

中華民國專利公報 [19] [12]

[11]公告編號：386034

[44]中華民國 89年(2000) 04月01日

發明

全 9 頁

[51] Int.Cl⁰⁶: A61K49/00

[54]名稱：影像造影劑

[21]申請案號：086100425

[22]申請日期：中華民國 86年(1997) 01月16日

[72]發明人：

羅俊光

張建文

新竹市光復路二段二二七號

台中市大墩路九七一號

[71]申請人：

國立清華大學

新竹市光復路二段一〇一號

[74]代理人：蔡清福 先生

1

2

[57]申請專利範圍：

- 1.一種影像造影組合物，其係包含脂溶性金屬紫質錯合物(metalloporphyrin)與一界面活性劑，其中該金屬係為釷(Gd)且該紫質係為5,10,15,20-四苯基-21H, 23H-紫質(5,10,15,20-tetraphenyl-21H, 23H-porphyrin)。
- 2.如申請專利範圍第1項之影像造影組合物，其係為一核磁共振造影劑。
- 3.如申請專利範圍第2項之影像造影組合物，其中該金屬釷(Gd)係為順磁性金屬。
- 4.如申請專利範圍第1項之影像造影組合物，其中該影像造影劑係用於代謝或儲存油溶性物質之器官。
- 5.如申請專利範圍第4項之影像造影組合物，其中該代謝或儲存油溶性物質之器官係為肝臟。
- 6.如申請專利範圍第4項之影像造影組合物，其中該代謝或儲存油溶性物質之器

- 7.如申請專利範圍第1項之影像造影組合物，其中該界面活性劑係包覆於該脂溶性金屬紫質錯合物(metalloporphyrin)之外。
 5. 8.如申請專利範圍第1項之影像造影組合物，該界面活性劑係為蓖麻油(cremopher EL)。
- 圖式簡單說明：
10. 第一圖係本案較佳實施例之化學結構圖；
 - 第二圖係本案較佳實施例之化學結構外加界面活性劑後之示意圖；
 - 第三圖係本案之四苯基紫質乙醯丙酮釷-蓖麻油微膠粒(Gd(acac)TPP-cremophor micelles)之紫外光-可見光光譜圖；
 15. 第四圖係本案四苯基紫質乙醯丙酮釷-蓖麻油微膠粒之紫外光-可見光光譜圖之放大圖；

釐、0.75mL 蓖麻油(cremopher-EL)、0.1mL酒精及2.5mL水混合而得之四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒之粒徑分析；

第六圖係5mg四苯基紫質乙醯丙酮釐、0.375mL 蓖麻油、0.1mL 酒精及2.5mL 水混合而得之四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒之粒徑分析；

第七圖係5mg四苯基紫質乙醯丙酮釐、1.5mL 蓖麻油、0.1mL 酒精及2.5mL 水混合而得之四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒之粒徑分析；

第八圖係為四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒在不同pH水溶液相對於正辛醇間之分配係數；

第九圖係為不同濃度之四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒之縱向弛緩係數及橫向弛緩係數；

第十圖係為四苯基紫質乙醯丙酮釐153－蓖麻油微膠粒注射於肝腫瘤大白鼠4、24、48、72小時後在其肺臟、心臟、血液、肌肉中之生物分佈；

第十一圖係為四苯基紫質乙醯丙酮釐153－蓖麻油微膠粒注射於肝腫瘤大白鼠4、24、48、72小時後在其肝臟、脾臟、肝腫瘤、腎臟中之生物分佈；

第十二圖係為肝腫瘤大白鼠注射四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒後之磁共振造影(A組劑量：3 μ mole/kg；B、C、D為空白對照組)；

第十三圖係為肝腫瘤大白鼠注射四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒後之磁共振造影(劑量：A組0.6 μ mole/kg；B組1.5 μ mole/kg、C組3 μ mole/kg、D μ mole/kg為空白對照組)；

第十四圖係T1值(縱向弛緩時間)與四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒劑量之關係圖；

第十五圖係四苯基紫質乙醯丙酮釐153－蓖麻油微膠粒注射於皮下腫瘤小白鼠後4、24、48、96、120小時後在其體內肝臟、脾臟、腎臟之生物分佈；

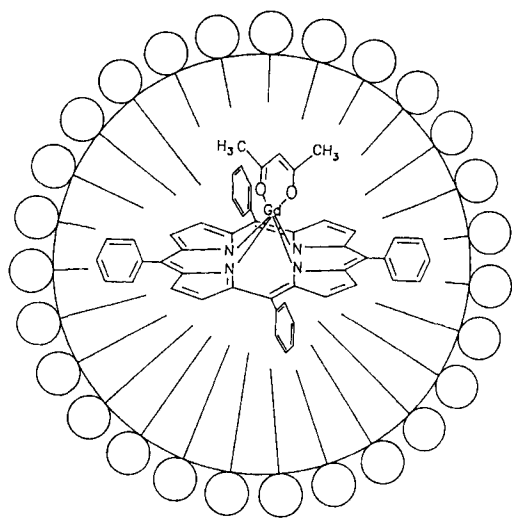
第十六圖係四苯基紫質乙醯丙酮釐153－蓖麻油微膠粒注射於皮下腫瘤小白鼠後4、24、48、96、120小時後在其體內肺臟、血液、肌肉、脾下腫瘤、心臟之生物分佈；

第十七圖係皮下腫瘤小白鼠注射四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒後之磁共振造影(劑量：A組：空白對照組；B組：9 μ mole/kg、C組：36 μ mole/kg)；

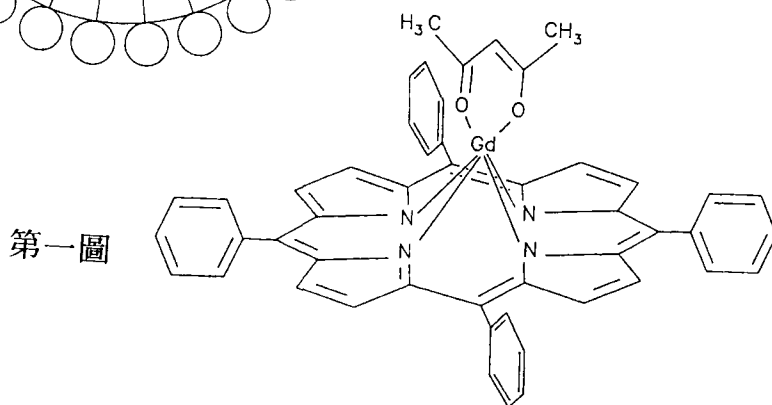
第十八圖係注射四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒(劑量：6 μ mole/kg)之大白鼠之GPT與GOT值(單位：U/L)與時間之關係圖；以及

第十九圖係注射四苯基紫質乙醯丙酮釐－蓖麻油微膠粒(劑量：6 μ mole/kg)之小白鼠白鼠之GPT與GOT值(單位：U/L)與時間之關係圖。

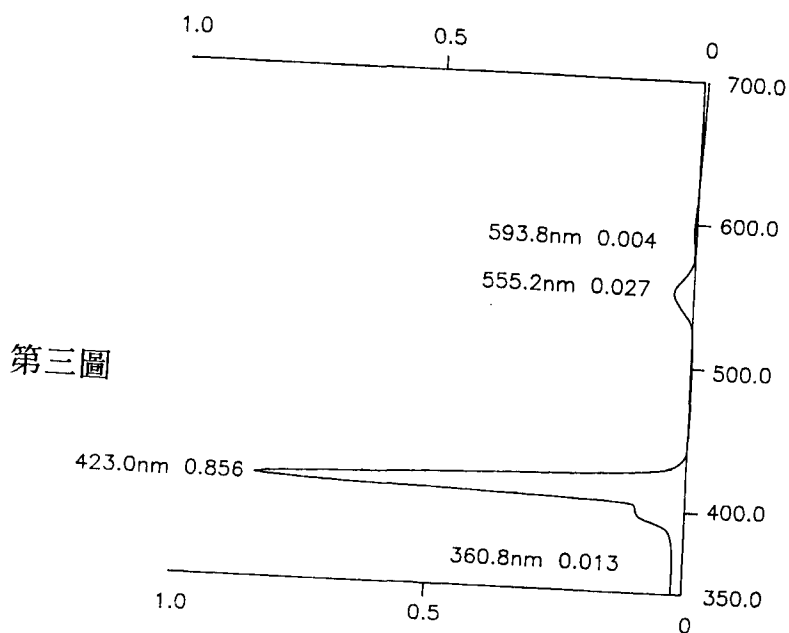
(3)



第二圖

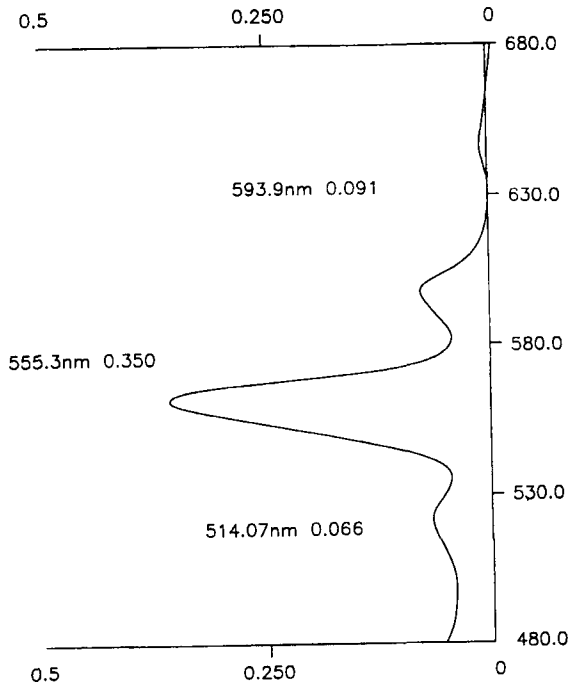


第一圖



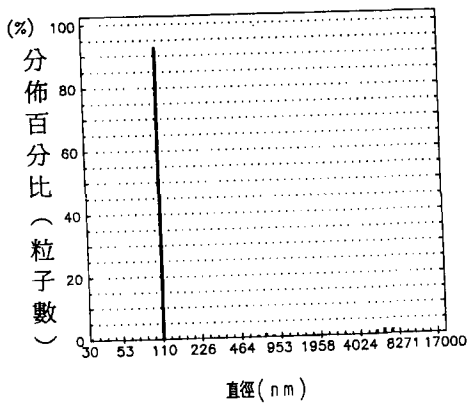
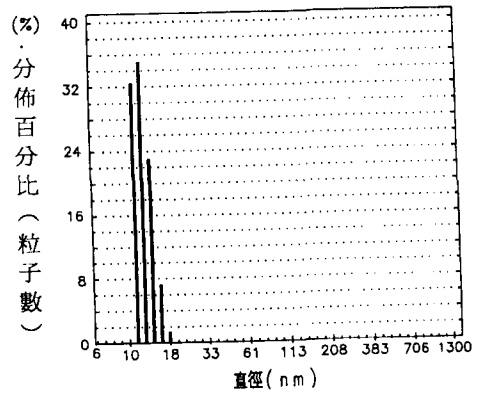
第三圖

(4)



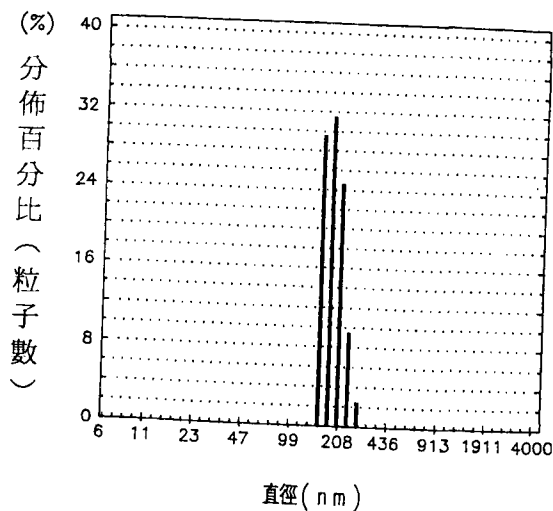
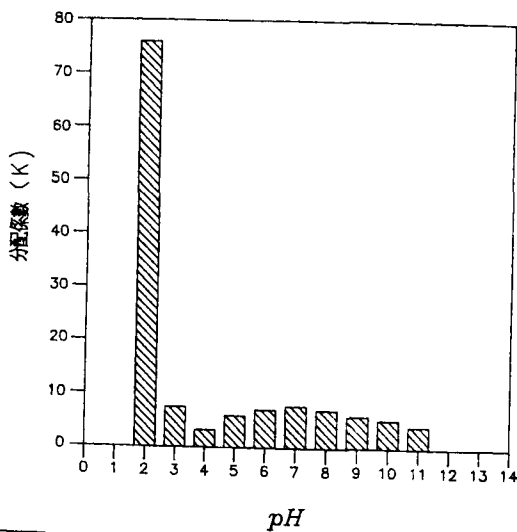
第四圖

第五圖



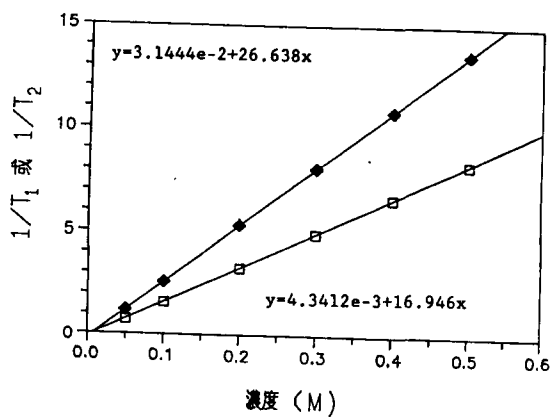
第六圖

第八圖

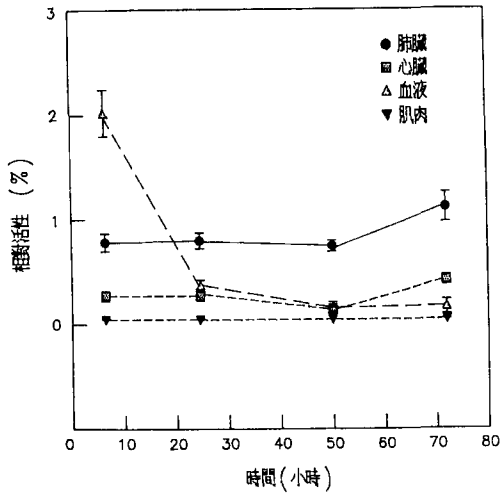


第七圖

第九圖

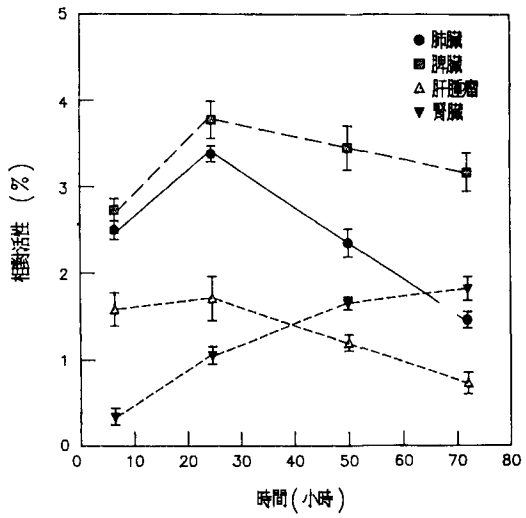


(6)

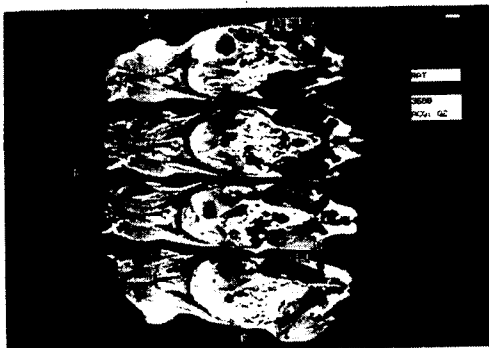


第十圖

第十一圖

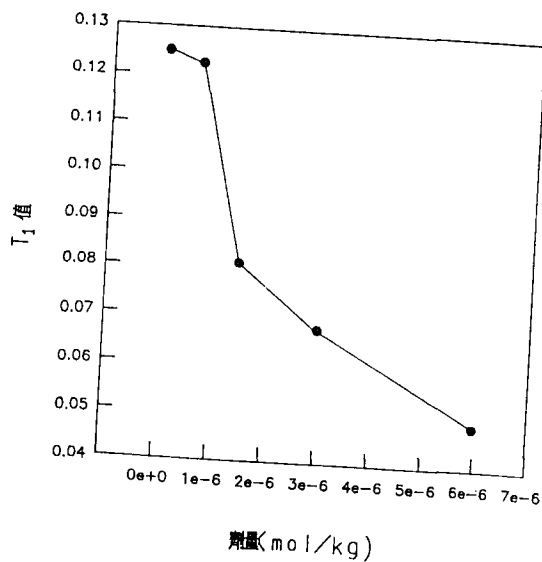
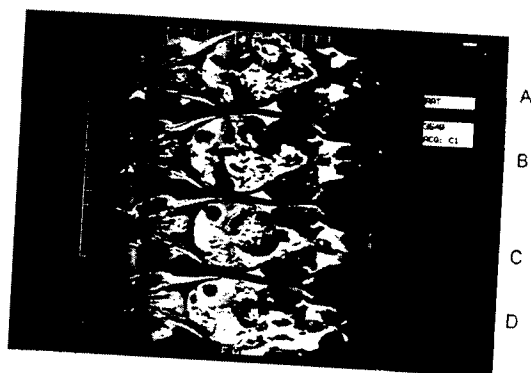


第十二圖



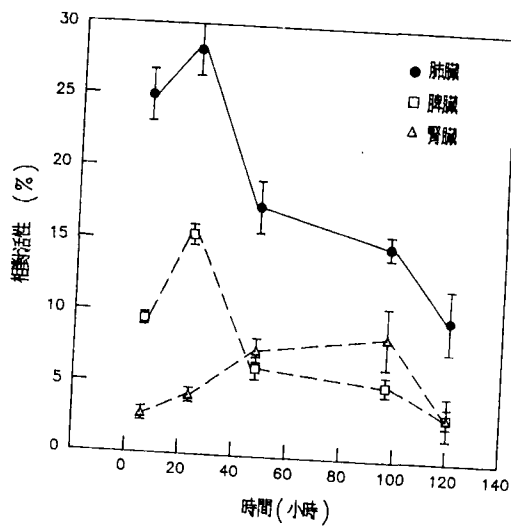
(7)

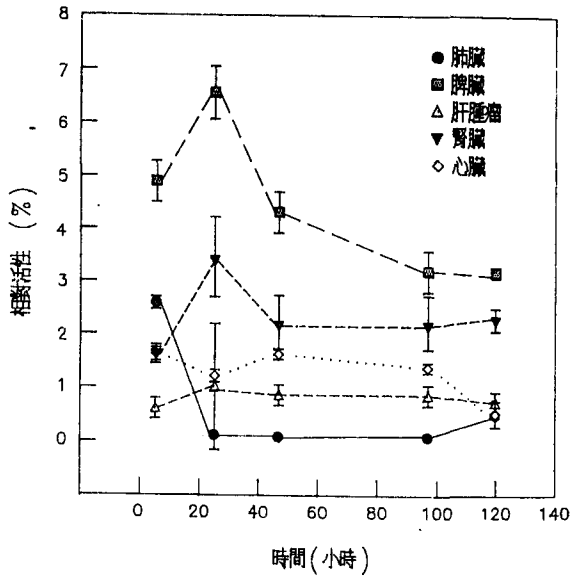
第十三圖



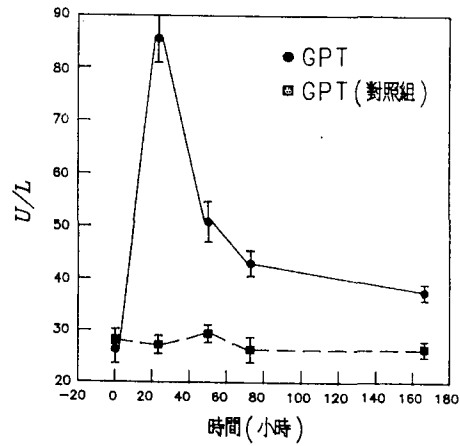
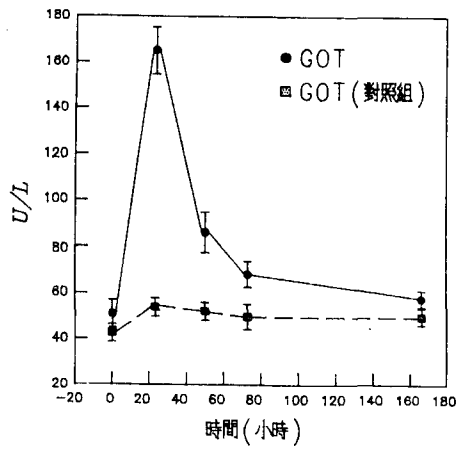
第十四圖

第十五圖



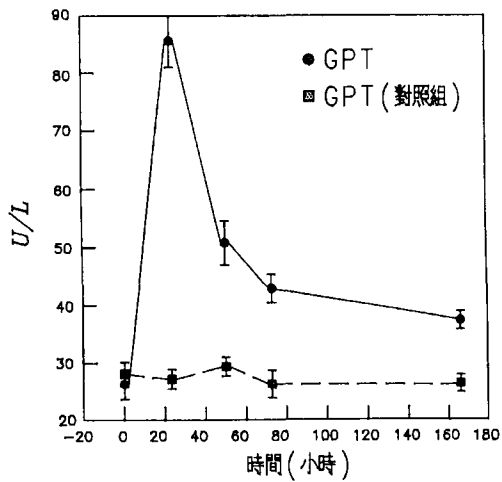
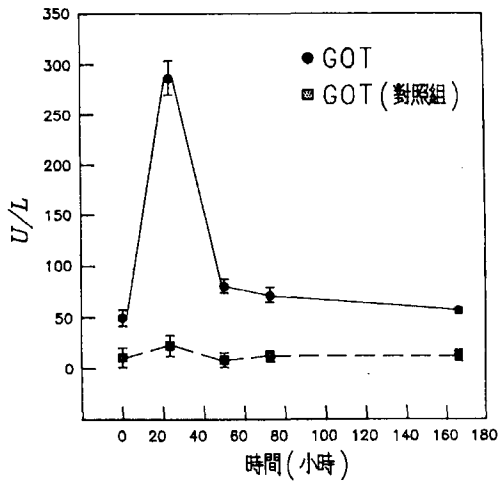


第十六圖



第十八圖

第十七圖



第十九圖

