

利用医学“核弹”实现精准抗癌

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/31796.html>

本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

利用医学“核弹” 实现精准抗癌

。放射性核素能不断“放射”出具有一定能量的射线（粒子），成为临床上击杀肿瘤细胞的有效武器。

“肿瘤放疗过程中利用庞大的设备产生质子、重离子等介质在体外对付肿瘤，花费巨大。如果可以让放射性药物定向进入体内，不仅可以做到精准，也会大大降低诊疗的费用。”近期，香山科学会议第773次学术讨论会召开，中国科学院院士、中国科学院高能物理研究所研究员柴之芳在会上说。

“放射性药物利用放射性核素或其标记化合物实现对疾病的诊断和治疗，是肿瘤精准诊疗的新手段，未来有望成为肿瘤治疗的主要方向之一。”中国科学院院士、国家纳米科学中心研究员陈春英表示。

多位与会专家表示，新技术的诞生，推动了放射性药物的创新研究，将促进越来越多的放射性药物走进诊疗一线，对疑难杂症患者实施精准诊疗。

结合新技术发挥巨大潜能

“镥177氧奥曲肽、镥177特昔维匹肽等一系列药物的获批上市，激发了放射性药物的研发热潮。”中国同辐研究院院长杜进介绍，在靶点、核素、配体及新技术的探索等诸多方面，放射性药物的创新研发呈现出新颖、多样的特点，国际上的放射性药物研发管线近年来持续增长。

柴之芳表示，精准靶向技术能面向目标病灶，使放射性药物在目标部位释放核素，从而大幅提高治疗效率、降低副作用，这让放射性药物迎来新的发展机遇期。资料显示，诺华公司2021年7月宣布完成3期临床的靶向放射配体疗法镥177特昔维匹肽，于2022年3月获美国食品药品监督管理局批准，用于治疗前列腺癌。该药获批次年的销售额已占全球放射性药物市场的重要份额。国家药品监督管理局药品审评中心官网公示显示，该药在我国的上市申请于2024年获受理。

此外，随着正电子发射断层成像（PET）及多模态成像技术的广泛应用，也使得放射诊疗一体化成为可能。杜进解释，以碘元素体系下不同同位素的利用为例，借助该技术，碘-123发射 γ 射线可做单光子发射断层成像诊断，碘-131发射 β 射线可用于治疗。医生既能利用不同同位素的成像特性进行精准诊断，又能利用同位素的放射性进行治疗，可以大大提高诊疗效率，减少患者痛苦。

。

北京大学化学与分子工程学院、昌平实验室教授刘志博认为，要推进适合中国国情的放射性药物研发。如果能通过产学研用合作、技术融合创新等路径使核素成本大幅降低，放射性药物的经济性将大大提高，有望成为面向广大患者精准治疗方式的首选。

推进核素研发和临床应用

放射性核素作为斩断病灶的“利剑”，目前分为3类：第一类能发射低能 γ 射线，如碘-125等；第二类能发射 β 粒子（一种高速电子），如钇-90、镥-177、碘-131等；第三类能发射 α 粒子（氦离子核），如砒-211、锕-225等。

选用哪种放射性粒子与疾病的特性、临床需求息息相关。例如，相较于发射 γ 射线的核素，发射 β 粒子的核素穿透性稍差，但其线性能量转换系数高，因此 β 粒子更能有效杀伤肿瘤。

随着放射性核素技术的发展，现在科学家正在研发能发射 α 粒子的新核素。“ α 粒子由于能量输出更高，穿透距离更短，较适合治疗小型肿瘤或微转移肿瘤。”杜进介绍，2024年2月，美国食品药品监督管理局授予AlphaMedix（一种 α 核素靶向疗法）突破性疗法认定，该疗法用于治疗胃肠胰神经内分泌瘤。

在我国，核素的临床应用研究也在持续推进。西南医科大学附属医院核医学科主任、教授陈跃表示，其团队用自主设计合成能发射 α 粒子的锕225药物可治疗多种骨肿瘤转移，这显示了能发射 α 粒子的核素具有临床安全有效应用的潜力。

弥补“久”“快”难以兼得的短板

“以肿瘤为例，目前涉及放射治疗诊断学的治疗策略仅对30%—60%的患者有效。”陈春英说，肿瘤细胞在放射性射线或粒子的照射下会出现代谢改变、DNA损伤主动修复等“抵抗活动”，进而导致放射性药物的效果降低，甚至出现其他毒副作用。例如，病灶部位化学性质的改变造成核素扩散，损伤正常组织。

放射性药物在血液中循环时也会因放射性造成杀伤正常细胞的毒副作用。“换句话说，放射性药物的药代动力学要满足肿瘤滞留久和血液中清除快的‘一久一快’要求。”刘志博介绍，传统的药物设计思路是通过延长血液循环增加药物的肿瘤摄取和滞留，“久”和“快”难以兼得。

针对当前放射性药物的短板问题，《医用同位素中长期发展规划（2021—2035年）》也提出，要加快新型介入给药技术的研究，提升放射性药物的效能。

作为载体的纳米“货车”天生具备精准特性。“科研人员通过调控尺寸、形状、表面修饰等，可构建肿瘤特异性靶向的纳米载体，显著提高核素在肿瘤部位的富集。”陈春英说，而通过自组装、原位化学响应设计等手段，则可以显著提升核素在肿瘤部位的滞留时间。此外，结合纳米技术开发新型纳米核素载体还能在最大程度上降低核素对邻近正常组织的辐射损伤。

“通过调控纳米载体的稳定性，未来甚至可能让载体变身‘垃圾清理车’，促进放射性核素衰变后产物在体内的清除，进一步减少毒副作用。”陈春英表示。

多位与会专家表示，作为一种癌症、心血管系统疾病、神经退行性疾病等的治疗方法，我国原创放射性药物当前仍在期待新的突破。在加速放射性药物发展方面，我国在新型医用同位素、放射性药物原创性研究、临床应用、申报与监管方面仍有较大提升空间。

作者：张佳星 来源：科技日报

更多 科学进展 请访问 <https://www.iikx.com/news/progress/>

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，[爱科学iikx.com](https://www.iikx.com)转发