

29P1-am286

MeO-PEG amine-PLA block copolymer / PLAを基剤としたナノパーティクル-粒子特性と体内分布-

○笹津 備尚¹, 大西 啓¹, 町田 良治¹(¹星薬大)

【目的】これまでの検討で、ナノパーティクル(NP)に封入した脂溶性蛍光色素である DiD が投与後に NP から引き抜かれている可能性が考えられた。そこで NP のコアの部位から放出され難い標識 (PLA-Pyrene) を設計し、その標識を封入した NP と DiD 封入 NP の体内挙動について比較検討を行った。

【方法】NP の基剤として結合体 PLA-(MeO-PEG) を合成した。また標識としてアミノピレンを選択し、PLA と結合させ PLA-Pyrene を得た。溶媒拡散法により、PLA-Pyrene 及び DiD を封入した NP (PLA-Pyrene-NP、DiD-NP) を調製し、NP の粒子径、標識含有率および封入効率を測定した。次に PLA-Pyrene-NP、DiD-NP を正常マウス及び担癌マウスに尾静脈内投与し、体内分布を調べた。

【結果、考察】PLA-Pyrene-NP と DiD-NP 投与後、1 時間値において脾臓や肝臓で DiD の分布がより高い結果を得た。DiD-NP では DiD が NP から引き抜かれ、それが分布した可能性が高いと考えた。また、粒子径約 160 nm と約 220 nm の PLA-Pyrene 封入 NP とを比較したところ、約 220 nm の NP の方が脾臓を主とする各臓器への取り込み量が多かった。さらに、NP は血漿からの消失よりも腫瘍組織からの消失が遅いことがわかり、NP がより長く腫瘍組織に留まることが考えられた。以上のことより、この NP は腫瘍組織へのターゲティングに利用できる可能性が示された。また、PLA-Pyrene は NP の体内挙動のモニタリングにおける標識体として有用であることが見出された。