
昆明动物所等通过干预TRPV3研发出具有止痒和镇痛功能的候选药物

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/13155.html>

本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

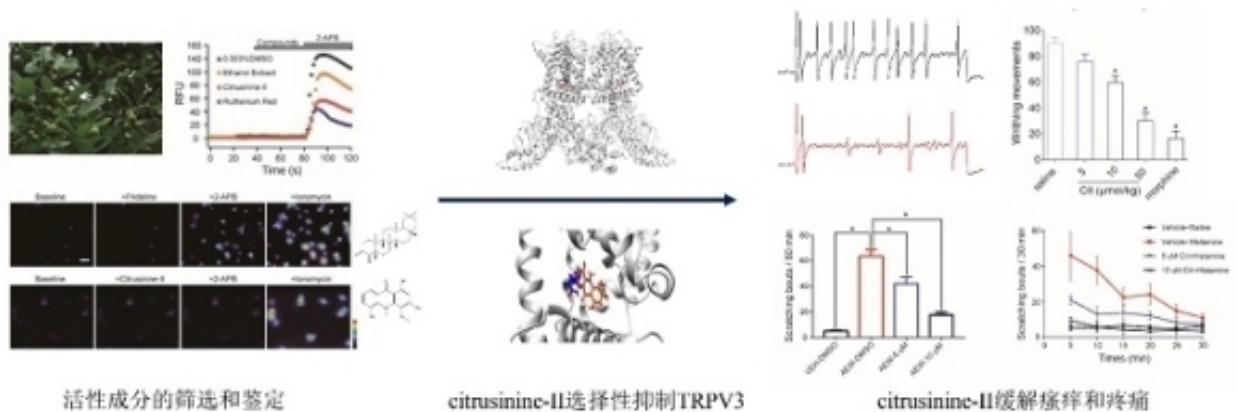
瘙痒是常见的皮肤疾病。瘙痒患者的反复抓挠，导致痒因子的释放和皮肤损伤的加剧，影响患者的心理健康和生活质量。瘙痒的病因复杂，如血液系统恶性肿瘤、肾功能衰竭、内分泌和代谢改变等内部因素，以及湿度和化学刺激等环境因素均能诱发瘙痒。鉴于瘙痒的病因复杂，开发安全有效的治疗药物较为困难。

近日，中国科学院昆明动物研究所研究员赖仞课题组联合泰国孔敬大学教授Chantana Boonyarat课题组，筛选到一个具有止痒和镇痛活性的先导化合物，该化合物选择性靶向TRPV3通道发挥其止痒和镇痛活性。

TRPV3通道是钙离子通透的非选择性阳离子通道，主要分布于皮肤角质化细胞。遗传学和药理学研究表明，TRPV3通道与皮肤的多种生理和病理功能密切相关，是介导瘙痒的重要靶点。研究采用Flexstation和钙荧光成像技术对功能化合物进行活性跟踪，全细胞膜片钳对瘙痒相关靶点进行功能筛选，以及对小鼠瘙痒和镇痛模型进行止痒镇痛活性评价，发现了具有高选择性和高活性的TRPV3通道抑制剂citrusinine-II。该化合物通过与TRPV3通道跨膜螺旋上的Y564形成 π - π 键，抑制TRPV3通道的激活。动物实验发现，citrusinine-II能够有效地缓解AEW诱导的小鼠慢性瘙痒和组胺诱导的小鼠急性瘙痒，citrusinine-II对于多种小鼠疼痛模型具有显著的镇痛活性。该研究发现了化学结构和止痒镇痛机理明确、安全性高的先导分子，为奥姆斯特德综合征和遗传性掌跖角皮病等顽固性瘙痒和疼痛疾病的治疗提供了新思路。

相关研究成果以*A plant-derived TRPV3 inhibitor suppresses pain and itch*为题，发表在*British Journal of Pharmacology*上，并已申请发明专利保护。昆明动物所副研究员韩亚蓝，博士生罗安纳和Peter Muiruri Kamau为论文的共同第一作者，赖仞、昆明动物所副研究员罗雷和Chantana Boonyarat为论文的共同通讯作者。研究工作得到国家自然科学基金国际合作项目、中科院战略性先导科技专项、云南省重大专项等的资助。

[论文链接](#)



昆明动物所等通过干预TRPV3研发出具有止痒和镇痛功能的候选药物

研究团队单位：昆明动物研究所

更多 科学进展 请访问 <https://www.iikx.com/news/progress/>

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，[爱科学iikx.com](https://www.iikx.com)转发