
国产降糖新药将迎来“超长待机”

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/27047.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！

国产降糖新药将迎来“超长待机”

。《中国2型糖尿病防治指南（2020年版）》指出，近年来，我国2型糖尿病的发病率持续升高。从1980年的0.67%到2017年的11.2%，发病率翻了几十倍。其中，2型糖尿病（T2DM）占90%以上，男性（12.1%）高于女性（10.3%），各民族、地区之间也存在差异。糖尿病患病率高，但知晓率只有36.5%，治疗率只有32.2%，治疗患者的控制率为49.2%，虽然较前均有所提高，但是仍处于很低的水平。

如同所有慢性疾病一样，糖尿病治疗必须考虑患者依从性，尤其在多种药物治疗无法达标时。研究表明，治疗方案复杂程度是影响依从性的重要因素之一。治疗方案越复杂，糖尿病患者血糖控制越差、痛苦越大、并发症越多，疾病负担更重。

为了有效解决依从性差带来的降糖达标率低的问题，我国率先推出了自主研发的首款双周超长效二肽基肽酶-4抑制剂（DPP-4i）——考格列汀（HSK7653）。据悉，DPP-4i已经广泛用于糖尿病治疗，它能够通过抑制DPP-4活性，减少胰高糖素样肽-1（GLP-1）的失活，在生理范围内增加血中GLP-1的水平。而GLP-1可通过刺激胰岛β细胞分泌胰岛素，抑制胰岛α细胞分泌胰高血糖素，抑制食欲中枢，延缓胃排空，促进胰岛细胞增殖等多种机制降低血糖。

研究显示，相比于传统的DPP-4i类药物，考格列汀的作用机制和疗效、安全性优势更为明显。从上市前的临床研究数据来看，考格列汀拥有超过100小时的超长半衰期，保证了双周一次的长给药间隔；能够更持久地实现DPP-4抑制，第14天DPP-4抑制率仍能达到80%以上，达到了媲美日制剂的疗效。同时，考格列汀对CYP酶主要亚型无影响，可以用于联合治疗方案或多种合并症同时治疗，且肝肾功能不全患者服用之后，药物暴露不增加，无需调整用药剂量。

据悉，该款新药系海思科医药集团研发设计，研究人员在奥格列汀的结构基础上加入了氟化基团，最终在非常规化学位点四氢吡喃环上6位引入三氟甲基（CF₃），成功研发出了考格列汀。

作者：张思玮 来源：中国科学报

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](http://www.iikx.com)转发