

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl⁶

[12]发明专利说明书

[21] ZL 专利号 93102584.2

A61K 35/78

A61K 31/44

A61K 31/455 A61K 31/51

A61K 31/525 A61K 33/34

A61K 33/36

[45]授权公告日 1999年12月22日

[11]授权公告号 CN 1047525C

[22]申请日 93.3.13 [24]颁证日 99.10.23
 [21]申请号 93102584.2
 [73]专利权人 刘同乐
 地址 100007 北京市东城区大兴胡同 21 号
 共同专利权人 刘同庆
 [72]发明人 刘同乐 刘同庆
 [56]参考文献
 JP55160720 1980.12.13 A61K33/26
 WO87/06833 1987.11.19 A61K33/24
 审查员 翟羽

[74]专利代理机构 北京三友专利代理有限公司
 代理人 杨佩璋

权利要求书 1 页 说明书 5 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 治疗癌症的药物

[57]摘要

本发明涉及治疗癌症的药物。由铜盐和铁盐 35—45%、清热解毒的中草药 45—55% 和复合维生素 B10% 组成,本发明药物在微量元素铜和铁及中草药的联合作用下,能够有选择性地杀灭癌细胞而不损害正常细胞,没有毒、副作用,其中的清热解毒的中草药和复合维生素 B 具有消恶肿疔疮疗毒及清热降火的功效,其互相协同和增效达到见效快和使用方便的功效。

ISSN 1000-8-4274

权 利 要 求 书

1、一种治疗癌症的药物，其特征在于：该药物由下述成份和重量配比组合而成：铜盐和铁盐 35-45%，清热解毒的中草药 45-55%，复合维生素 B10%；
5 该铜盐中的铜离子和铁盐中的铁离子的重量比为 1：2-3；该清热解毒的中草药由等量的蒲公英、连翘、金银花、黄芩、黄柏、知母和大黄组成。

2、如权利要求 1 的述的治疗癌症的药物，其特征在于：该铜盐为醋酸铜和/或硫酸铜。

3、如权利要求 1 的述的治疗癌症的药物，其特征在于：该铁盐为下述化
10 合物中至少一种：柠檬酸亚铁铵、富马酸亚铁、硫酸亚铁、琥珀酸亚铁、葡糖酸亚铁。

说明书

治疗癌症的药物

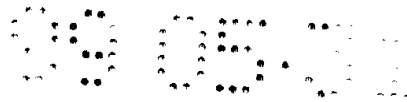
5 本发明涉及抗癌药物，特指一种含有铜和铁化合物及中草药的治疗癌症的药物。

10 目前，治疗癌症的药物种类繁多，治法多样。例如有化学疗法、放射疗法、手术治疗和单独中草药疗法等或其结合。其中，化学疗法所用抗肿瘤药物均缺乏理想的选择性作用，所以在抑制癌细胞的同时，往往对机体增殖旺盛的细胞如骨髓、胃肠和生殖细胞及中枢神经系统具有一定影响，有的还对肝、肾、心脏功能及内分泌系统有影响；此外，多数化疗药物都有免疫抑制作用，大多数抗癌化疗药物都是毒性较大，其治疗剂量与中毒剂量相近，安全系数较低，治疗期间使病人感到痛苦，放射疗法对任何细胞都有损害，对正常组织细胞往往造成不可逆转的损害，且对很多癌细胞本身也不敏感，如作不适当放射治疗还会促进癌的扩散转移。手术疗法在癌症初期疗效较佳，但在手术过程中容易使癌细胞转移，同时中晚期的癌症又失去手术治疗机会，所以，手术疗法也还不能解决某些癌症问题。此外，单独中草药疗法虽然可有某些疗效，但在大量试验中，迄今还未发现中草药能杀死癌细胞，有的也只有起到抑制细胞的作用，例如公开号为：CN1040506A，发明名称为“治疗和缓解癌症的癌灵散制备方法”。该发明采用 15 味中药，对癌症可能有抑制和缓解作用，但效果有限。

20 WO87/06833 公开了一种抗癌药物，该药物是苯酚组合和非碱金属卤化物的混合物，所说的非碱金属卤化物包括卤化铜在内，铜的作用是抑制和治疗癌症。此外，EP0246734 (A1) 公开了一种含铁和脂肪酸的组合物，所说的铁化合物中有：富马酸亚铁、葡糖酸亚铁和硫酸亚铁，该组合物用于治疗癌症。

25 以上二个发明抗癌药物具有一定的抗癌疗效，但是其提高血液的携氧量和提高细胞的生物氧化功能和激活酶的功能水平仍嫌不足，因而其抗癌效果有待改进。

30 本发明的目的在于提供一种治疗癌症的药物，该药物由铜盐和铁盐、复合维生素 B 和清热解毒的中草药混合而成，达到有选择性地杀灭癌细胞，没有毒、副作用和见效快及使用方便的目的。



本发明的目的是这样达到的：本发明所提供的治疗癌症的药物由含铜和铁的化合物、复合维生素 B 和清热解毒的中草药混合而成，其中，铜和铁的化合物重量占 35-45%、复合维生素 B 占重量 10%和清热解毒类中草药占重量 45-55%，所说的铜化合物为醋酸铜和/或硫酸铜，所说的铁化合物由下列铁化合物中选择一种或数种：柠檬酸亚铁铵、富马酸亚铁、硫酸亚铁、琥珀酸亚铁、葡糖酸亚铁、氢氧化铁，铜化合物中的铜离子和铁化合物中的铁离子的比例为 1：2-3，所说的清热解毒的中草药由等量的蒲公英、连翘、金银花、黄芩、黄柏、知母、大黄组成。由于以上成份的综合作用，特别是铜、铁离子对癌细胞的特殊综合作用，取得良好治癌的疗效。

以下结合实验结果对本发明进行详细说明：

发明人经过十多年研究首先提出了：“细胞是在长期缺氧的情况下最终导致癌变”的理论。即各种不利因素包括化学的、物理的、环境等外因以及情绪不佳、阴阳失调，痰凝湿聚、气滞血瘀等内因及其组合，都可以造成体内某局部血液循环不畅或受阻滞，引起局部细胞供血供氧不足或局部细胞处于缺氧状态，久而久之，当这些局部缺氧的细胞对外界适应的能力和维持内部环境的恒定能力遭到破坏时，就会发生突变，由有氧代谢变成无氧代谢，即不受控制的恶性增生，并逐渐形成癌肿。本发明人还发现癌症的发生与发展与体内缺铜有关，当癌症发生时，人体有调集自身组织的铜通过血液循环来抗癌的生理机制，因而造成血清铜增高的假象。当机体内的组织铜逐渐消耗减少，而癌症患者仅从日常饮食中所摄人的铜又不足以补充消耗及正常需要，癌即向深入发展。

铜参与造血过程，血内的铜蓝蛋白有如血红蛋白一样，可以运送氧气，铜又能促进铁的吸收、运送和利用，铜具有酶和激素的生物催化作用。如缺铜，则细胞色素合成受损，细胞色素氧化酶、过氧化氢酶、磷脂化酶的活性降低，脂肪的磷酸化过程延缓，细胞呼吸及细胞分裂受到影响，血液含氧量降低，骨质中的胶原纤维合成受损，弹性组织形成的大动脉易于硬化并变脆，缺铜引起的贫血与缺铁性贫血相似，因而癌症的发生与发展与体内缺铜有重要关系。



铁在体内参加血红蛋白、肌红蛋白、细胞色素、细胞色素氧化酶、过氧化物酶等的合成。铁在血红蛋白中起携带氧的作用，并与细胞内生物氧化过程有密切关系，铁又与能量代谢密切相关，缺铁时，可导致氧的输送、贮存、二氧化碳的运输和释放、电子传递、氧化还原等很多代谢功能紊乱；缺铁还会使机体免疫功能受损，白细胞功能出现障碍，血内维生素 C 含量减少，缺铁性贫血还影响人，特别是婴幼儿的生长发育等。

铜和铁对人的生理功能有着相互十分重要的关系，铜可以促进无机铁变成有机铁，由三价铁变成两价铁状态而易于为人体吸收；铜可以催化血红蛋白的合成，能促使铁以有利的形式进入骨髓，加速幼稚细胞的成熟与释放，如缺铜时，使铁难以被人体吸收和利用，缺铜发生的贫血是由于铁的吸收迟缓，代谢紊乱，骨髓合成红细胞受到限制，红细胞成熟出现障碍，晚幼红细胞发育受限制，从而出现低色素小细胞性贫血等。

根据以上的理论：细胞由于长时间缺氧而最终导致癌变，经多年研究，认为铁化合物和铜化物须联合使用，并且具有适当比例才能抗癌，本发明是以微量元素铜加铁为主，提高血液的携氧量和提高细胞的生物氧化功能和各种激活酶的功能，从而达到防止细胞癌变的目的。本发明的药物除微量元素铜和铁外，还辅以适当的中草药，该中草药可加快铜和铁在体内的代谢过程，避免铜和铁等元素在体内的大量积累，并及时排泄掉本发明药物作用后的体内代谢物，从中草药本身来说，其作用是清热解毒，对痈肿疮毒也有治疗作用，复合维生素 B 开胃，调节循环，起辅助作用。

本发明药物由含铜和铁的化合物、复合维生素 B 和清热解毒的中草药组成，其中，所说的铜化合物是醋酸铜和 / 或硫酸铜，所说的铁化合物由下列铁化合物中选择一种或数种：柠檬酸铁亚铵、富马酸亚铁、硫酸亚铁、琥珀酸亚铁、葡糖酸亚铁、氢氧化铁，在所说的铜化合物中的铜离子和铁化合物中的铁离子的比例为 1: 2 — 3，所说的铜化合物和铁化合物占总重量的 35~45%，所说的清热解毒中草药由等量的蒲公英、连翘、金银花、黄芩、黄柏、知母、



大黄组成，占总重量的 45~55%，复合维生素 B 占总重量的 10%。

关于微量元素铜和铁的联合作用已如上述，通过多年实践，在铜盐和铁盐中以铜离子和铁离子量的比例为 1: 2~3 最好，由于有的化合物含有不同的结晶水，如硫酸铜有 5 个分子的结晶水，硫酸亚铁含有 7 个分子的结晶水，可根据所用化合物所含结晶水的情况计算。

清热解毒中草药含有蒲公英、连翘、金银花、黄芩、黄柏、知母、大黄。其中，蒲公英甘平无毒，能散滞气，化热毒，能消恶肿疔疮疗毒；连翘能清热解毒，消肿散结排脓；金银花气芳香，清热解毒，治痈肿疮毒，黄芩清湿热，泻肺火，治痈疽疔疮消肿等；黄柏泻相火，清下焦湿热，治疗疮疡等症；知母滋阴降火，除烦止渴，润燥滑肠，治阴虚火旺等；大黄苦寒，能治水肿，痈肿等症。各种药等量，总重量占本发明药物的 45~55%。

复合维生素 B 占本发明药物重量 10%。

本发明药物的制法如下：将上述各成份各研磨成极细粉末，过 100 目筛，再接上述比例混合均匀，装胶囊或加赋型剂压糖衣片，每片重 0.25 克或 0.5 克。

本发明每天口服量；铜化合物 10~200mg，铁化合物 20~300mg、复合维生素和中草药皆为常用量。

本发明药物的毒性实验如下：

取昆明种雄性小鼠 25 只，共分 5 个剂量组 50g / kg、35g / kg、25g / kg、20g / kg、15g / kg 一次性灌服给药，观察动物 48 小时的症状及死亡情况，按对数绘图法求得本发明药物 LD₅₀（半致死量）为 22 克生药 / 公斤。

采用威斯塔大鼠，设两个剂量组：2g 生药 / Kg (LD₅₀1/10)，1g 生药 / Kg (LD₅₀1/20)，每组 10~14 只动物，雌雄各半，每天上午一次性灌服本发明药物中除草药外的组分，每隔 2 天下午灌服中草药组分 2ml / 只，另设有不给药，只服自来水的对照组，结果经三个月给药均未发现有特殊，在心、肝、肾功能和形态无异常改变。

经中日友好医院临床医学研究所的研究，证明本发明有如下疗效：

本发明药物以小鼠 H22 肝癌移植瘤为模型进行口服给药，初步结果证明：

本药物具有抑瘤作用，同时确实可以提高荷瘤动物的活存率。此外，本发明药物对癌细胞确有直接杀伤破坏作用，表现为癌细胞的死亡明显提高，光学显微镜和电子显微镜所得结果完全一致，在电镜下可见癌细胞的微绒毛消失，
5 胞膜、腺粒体及细胞核有不同程度的破坏，乃至整个细胞发生崩解。

以纯系荷肝癌的 BALB/C 小鼠和荷 Lewis 肺癌的 C57BL / 6 小鼠分别研究了本发明药物对其造血与免疫功能的影响，发现：本发明药物在临床常规下，对于骨髓造血和免疫功能没有毒性作用，相反，在此剂量下对骨髓造血和免疫功能却有一定的 BRM 作用，对中枢神经系统也没有产生明显的损害。

10 经中日友好医院临床医学研究所和肿瘤研究协作组又对本发明药物作了实验研究。选雄性 18 — 22 克昆明及 BALB / c 小鼠，对其植人 H22 小鼠肝癌瘤株，使分别造成腹水型和实体型荷瘤动物模型。结果表明：本发明药物有较明显的抗肿瘤作用，主要表现在：1. 荷瘤动物生存期明显延长，动态活存曲线明显抬高；2. 实体荷瘤体明显缩小；3. 腹水型肿瘤的腹水增长速度减慢，复水量
15 较少；4. 免疫功能有关的脏器胸腺和脾脏明显大于对照组。

总之本发明药物中铜能够有选择性地杀灭癌细胞，而不损伤正常细胞，铁起协同作用，再辅以复合维生素 B 帮助吸收铜、铁，再用中草药调节机体平衡，并清除由微量元素铜、铁可能造成的重金属毒性积蓄等，因此对癌细胞能起到杀灭和抑制作用，没有毒、副作用，见效快，使用方便，同时还能解决癌
20 症引起的其它症状，如疼痛、贫血、食欲差、消化功能差等。