

中国科学院—当日要闻

- 万钢视察新疆生地所标本馆
- 尼泊尔总理普拉昌达访问植物所
- 李家洋视察西高所
- 北京市委市政府致信感谢中科院为奥运做贡献
- 路甬祥致信感谢中科院奥运服务志愿者
- 北京奥运“名镶星空”
- 第二十九届奥林匹克运动会在北京圆满闭幕
- 人民日报社论：光荣属于伟大的奥林匹克
- 路甬祥会见景德镇市委书记许爱民
- 白春礼会见河南省副省长徐济超

当前位置: [首页](#) > [科研](#) > [科研动态](#) > [生物科学](#) >> [正文](#)

非肽类GLP-1受体激动剂最新论文被《自然·中国》列为研究亮点

上海药物研究所

8月27日,中国科学院上海药物研究所/国家新药筛选中心王明伟课题组的最新研究论文Boc5, a non-peptidic glucagon-like peptide-1 receptor agonist, invokes sustained glycemic control and weight loss in diabetic mice. (Su, H. et al., PLoS One 3, e2892, 2008)被《自然·中国》列为“研究亮点”——代谢综合征:掀起非肽类分子治疗的热潮;一类具有同时治疗肥胖症和糖尿病潜力的非肽类小分子。这是王明伟课题组的学术论文今年第二次被《自然·中国》选为“研究亮点”。

代谢综合征是一组会增加肥胖症、糖尿病及心血管疾病发病风险的临床征候群。王明伟和他的同事们研究发现,一种非肽类小分子的慢性治疗能够减轻糖尿病及肥胖模型小鼠的体重和提高其对胰岛素的敏感性。

胰高血糖素样肽-1 (GLP-1)是一种重要的肠肽激素,它在餐后释放以刺激胰岛素分泌。四元环取代化合物Boc5能够与GLP-1受体结合并模拟其生理效应。应用这个GLP-1受体激动剂治疗糖尿病及肥胖模型小鼠4周后,血糖显著下降,同时伴有脂肪组织和体重的明显减轻。而在正常小鼠中则未观察到上述作用。

依森泰德(Exenatide)是GLP-1受体的肽类激动剂,也是目前常用的抗糖尿病药物。Boc5在剂量依赖性地抑制摄食、延缓胃排空、促进胰岛素分泌和提高胰岛素敏感性等方面具有与依森泰德相似的效果。

到目前为止,所有已经上市或正在开发的GLP-1受体激动剂均为肽类,必须通过注射进入血液循环而发挥疗效。相比之下,Boc5研究成果的重要意义在于其不是多肽,具有开发成为一类全新口服药物的前景,用于治疗与代谢综合征相关的一系列临床症状。

该研究课题自2003年启动后,先后得到了国家科学技术部、中国科学院、国家自然科学基金委员会和上海市科学技术委员会的资助,目前已经申请了十余项国内外发明专利并获得三项国际专利授权。Boc5作为首个具有体内生物活性的B型G蛋白偶联受体激动剂,其发现自报道以来引起了国内外医药界和主流媒体的广泛关注。

