上海药物所在功能化修饰环糊精金属有机骨架实现肺癌的安全靶向递药研究中获进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/11381.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！

肺癌是发病率和死亡率较高的肿瘤，肺靶向给药技术可以使药物富集在肺部、提高疗效和降低毒副作用。目前，肺癌靶向策略多是利用肺癌细胞与正常细胞表面受体的表达差异进行靶向，若不能有效地把药物分子递送到肺部，将难以实现其分子靶向的价值。一般给药微粒存在组织靶向效率低、副作用大等缺点。因此，肺癌靶向治疗是亟待突破的科学难题。

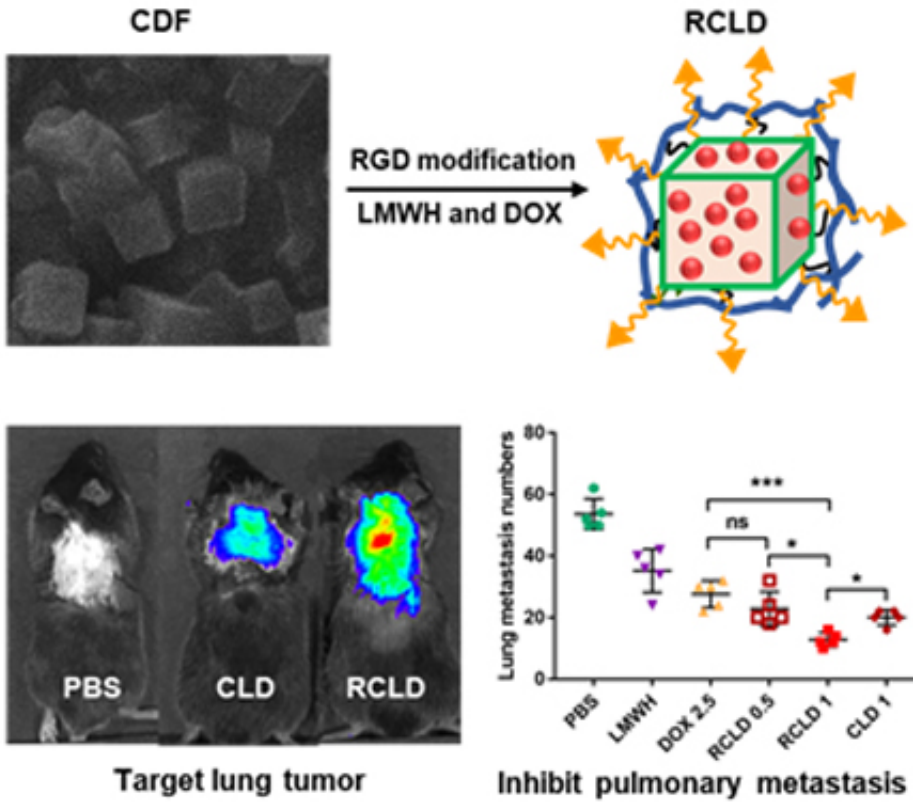
中国科学院上海药物研究所研究员张继稳发现交联环糊精有机骨架（CDF）具有高度的肺靶向的特征，并基于此设计出高效的肺癌靶向递药系统，协同递送抗癌药物阿霉素和低分子肝素，实现阿霉素用于肺癌治疗时的减毒、增效。10月7日，相关研究成果在线发表在*Advanced Functional Materials*上。

CDF采用安全性高的药用辅料γ环糊精，组装形成具有新颖纳米结构的新型药物载体。研究发现，纳米级CDF高度地靶向肺部，采用寡肽GRGDS靶头对CDF进行表面修饰，同时负载低分子肝素（LMWH）和阿霉素（DOX），构建新型的肺癌靶向递药系统RCLD。RCLD既可以利用CDF的肺靶向功能，靶向到肺组织本身，也能通过RGD靶向肺癌细胞和肿瘤新生血管过表达的整合素，利用二级靶向原理将抗肿瘤药物DOX和LMWH准确地输送到肺癌部位。体外实验表明，RCLD可以显著地抑制肿瘤细胞的迁移和侵袭。RCLD在A549人肺腺癌转移模型中，有效地抑制肺癌的生长和转移。RCLD也能抑制B16F10小鼠黑色素瘤的肺部转移。在同等疗效时，RCLD将DOX的剂量降低了5倍，减少了DOX的毒副作用。此外，RCLD在小鼠体内没有诱发急性毒性或组织坏死，生物安全性良好，具有重要的临床应用前景。

该研究首次发现和确证交联环糊精金属有机骨架具有高度的肺靶向特征，创新性地对CDF进行功能化修饰，构建出一种高效的肺癌靶向递药系统，为分子靶向药物、常用的细胞毒药物的肺癌靶向治疗提供高效的靶向递药载体，也为这些药物的优化设计和升级开发提供了新思路。

研究工作由上海药物所博士何亚平等完成，英国布拉德福德大学教授Laurence H. Patterson、上海药物所博士伍丽共同研讨和指导。研究工作获中科院战略性先导科技专项个性化药物递送关键技术、国家重点研发计划重大疾病治疗药物制剂质量研究评价技术联合研究、国家科技重大专项“重大新药创制”和国家自然科学基金委员会面上项目的资助。

论文链接



功能化环糊精金属有机骨架高度靶向肺部肿瘤，显著抑制肺癌的生长和转移

研究团队单位：上海药物研究所

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转发