

合肥研究院研制出针对慢性白血病靶向药物的长效纳米制剂

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/10816.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！

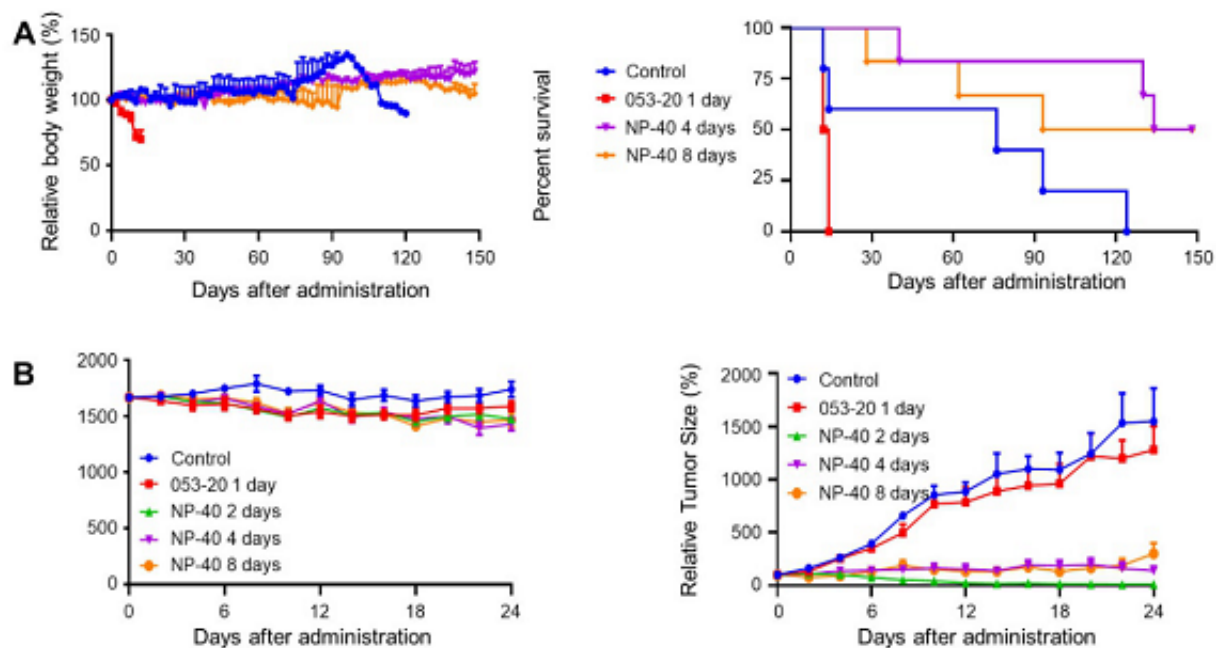
近日，中国科学院合肥物质科学研究院健康与医学技术研究所研究员刘青松、刘静团队在针对BCR-ABL突变的激酶靶向药物制剂领域取得进展，发展了一种长循环高选择性纳米制剂，可以有效延长给药周期，提高药物安全性。目前该成果在线发表于国际学术期刊*Nanomedicine: Nanotechnology, Biology and Medicine*上。

慢性粒细胞白血病（CML）是一种由9号染色体Abelson（ABL）基因与3号染色体上的BCR基因易位引起的克隆性造血干细胞骨髓增生性疾病。FDA批准的伊马替尼、尼罗替尼等多靶点激酶抑制剂尽管提高了患者的10年生存率，但是它们的脱靶效应会导致胸腔积液、骨髓抑制、血小板减少等副作用。研究团队前期自主研发的高选择性激酶抑制剂CHMFL-ABL-053针对BCR-ABL基因有更高的选择性，对DDR1/2、c-Kit靶点没有抑制作用。但是像其他的靶向药物一样，由于半衰期较短，必须天天用药，不仅增加了病患的经济负担，还会导致高频度用药引起的累积性毒性。

近年来，研究表明，纳米技术在改善小分子成药性和长效性方面具有巨大优势，因此研究团队利用纳米技术将CHMFL-ABL-053键连到两亲性聚合物上，并自组装成高负载率（约10.3%）的纳米制剂。研究表明，这种纳米制剂提高了CHMFL-ABL-053的溶解度，并将其循环半衰期从~5.3小时大幅延长至~117小时（>20倍）。在150天的小鼠长期血液瘤模型实验中，纳米制剂给药组在长周期给药间隔（4天或8天静脉注射一次）下，相比较于口服抑制剂组表现出了更好的存活率以及更低的毒性。此外，在皮下实体瘤模型中，纳米制剂在长注射周期下同样对肿瘤生长表现出了良好的抑制作用。这种长效纳米制剂可为BCR-ABL阳性CML患者提供一种潜在的、安全有效的治疗策略。

该研究成果获得了中科院战略重点研究计划、安徽省自然科学基金、中科院前沿科学重点研究计划、合肥研究院院长青年火花基金、合肥研究院十三五规划重点项目等项目的支持。

[论文链接](#)



(A) 血液瘤和 (B) 实体瘤模型下长循环纳米制剂表现出更好的治疗效果

研究团队单位：合肥物质科学研究院

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