



面向世界科技前沿, 面向国家重大需求, 面向国民经济主战场, 率先实现科学技术跨越发展, 率先建成国家创新人才高地, 率先建成国家高水平科技智库, 率先建设国际一流科研机构。

——中国科学院办院方针



科学家从海洋链霉菌中发现新型酰基取代氨基寡糖类降糖活性候选药物

文章来源: 植物生理生态研究所 发布时间: 2018-11-23 【字号: 小 中 大】

我要分享

10月23日, *Marine Drugs* 在线发表了中国科学院分子植物科学卓越创新中心/植物生理生态研究所王勇研究组题为 *Acylated Amino oligosaccharides with Inhibitory Effects against α -Amylase from Streptomyces sp. H01518* 的论文。该研究报道了系列结构新颖的酰基取代氨基寡糖类化合物, 均较临床上使用的降糖药物——阿卡波糖 (acarbose) 具有更强的 α -糖苷酶抑制活性。

糖尿病已成为严重危害人类健康的公共卫生问题。多脏器并发症是糖尿病引起死亡及残疾的主要原因, 大量研究表明, 波动性高血糖比持续性高血糖更能促进糖尿病慢性血管并发症的发生与发展。以 α -糖苷酶为靶标的抑制剂类药物能有效控制餐后血糖波动, 是目前糖尿病治疗中的一线药物。目前应用于临床的 α -糖苷酶抑制剂类药物有三个, 包括阿卡波糖、伏格列波糖和米格列醇等, 但其制备工艺复杂, 生产成本低, 有肠胀气等不良反应。因此, 设计和筛选新型的 α -糖苷酶抑制剂是目前抗糖尿病药物的开发热点之一。

研究组从我国日照采集到的黄海海泥样品中, 分离获得了一组富含氨基糖苷类化合物的菌株。针对其中的 H01518 菌株, 结合氨基糖苷类化合物的质谱裂解规律, 对其进行追踪, 最终发现并获得一系列结构新颖酰基取代的氨基寡糖类化合物。经体外生物活性筛选发现, 这组酰基取代的氨基寡糖类化合物均较临床上使用的降糖药物——阿卡波糖具有更强、更为理想的 α -糖苷酶抑制活性。其中, D6-*O*-acetyl-acarviostatin II03 (1) 和 D6-*O*- β -hydroxybutyryl-acarviostatin II03 (2), 其 IC_{50} 值仅为 0.029 和 0.049 mM , 较阿卡波糖 (15.7 mM) 强约 540 和 320 倍; D6-*O*-acetyl-acarviostatin I03 (3), D6-*O*-propionyl-acarviostatin I03 (4) 和 D6-*O*- β -hydroxybutyryl-acarviostatin I03 (5), 其 IC_{50} 值分别为 0.693, 0.625 和 0.495 mM , 较阿卡波糖强约 23-80 倍。上述系列酰基取代的氨基寡糖类化合物, 有望开发成为新型降糖活性候选药物, 值得深入的研究与开发。

该研究工作由王勇研究组副研究员刘海利和博士生鄂恒超合作完成, 博士生程文波、上海海洋大学实习生谢定松、利物浦大学实习生陶宛琪参与了相关工作。该研究工作得到国家自然科学基金委、中科院分子植物科学卓越创新中心、中科院战略先导B等资助。核磁共振、高分辨质谱测试得到中科院分子植物科学卓越创新中心/植物生理生态研究所公共技术服务中心技术平台的支持。

(责任编辑: 叶瑞优)



© 1996 - 2018 中国科学院 版权所有 京ICP备05002857号 京公网安备110402500047号 联系我们

地址: 北京市三里河路52号 邮编: 100864

热点新闻

中科院党组传达学习贯彻中央经...

中科院党组2018年冬季扩大会议召开
中科院与大连市举行科技合作座谈
中科院老科协工作交流会暨30周年总结表...
白春礼: 中国科学院改革开放四十年
《改革开放先锋 创新发展引擎——中国科...

视频推荐



【新闻联播】“率先行动”计划 领跑科技体制改革



【新闻联播】三北防护林工程区生态环境明显改善

专题推荐

