

上海药物所发现苯胺嘧啶类双靶点c-Met/VEGFR-2酪氨酸激酶抑制剂

文章来源：上海药物研究所

发布时间：2014-07-23

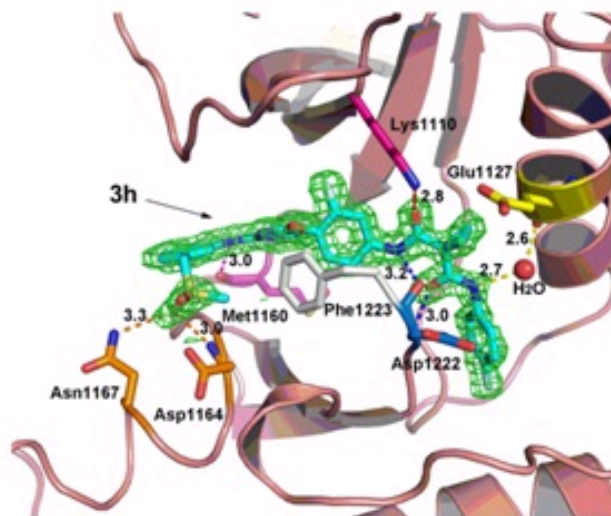
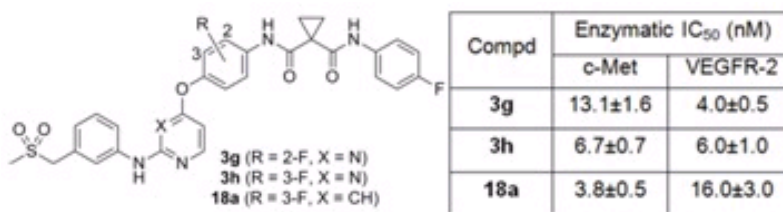
【字号：小 中 大】

基于酪氨酸激酶的抗肿瘤药物研究是近年来抗肿瘤药物研发的热点。肝细胞生长因子受体c-Met和血管内皮生长因子受体VEGFR-2是酪氨酸激酶家族的重要成员，研究表明同时抑制c-Met和VEGFR-2对肿瘤的治疗具有重要意义。目前已有多个c-Met/VEGFR-2激酶抑制剂进入临床研究阶段，典型的如XL184、XL880、E7050和MGCD265等。

中国科学院上海药物研究所段文虎、耿美玉和许叶春研究团队，近年来通过药物化学、抗肿瘤药理学和药物设计学之间的紧密合作开展了c-Met/VEGFR-2双靶点激酶抑制剂研究，对一系列具有苯胺嘧啶骨架的化合物进行了理性的药物设计和生物活性评价，取得了相应的研究成果，合成的化合物对酪氨酸激酶c-Met和VEGFR-2的激酶水平的IC₅₀均达到了nM水平，对相应的肿瘤细胞株的IC₅₀介于0.33-1.7 μM。

该项工作药物化学研究主要由詹正生完成，药理学部分主要由艾菁、彭霞、季寅淳等完成，药物设计部分主要由刘秋枫、陈甜甜完成。研究结果于3月26日在线发表在美国化学会期刊*ACS Med. Chem. Lett.*上。

[文章链接](#)



苯胺嘧啶类c-Met/VEGFR-2双靶点酪氨酸激酶抑制剂

