

放射性药品生物分布测定法

本法系采用实验用鼠测定放射性药品生物分布的方法。通常将适量的放射性药品按规定的给药途径，对指定的动物模型给药，间隔一定时间处死动物，解剖取出靶器官和相关非靶器官，测定各脏器或组织的放射性量，计算其占给药剂量的百分比。

一、试验动物

供试用鼠，应品系明确，健康、来源清楚，且未做过其他可能会干扰结果的试验。除另有规定外，小鼠体重一般为 20~30 克，大鼠体重一般为 150~250g，豚鼠（尤其用于心脏疾病诊治的放射性药物）一般不少于 250 克。实验动物、环境及设施，应符合国家相关要求。

二、测定法

除另有规定外，取实验用鼠 5 只，称重，放入固定器内，使鼠尾暴露在外，用 75% 的乙醇或温水擦拭鼠尾，使血管扩张。用注射器吸取规定体积和规定剂量的供试品溶液（必要时进行适当稀释，以符合仪器的检测范围要求），置于合适的仪器中测量注射取用的放射性总量（x）。将供试品溶液经尾静脉注入动物体内，记录注射时间，必要时可用红外线灯将样品加热至室温。除另有规定外，注射体积通常为 0.1~0.2ml，注射剂量可根据人用剂量，按动物与人体间的等效剂量进行换算。

注射后，拔出针头，立即用棉签压迫止血，防止药液外渗。在注射部位止血后，将实验用鼠编号，放入单独的鼠盒中（注意防止排泄物污染动物体表）。测量注射后空注射器的放射性量（y）和止血棉签的放射性量（z）。

按规定间隔时间，处死动物，进行解剖。取出规定的脏器，如肝、肺、胃、肠、肾和骨等，清除脏器表面的血液后，放入试管中，备测。若有必要，先经心脏穿刺将血液收集于肝素抗凝杯中，记录血液样本的重量（Ws），再行解剖。

用合适的仪器测量各样本的放射性量，经衰变校正后（通常校正至注射时间），根据以下公式计算待测组织或脏器的放射性摄取量（%）：

$$100 \times (A/B)$$

式中 A 为待测组织或脏器的净放射性量；

B 为注入动物体内的净放射性量，为注射取用的放射性总量减去注射后空注射器和止血棉签的放射性量（x - y - z）。

血液的放射性摄取量（%），按以下公式计算：

$$[100 \times (C/W_s) \times 0.07 \times W_r] / B$$

式中 C 为血液样本的放射性量；

Ws 为血液样本的重量，g；

Wr 为动物体重，g，通常血液约占动物体重的 7%。

待测样品在每克组织或脏器中的放射性摄取量，为特定组织或脏器的放射性摄取量（%）除以该组织或脏器的湿重（g）。

当用大鼠进行试验时，需自注射位点上方剪断尾部，取尾部测定放射性量，在计算注入大鼠体内的净放射性量时扣除。

测量用仪器通常为活度计、γ 计数器或钨分析仪。所用仪器需定期校准，并在校准有效期

内使用。需在仪器测量的线性范围内使用， γ 计数器或钨分析仪需考察测量效率，以进行必要的放射性计数和放射性活度的换算。

三、结果判断

除另有规定外，5 只动物中，至少有 4 只应符合各品种项下的标准规定。若注射时或在测定组织、脏器时发现放射性药液渗出，应另取动物试验。

征求意见稿