



推荐栏目

- [人才队伍](#)
- [科研成果](#)
- [国际交流](#)
- [院地合作](#)
- [开放航次](#)
- [人才招聘](#)
- [大型设备](#)
- [学术期刊](#)

研究生教育

- [专业介绍](#)
- [导师信息](#)
- [招生信息](#)

快速连接

-  [网站地图](#)
-  [邮箱登录](#)
-  [电话邮箱](#)
-  [内部网站](#)
-  [领导信箱](#)
-  [管理入口](#)

您现在的位置: [首页](#) >> [科研动态](#)

海洋所“一种溴酚类化合物及其制备和应用”获国家发明专利授权

发布时间: 2008-3-18 8:25:00

供稿部门: 科研与开发管理处

日前, 由中国科学院海洋研究所范晓研究员等人完成的“一种溴酚类化合物及其制备和应用”获国家发明专利授权。(专利号: ZL 200410087506.7)

本发明涉及溴酚类化合物, 具体地说是一种新的溴酚类化合物、分离方法及其应用; 该化合物的结构式如图, 该化合物可作为PTP1B抑制剂, 可用于治疗各种糖尿病、肥胖症。本发明化合物为一种新的化合物, 与肽类或类肽化合物相比较, 它属于小分子有机化合物, 易于制备和工业化应用。本发明化合物对蛋白质酪氨酸磷酸酯酶PTP1B有较好的抑制作用, 本发明化合物作为选择性的PTP1B抑制剂在糖尿病和肥胖症的治疗中有重要的价值。

PTP1B是最早被纯化和确定生物学特征的PTPase。早期研究证明能在体外有效地将胰岛素受体去磷酸化。最近研究证明PTP1B能够负调控胰岛素信号转导通路并主要作用于胰岛素受体; 更为重要的实验证据来自PTP1B基因敲除小鼠。Elchebly等报道, 运用同源重组的方法产生的PTP1B基因敲除的小鼠生长正常, 有生殖力, 对胰岛素敏感性显著增强, 而且这一增强作用与肝脏和骨骼肌中胰岛素受体及胰岛素受体底物1磷酸化水平的增强相关 [Elchebly M, et al. Science, 283, 1544—1548.]。而且, PTP1B基因敲除的小鼠对食物诱导的体重增加和胰岛素抵抗也有抵抗作用。Klaman等所做实验也得到同样的结果, 并发现PTP1B基因敲除的小鼠之所以对食物诱导的体重增加有抵抗作用, 是由于脂肪细胞体积的减少, 而脂肪细胞的数量并不改变。 [Klaman L. D, et al. Molecular and Cellular Biology, 20 (15): 5479-5489]。这些实验更加有力地证明了PTP1B在胰岛素敏感性和脂肪储存方面的重要作用, 从试验上明确了它是治疗2型糖尿病和肥胖症的一个潜在药物作用靶点。

目前PTP1B选择性抑制剂的研究大多局限于一些活性较强的大分子肽类或类肽化合物。但是小分子PTP1B抑制剂更易于工业化应用, 所以从天然产物中寻找小分子的PTP1B抑制剂具有广阔的开发前景。