



## 过程工程所开发出新型难溶性抗肿瘤药物靶向给药系统

文章来源：过程工程研究所

发布时间：2012-07-20

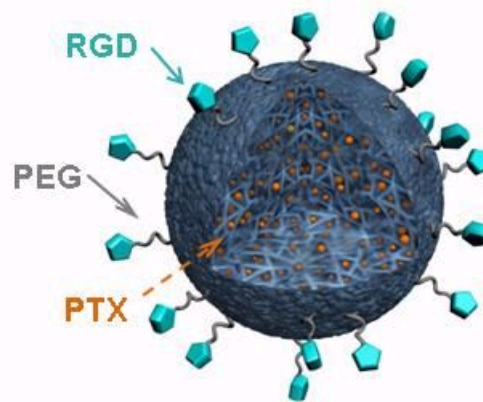
【字号：小 中 大】

多数抗肿瘤药物因其本身的难溶性而无法实现有效的靶向递送，进而严重影响其在临床方面的应用。紫杉醇（Paclitaxel, PTX）是目前临床上应用较为广泛的难溶性抗肿瘤药物之一，其对肺癌、卵巢癌、乳腺癌等均具有很好的治疗作用。为了解决其难溶问题，现用临床注射制剂（Taxol®）是将其溶解于聚氧乙烯蓖麻油和无水乙醇的混合溶媒后再行给药。然而，该制剂因缺乏靶向性，对其他正常组织产生明显的毒副作用；而且添加的聚氧乙烯蓖麻油在体内降解时会释放组胺，引起严重的过敏反应。因此，开发方便安全的靶向给药系统对PTX的临床应用有重要的研究意义。

近日，中科院过程工程研究所马光辉研究员领导的团队开发出了一种新型的难溶性抗肿瘤药物的纳米靶向给药系统（如图所示）。首先，利用O/W/O复乳液法并结合程序升温法，成功地将PTX以纳米晶形式原位装载于亲水性材料羧化壳聚糖纳米球中，并结合快速膜乳化技术实现了纳米球粒径的均一性。在此基础上，研究人员利用纳米球表面的羧基，引入具有隐形效果的聚乙二醇（PEG）链和靶向肿瘤细胞的RGD肽，最终制得兼具隐形和靶向能力的纳米给药系统。

后续的体外细胞及体内荷瘤小鼠模型实验表明，该制剂能够有效延长药物在体内的循环周期，改善纳米球对肿瘤细胞的亲和能力，提高药物生物利用度。另外，与传统的注射制剂相比，该制剂还具有很低的毒副作用。

上述研究工作已发表在*Molecular Pharmaceutics* (2012, 9, 1736-1747) 上，审稿人认为这是一项有趣的工作，方法新颖。该研究工作受到973项目（2009CB930300）和国家自然科学基金（20820102036, 21161160555）的资助。



PTX靶向纳米给药系统示意图

[打印本页](#)
[关闭本页](#)