



(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 107405404 A

(43)申请公布日 2017. 11. 28

(21)申请号 201580078055.7

(74)专利代理机构 深圳市博锐专利事务所
44275

(22)申请日 2015.04.13

代理人 张明

(30)优先权数据

2015/002222 2015.03.20 KE

(51)Int.Cl.

A61K 45/06(2006.01)

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2017.09.19

A61K 31/17(2006.01)

A61P 35/00(2006.01)

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/KE2015/000043 2015.04.13

A61P 31/12(2006.01)

A61P 33/02(2006.01)

(87)PCT国际申请的公布数据

W02016/153078 EN 2016.09.29

(71)申请人 塞米·欧尤·奥皮约

地址 肯尼亚内罗比

(72)发明人 塞米·欧尤·奥皮约

权利要求书1页 说明书2页

(54)发明名称

苏拉明和精氨酸酶抑制剂在恶性肿瘤中的用途

(57)摘要

一种组合疗法,涉及使用苏拉明及其衍生物与精氨酸酶抑制剂进行多方面的肿瘤进展中断。同时也能恢复和增强免疫系统以改善疾病控制。它也适用于病毒和原生动感染等其他病症。它需要以预定剂量和方法配制和施用该组合。

1. 一种包括苏拉明或其衍生物和精氨酸酶抑制剂的制剂组合。
2. 根据权利要求1所述的组合,其使用苏拉明作为低蛋白结合盐。
3. 根据权利要求2所述的组合,其使用精氨酸酶抑制剂或其药学上可接受的盐。
4. 足量的权利要求1中的组合用于制备一种用于治疗瘤形成,病毒感染和原生动物的药物。

苏拉明和精氨酸酶抑制剂在恶性肿瘤中的用途

技术领域

[0001] 本发明涉及通过使用包含适当的苏拉明盐和精氨酸酶抑制剂的组合疗法来治疗恶性肿瘤。

背景技术

[0002] 恶性肿瘤是涉及细胞无序生长的常见疾病。已知它们通过淋巴系统传播并繁殖，并需满足六个条件。它们是：

[0003] 1. 持续的增殖信号传导；

[0004] 2. 避免生长抑制；

[0005] 3. 抵抗细胞死亡；

[0006] 4. 能够不朽地复制；

[0007] 5. 诱发血管生成；

[0008] 6. 活跃的侵袭和转移。

[0009] 在疾病进展期间，可观察到有以下变化：

[0010] 1. 免疫细胞的抑制水平；

[0011] 2. 尽管细胞保持抗原性，T细胞对肿瘤的反应能力下降；

[0012] 3. 树突状细胞免疫能力的渐进丧失；

[0013] 4. 通常涉及免疫系统的其他变化。

[0014] 在引入苏拉明治疗锥虫病之后，自实验室测试表明它对各种病毒和癌细胞系也是有效的之后，很多人对此产生了兴趣。所面临的挑战是，已在体外活动中证实的未能成功在活体中展示出来。这些主要是由于药物不利的高蛋白质结合性所引起的高剂量使用导致的。

[0015] 已经证明，这种蛋白质结合可以减少，并且这使得具有改善的药代动力学的苏拉明的剂量需求有所下降。这种方法还导致药物的毒性非常小，使其更为患者所接受。除了扰乱上述一些过程外，已证实苏拉明可在各种条件下恢复宿主免疫系统。

[0016] 在肿瘤疾病进展中，另外观测了氨基酸，精氨酸代谢。进一步的观测到的是，改变精氨酸代谢的精氨酸酶抑制剂能够超越新生细胞的免疫抑制特性。

发明概要

[0017] 因此，本发明的目的是制定一种包含精氨酸酶抑制剂和适当的苏拉明盐的组合疗法，用于治疗恶性肿瘤和其它适用的病症，如病毒和原生动感染。

[0018] 本发明的另一个目的是适当地施用制剂以达到所需的药代动力学特征。

[0019] 通过结合所附权利要求书对本发明的以下详细描述查阅，本发明的其它目的对于本领域技术人员将变得显而易见。

发明内容

[0020]

[0021] 在本发明中,低蛋白质结合的苏拉明盐和精氨酸酶抑制剂的制剂将以极低于目前临床使用的剂量施用。该施用优选为舌下给药,但也可以部署为任何其他给药途径。所述制剂优选为固体或液体,但如果条件要求,则将使用任何其它可接受的形式。

[0022] 优选为舌下途径,因为容易进入淋巴系统。苏拉明和精氨酸酶抑制剂在免疫调节和抗血管生成方面的预期协同作用应能够通过淋巴系统阻碍疾病进展,特别是转移。

[0023] 由于苏拉明具有抗病毒感染和原生动感染等其他病症的活性,因此也可以将本发明用于这些病症。