

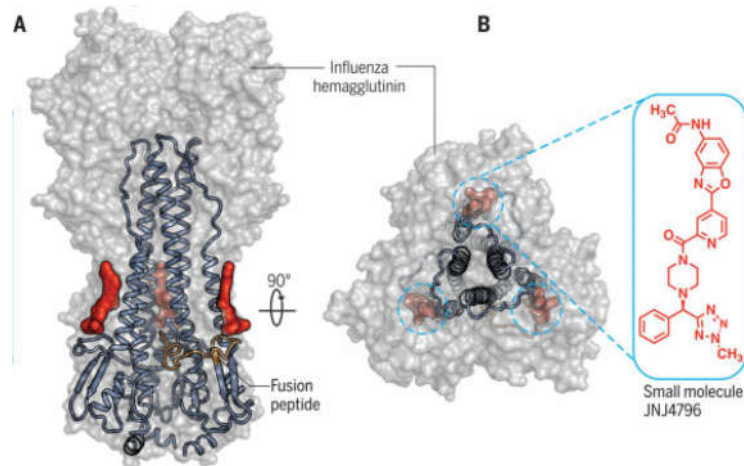


科学家发现新型抗流感病毒的小分子化合物

日期：2019年03月20日 08:07 来源：科技部

近日，美国Scripps研究所Wilson课题组和杨森制药的科研人员在Science上发表了题为“A small-molecule fusion inhibitor of influenza virus is orally active in mice”的文章，开发了一种新型口服抗流感病毒的小分子，可以有效抑制甲型流感病毒。

Wilson课题组早在2009年开发出一种广谱抗病毒抗体CR6261，它可以选择性地结合在流感病毒血凝素（hemagglutinin, HA）的颈部区域，从而达到抗病毒治疗的效果。但抗体药物通常分子量较大且结构复杂，一般不宜口服。在本研究中，科研人员通过高通量筛选，得到了与CR6261作用机制类似的小分子化合物，其中JNJ7918与HA抗原表位结合位点一致，在体外试验中可以有效对抗流感感染。随后对JNJ7918进行化学修饰，并对其抗病毒效果、代谢稳定性和口服生物利用度等进行优化，最终得到JNJ4796。该化合物在体外试验中可中和甲型流感病毒，并在口服给药后保护小鼠免受致死性和亚致死性流感病毒的攻击，还可以有效中和经3D细胞培养的人支气管上皮细胞中的病毒。



甲型流感病毒HA与JNJ4796结合示意图

与CR6261一样，JNJ4796的作用机制也是抑制HA的pH敏感性构象变化，从而阻止病毒与核内体膜的融合及病毒基因组释放到宿主细胞中。该研究为现有抗流感病毒药物的作用机制进行理论补充，并有助于抗流感病毒通用疗法的开发。（摘译自Science, Published: 08 March 2019）

扫一扫在手机打开当前页



打印本页

关闭窗口



版权所有：中华人民共和国科学技术部

地址：北京市复兴路乙15号 | 邮编：100862 | 地理位置图 | 京ICP备05022684 | 网站标识码bm06000001