

综述

## 二肽基肽酶-IV抑制剂及其构效关系的研究进展

张亚安, 张惠斌\*

(中国药科大学新药研究中心, 江苏 南京 210009)

收稿日期 2008-9-11 修回日期 网络版发布日期 2009-2-9 接受日期

**摘要** 二肽基肽酶 IV (dipeptidyl peptidase IV, DPP-4) 是经临床证实的治疗2型糖尿病的新靶点, 近年来引起制药界的广泛关注。本文综述了几类主要的选择性DPP-4抑制剂及其构效关系的研究进展, 特别是利用现有抑制剂-酶复合物晶体X线衍射研究得到的DPP-4结合位点的重要的结构信息, 总结出抑制剂-酶紧密结合的重要分子间相互作用, 为通过基于结构的药物设计来获得新型选择性DPP-4抑制剂提供依据。

**关键词** [2型糖尿病](#) [二肽基肽酶IV抑制剂](#) [构效关系](#)

**分类号** [R916.2](#)

## Structure activity relationship on dipeptidyl peptidase IV inhibitors: research advances

ZHANG Ya-an, ZHANG Hui-bin

(Center for Drug Discovery, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009, China)

### Abstract

Dipeptidyl peptidase IV (DPP-IV) is a clinically validated target for the treatment of type 2 diabetes and has received considerable interest from the pharmaceutical industry over the last years. In this review, we discuss the structural characteristics of the DPP-IV binding site and use the available X-ray information together with published structure-activity relationship data to identify the molecular interactions that are the most important for tight enzyme-inhibitor binding.

**Key words** [type 2 diabetes](#) [dipeptidyl peptidase IV inhibitors](#) [structure activity relationship](#)

DOI:

通讯作者 张惠斌 [zhanghb80@163.com](mailto:zhanghb80@163.com)

### 扩展功能

#### 本文信息

- ▶ [Supporting info](#)
- ▶ [PDF\(2221KB\)](#)
- ▶ [\[HTML全文\]\(0KB\)](#)
- ▶ [参考文献](#)

#### 服务与反馈

- ▶ [把本文推荐给朋友](#)
- ▶ [加入我的书架](#)
- ▶ [加入引用管理器](#)
- ▶ [复制索引](#)
- ▶ [Email Alert](#)
- ▶ [文章反馈](#)
- ▶ [浏览反馈信息](#)

#### 相关信息

- ▶ [本刊中 包含“2型糖尿病”的相关文章](#)
- ▶ [本文作者相关文章](#)

- [张亚安](#)
- [张惠斌](#)