



首页 全园概况 机构设置 研究队伍 科研成果 研究生教育 合作交流 创新文化 信息公开 党群园地 科学普及 园林园艺

2018年10月22日 星期一 武汉 今天(周一): 11~22℃ 多云 用户名 密码 内网 邮箱

科研动态

您现在的位置: 首页 > 新闻动态 > 科研动态 > 研究进展

- 研究进展
- 学术活动

武汉植物园“一种快速筛选天然产物中拓扑异构酶I抑制剂的方法”获国家发明专利授权

2017-03-21 | 来源: 科研处 王豫兰 | 【大 中 小】

- 新闻动态
- 人才招聘
- 专题
- 学会学报
- 信息服务

3月20日,从国家知识产权局获悉中国科学院武汉植物园的发明专利“一种快速筛选天然产物中拓扑异构酶I抑制剂的方法”(ZL 201610249760.5)获国家发明专利授权。发明人:郭明全、陈桂林、田永强、张春云。

DNA 拓扑异构酶I,是广泛存在于原核和真核生物体内的一种必需酶,其催化部位的酪氨酸残基攻击 DNA 单链,使得酶与DNA 3'-磷酸二脂键形成共价连接,造成 DNA 单链的断裂,从而通过调节超螺旋、连锁、去连锁以及核酸解结作用,影响 DNA 拓扑结构。靶向药物是目前应用于癌症治疗的最先进的药物,它通过与肿瘤发生、生长所必需的特定靶点作用来阻止肿瘤细胞的生长。研究发现,拓扑异构酶I在肿瘤细胞中表现出不受其他因素影响的高水平表达,特别是结肠癌、宫颈癌和卵巢癌等的拓扑异构酶I含量及活性远高于正常体细胞,尤其在S期肿瘤细胞中活性大幅提高。因此,拓扑异构酶I抑制剂可选择性地抑制增殖期肿瘤细胞DNA复制,阻止肿瘤细胞快速增殖,进而杀死肿瘤细胞。由于拓扑异构酶I抑制剂具有众多优越性,美国国家癌症研究所药物机制分析电脑网络系统已将拓扑异构酶I抑制剂列为重点研究的六大类抗肿瘤药物之一,该酶已成为设计新型抗癌药物的重要新靶点,对其抑制剂的研究可为肿瘤的治疗提供新的临床药物和技术手段。

拓扑异构酶I抑制剂的常规筛选法一般使用光谱法、表面等离子共振法、X射线散射法、量热法和核磁共振法等,上述方法方便快捷,可在一定程度上满足筛选需求。然而光谱法因存在背景干扰而易产生假阴性和假阳性结果;核磁共振检测过程不能提供快速交换反应中蛋白质-配体相互作用的详细特征等。超滤质谱流技术结合了超滤装置优良的分离功能与质谱技术高速、高灵敏度、高准确度等特性,具有分析速度快、特异性强和高通量的特点,可便捷地识别与生物靶分子相结合的药物配体,同时样品分析用量少、谱图信息量大,在药物小分子配体和生物大分子受体相互作用研究方面具有很大的优势。

武汉植物园植物化学生物学学科组PI郭明全研究员等发明了“一种快速筛选天然产物中拓扑异构酶I抑制剂的方法”,其发明方法是超滤膜技术与色谱、质谱联用技术联用方法应用到拓扑异构酶I抑制剂的筛选中,样品分析速度快、特异性强,可方便地识别与生物靶分子相结合的药物配体;同时样品分析用量少、谱图信息量大,可实现先导化合物的快速筛选,在药物小分子配体和生物大分子受体相互作用研究方面具有很大的优势;适用于分析天然产物提取物或者单体化合物对拓扑异构酶I体外富集率。

版权所有:中国科学院武汉植物园

光谷园区地址:武汉市东湖新技术开发区九峰一路201号(九峰一路与光谷七路交叉
口) 邮编:430074

电话:+86-27-87700812 传真:+86-27-87700877 电子邮件:

wbgoffice@wbpcas.cn

磨山园区地址:武汉市洪山区鲁磨路特1号

电话:+86-27-87510815 旅游热线:+86-27-87510783

技术支持:武汉植物园科技支撑中心 webmaster@wbpcas.cn 鄂ICP备
05004779号

