MAA}$)
骨骼系统	骨骼显像	锝—99m 亚甲基二膦酸盐($^{99m}\text{Tc-MDP}$)
		锝—99m 1—羟基亚乙基二膦酸盐($^{99m}\text{Tc-HEDP}$)
		锝—99m 羟基亚甲基二膦酸盐($^{99m}\text{Tc-HMDP}$)
内分泌系统	甲状腺显像	高锝—99m 酸盐($^{99m}\text{TcO}_4^-$)
	甲状腺肿瘤显像	锝—99m 司他比($^{99m}\text{Tc-MIBI}$)
	甲状旁腺显像	锝—99m 司他比($^{99m}\text{Tc-MIBI}$)
血液系统	骨髓显像	高锝—99m 硫胶体($^{99m}\text{Tc-SC}$)
		锝—99m 抗 NCA—95 抗体($^{99m}\text{Tc-NCAA}$)
		锝—99m 抗粒细胞抗体($^{99m}\text{Tc-BW250/183}$)
	脾显像	锝—99m 植酸盐($^{99m}\text{Tc-PHY}$)
		锝—99m 硫胶体($^{99m}\text{Tc-SC}$)
		锝—99m 热变性红细胞($^{99m}\text{Tc-HD--RBC}$)
淋巴系统	淋巴显像	高锝—99m 硫化锑胶体($^{99m}\text{Tc-ASC}$)
		锝—99m 微胶体($^{99m}\text{Tc-nanocolloid}$)
		锝—99m 硫胶体($^{99m}\text{Tc-SC}$)
		高锝—99m 右旋糖酐 (葡聚糖) ($^{99m}\text{Tc-Dx}$)

表 7-3 其他诊断类放射性药物

药物名称	用途
枸橼酸 (^{67}Gd) 注射液	软组织肿瘤、淋巴瘤黑色素瘤等显像与炎症显像
碘 (^{131}I) 化钠口服液	诊断和治疗甲状腺疾病, 制备 ^{131}I 标记物
邻碘 (^{131}I) 马尿酸注射液	肾功能检查
碘 (^{131}I) 化钠胶囊	甲状腺功能检查
^{14}C 尿素	诊断胃中幽门螺旋杆菌

3. 治疗用放射性药物

按摄取机制的不同, 治疗用放射性药物可分成三类: 毛细血管栓塞及细胞吞噬性机制; 受体/配基, 抗原/抗体等特异结合机制; 人体天然底物或可参与代谢机制。

表 7-4 按摄取机制分类的若干治疗药物

摄取机制	治疗药物	主要用途
毛细血管栓塞及 细胞吞噬	^{131}I —碘油	肝肿瘤治疗
	^{32}P —TGMS	肝肿瘤治疗
	^{90}Y —GTMS	肝肿瘤治疗
	^{166}Ho 树脂	肝肿瘤治疗
	$\text{Cr}^{32}\text{P O}_4$ 胶体	肿瘤手术后注射和腹腔注射等
	^{198}Au 胶体	肿瘤手术后注射和腹腔注射等
	^{90}Y —Citrate 胶体	肿瘤手术后注射和腹腔注射等
	^{166}Ho —FHMA	肿瘤手术后注射和腹腔注射等

	$^{186/188}\text{Re}_2\text{S}_7$ 胶体	肿瘤手术后注射和腹腔注射等
抗原/抗体	^{131}I —CEA	结肠癌, 甲状腺髓样癌
受体/配体	^{131}I —3H11	胃癌
生物素/亲和素	^{131}I —HAb18	肝癌
	^{131}I —Rc--160	类癌瘤
	^{90}Y —DOTA-- 多肽 ; ^{131}I —MIBG	嗜铬细胞瘤
	^{111}In —DOTA 生物素/亲和素	肿瘤治疗
人体天然底物或参与代谢	Na^{131}I	甲抗、甲状腺癌
	$\text{Na}^{32}\text{PO}_4$	骨髓瘤
	$^{89}\text{SrCl}_2$	骨转移癌
	$^{188/186}\text{Re}$ —HEDP	骨转移癌
	^{153}Sm —EDTMP	骨转移癌
	^{90}Y —EDTMP	骨转移癌
	^{153}Sm —HA	风湿关节滑膜切除
	^{131}I —IUDR	骨癌, 绒毛膜癌

表 7-5 放射性药品在成年人组织、器官的剂量
单位 pGy/Bq)

放射性药品名 (简称)	卵巢	精囊	红骨髓	乳房	甲状腺	肺
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -Pertechnetate	2.19	2.07	2.32	0.888	12.2	2.66
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -MDP	2.29	1.90	7.65	1.87	2.17	2.54
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -Coloidal Sn hydroxide	1.29	3.06	3.80	4.51	0.529	6.33
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -Phytic acid	1.29	3.06	3.80	4.51	0.529	6.33
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -Albumin	1.24	0.487	4.56	5.07	1.74	68.1
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA	0.983	0.669	1.12	0.390	0.710	0.934
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -HIDA	17.6	2.39	19.4	5.56	2.61	4.81
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -PYP	6.75	3.68	8.95	2.08	1.46	1.76
$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -MAA	0.889	0.569	2.85	4.27	1.73	63.0
^{131}I -Adosterol	224	180	93.3	27.0	7253	210
^{131}I -Hippurate	0.649	0.332	0.510	0.272	0.343	0.554
^{131}I -HSA	438	350	161	43.6	338	359
^{131}I -NaI	39,4	30.9	62.5	62.8	6.17×10^5	123
^{123}I -NaI	2.76	2.24	8.30	1.86	5850	4.50
^{67}Ga -Cirate	46.0	36.2	38.9	12.7	39.5	46.3
^{201}Tl -Chloride	38.6	91.7	38.9	7.83	123	9.47
^{75}Se -Selenomethionine	1105	876	1360	694	1480	1620
^{133}Xe -IV	0.443	0.362	0.256	0.100	0.406	32.2
^{233}Xe -Gas	0.443	0.362	0.256	0.100	0.406	32.2
$^{113\text{m}}\text{In}$ -DTPA	48.0	13.8	85.0	35.0	13.2	38.2

¹¹¹ In-Chloride	23.8	19.0	56.9	8.74	20.5	24.5
^{81m} Kr-Generator	4.98	4.02	1.63	0.593	4.31	4.62
⁸¹ Kr-Gas	0.0291	0.0115	0.0472	0.0800	0.0203	0.677
⁵⁹ Fe-Ferric citrate	1.69x10 ³	3.64x10 ⁴	2.32x10 ³	1.98x10 ³	8.69x10 ²	5.76x10 ³
组织权重因数 W _T	0.25	0.25	0.12	0.15	0.03	0.12

续表 7-5 放射性药品在成年人组织、器官的剂量
(单位 pGy/Bq)

放射性药品名 (简称)	骨表面	肝	肾	脾	肾上腺	大肠上部
^{99m} Tc-Pertechnetate	4.16	3.55	3.15	3.75	2.90	2.15
^{99m} Tc-MDP	13.8	2.90	2.61	2.54	3.01	2.01
^{99m} Tc-ColoidalSn hydroxide	5.84	105.6	10.8	74.1	11.8	6.13
^{99m} Tc-Phytic acid	5.84	105.6	10.8	74.1	11.8	6.13
^{99m} Tc-Albumin	5.69	7.20	45.3	9.54	1422	2.21
^{99m} Tc-DTPA	1.80	1.70	25.2	2.16	2.38	1.06
^{99m} Tc-HIDA	3.42	33.5	8.68	4.27	7.39	205
^{99m} Tc-PYP	16.0	1.56	10.5	1.63	2.51	1.43
^{99m} Tc-MAA	4.18	11.2	2.44	3.85	4.76	1.24
¹³¹ I-Adosterol	251	262	229	265	13860	144
¹³¹ I-Hippurate	1.35	1.33	123	2.38	3.09	0.900
¹³¹ I-HSA	449	448	376	450	443	266
¹³¹ I-NaI	356	56.3	40.7	54.9	59.1	25.4
¹²³ I-NaI	16.3	4.31	3.16	3.83	3.51	2.27
⁶⁷ Ga-Cirate	79.9	117	89.8	151	60.0	36.1
²⁰¹ Tl-Chloride	70.2	127	228	45.3	48.5	37.0
⁷⁵ Se-Selenomethionine	2280	5790	4290	3180	2000	1170
¹³³ Xe-IV	1.19	0.562	0.417	0.580	0.571	0.253
²³³ Xe-Gas	1.19	0.502	0.417	0.580	0.571	0.253
^{113m} In-DTPA	107	135	4760	283	344	95.5
¹¹¹ In-Chloride	103	38.9	28.9	32.6	29.8	21.8
^{81m} Kr-Generator	3.92	5.73	4.79	5.71	5.58	3.22
⁸¹ Kr-Gas	0.162	3.78	0.153	0.0552	0.204	0.0970
⁵⁹ Fe-Ferric citrate	5.36x10 ³	3.55x10 ⁴	2.20x10 ⁴	4.77x10 ⁴	7.20x10 ³	2.98x10 ³
组织权重因数 W _T	0.03	0.06	0.06	0.06	0.03	0.06

4. 放射源在医疗中的应用

4.1 远距离 γ 射线治疗

远距离 γ 射线治疗是针对深部肿瘤。由装有强钴—60源(3~12kCi)发射的射线束集中

照射病变部位，进行治疗。为了使射线进入病灶前轨迹处剂量是可以接受的量，装有放射源的辐照头是旋转的。

γ 刀，也是一种远距离辐照治疗装置。它用 200 多个源从不同点发出的射线聚焦在病灶处（瑞典设计），或者用 20 几个源旋转聚焦在病灶（中国设计）。这些设计的目的就是使射线在经过非病灶区的剂量尽可能小，不会引起辐射损伤，而聚焦在病灶区达到预计的剂量。

加速器发射的 X 射线聚焦好，能量可调，对深部与浅部肿瘤均能适用。

4.2 近距离放射治疗

近距离放射治疗是把密封源紧贴病变部位进行外照射治疗。这种治疗分为腔内治疗，间质治疗和浅皮治疗。

腔内治疗是先把治疗头定位在病灶区，然后把源送入治疗头，定时控制近距离照射。一般用 γ 能量比较低的铯—192 或铱—252 中子源。

间质治疗是把源按所设计的几何布置直接插植在人体肿瘤部位。间质插植可以是暂时性的，也有永久性的，碘—125 “粒籽源” 采用的比较多。

浅皮治疗如常用的 β 敷贴器治疗皮肤病。

近年探索 BNCT 治癌技术，把含硼药物注入到病灶区，再用中子轰击硼，发生 $^{10}\text{B} + \text{n} \rightarrow \alpha + ^7\text{Li} + 2.4\text{MeV}$ 反应，发射的 α 粒子杀死周围的癌细胞。此项技术的实现需要解决含硼药物的合成和提供中子辐照条件。