



www.most.gov.cn

科学家成功开发出靶向STAT5的小分子化合物

日期：2023年03月14日 09:24 来源：科技部生物中心 【字号：大 中 小】

信号转导和转录激活因子5（STAT5）在某些血液系统恶性肿瘤的发生和进展中起着关键作用，如慢性粒细胞白血病（CML），因而一直以来是一个有吸引力的治疗靶标，但成功靶向STAT5是困难的。近期，密歇根大学的科学家开发了一种选择性小分子降解剂——AK-2292，它可以成功靶向并且去除体内的STAT5蛋白。研究成果发表在《Nature Chemical Biology》期刊，标题为“A selective small-molecule STAT5 PROTAC degrader capable of achieving tumor regression in vivo”。

研究人员首先采用机体自身蛋白清理系统去除致病靶蛋白的蛋白降解靶向嵌合体（PROTAC）技术思路，设计出可成功靶向STAT5蛋白的小分子化合物AK-2292。其次，研究人员发现，AK-2292对STAT5具有高度特异性，能诱导STAT5蛋白的降解，对其他STAT蛋白和超过6000种非STAT蛋白没有影响。接着，研究人员在人CML细胞系中对AK-2292进行评估，研究结果显示，AK-2292具有强大的生长抑制活性。进一步的小鼠模型研究结果表明，AK-2292能有效降低正常小鼠肝脏和脾脏中的STAT5蛋白水平，并在CML异种移植小鼠模型中诱导肿瘤消退。

这项研究为靶向STAT5潜在药物分子的开发提供了一个新方向，也为STAT5蛋白相关癌症的治疗奠定了坚实的基础。

注：此研究成果摘自《Nature Chemical Biology》期刊原文章，文章内容不代表本网站观点和立场，仅供参考。

扫一扫在手机打开当前页



打印本页

关闭窗口

政府网站
找错

版权所有：中华人民共和国科学技术部

办公地址：北京市海淀区复兴路乙15号 | 联系我们

邮政地址：北京市海淀区复兴路乙15号 | 邮政编码：100862

ICP备案序号：京ICP备05022684 | 网站标识码：bm06000001 | 建议使用IE9.0以上浏览器或兼容浏览器