



上海药物所离子通道活性化合物筛选平台建设取得进展

文章来源：上海药物研究所

发布时间：2012-12-19

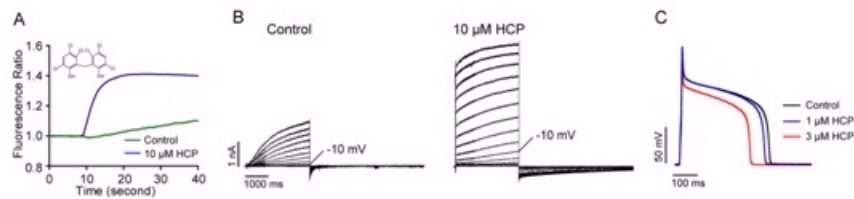
【字号：小 中 大】

离子通道是生命有机体保持正常功能的基石之一，其介导的生物电信号在心脏跳动、激素分泌、信号传导及认知记忆等所有生命过程中均起着关键作用。离子通道在基因水平的突变可导致包括神经系统、心血管系统和内分泌系统疾病在内的多种疾病，因此是最重要的药物靶点之一，同时也是药物安全性评价的指标之一。离子通道功能检测依赖于对其介导的微小电流的测量，因技术手段的限制，化合物筛选通量较低成为离子通道药物发现的瓶颈和关键步骤。

中科院上海药物所神经药理学研究国际科学家工作站自组建以来，积极进行筛选方法和平台的建设，现已建成针对包括钾通道、TRP通道在内的十余种离子通道的较高通量筛选体系。

KCNQ通道是电压门控钾通道的第七个家族，共有五个亚型，其中KCNQ1主要分布在心脏，其基因突变可导致严重心律失常；KCNQ2和KCNQ3在神经系统兴奋性调节中起着重要作用，是癫痫和疼痛等与神经兴奋性升高相关疾病的药物靶点。研究生郑月明等在利民特聘研究员和高召兵博士指导下，采用基于荧光的筛选技术，针对KCNQ通道进行药物筛选，从成药库中发现多个活性化合物，其中有关KCNQ1激动剂六氯酚（Hexachlorophene）的工作在*PLOS ONE*杂志在线发表。六氯酚是局部抗炎处方药pHi soHex的主要活性成分，其对钾离子通道的调节作用为首次报道。

该项研究取得了国家自然科学基金、国家重点基础研究发展计划和国家科技重大专项“重大新药创制”的资助。

[原文链接](#)


Hexachlorophene增强KCNQ1/KCNE1钾离子通道

A. 荧光方法筛选出Hexachlorophene; B. Hexachlorophene增强KCNQ1/KCNE1钾电流; C. Hexachlorophene缩短豚鼠心肌动作电位

[打印本页](#)
[关闭本页](#)