悉尼大学开发纳米口服胰岛素，预计2025年开展人体试验

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/27094.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！

悉尼大学开发纳米口服胰岛素，预计20
25年开展人体试验
。这种口服胰岛素是一种20纳米的纳米材料（宽度相当于人类头发的万分之一），其内含有胰岛素，被聚合物壳层包裹。只有在血液中的糖含量高时，胰岛素才会从纳米材料中释放出来，在肝脏中起作用并在血液中循环。

2021年的一项流行病学调查显示，全球约有5.37亿糖尿病患者，中国的糖尿病患者约1.41亿。胰岛素是治疗糖尿病的重要手段，一项发表于《柳叶刀》（The Lancet）的研究显示，糖尿病患者群体中有7500万人依赖胰岛素。

目前，胰岛素只能采用注射方式，往往需要配合生活方式干预、持续的血糖监测等方式，以减少急性不良事件的发生率和心血管疾病等长期并发症的发展，患者依从性不佳。

20世纪60年代，首个口服胰岛素的专利诞生。但由于胰岛素是由多个氨基酸合成的肽类物质，分子量大、易被酶降解、渗透性低，经口服吸收进入靶器官发挥生理作用之前，需要闯过化学、酶、渗透三道屏障。60年来，口服胰岛素的开发在临床试验中经历了多次失败。

近日，在澳大利亚悉尼大学和悉尼地方卫生区领导的一项研究中，研究人员开发了一种基于纳米技术的新型口服胰岛素。研究人员称，这种新型胰岛素可以通过片剂食用，甚至可以植入一块巧克力中。相关研究在线发表于《自然·纳米技术》（Nature Nanotechnology）杂志。

论文的第一作者、悉尼大学纳米研究所（The University of Sydney Nano Institute）的尼古拉斯·亨特（Nicholas Hunt）博士向澎湃科技介绍，其所开发的口服胰岛素是一种20纳米的纳米材料（宽度相当于人类头发的万分之一），其内含有胰岛素，被聚合物壳层包裹。每个胰岛素分子都被单独封装。这个壳层保护胰岛素免受胃酸的侵蚀，并允许胰岛素通过独特的吸收途径从肠道吸收。一旦进入体内，它就会前往肝脏。在肝脏中，壳层会对身体的血糖水平做出反应。这个壳层会被肝脏释放的酶分解，以分解糖分子。这意味着只有在血液中的糖含量高时，胰岛素才会从纳米材料中释放出来，在肝脏中起作用并在血液中循环。

也就是说，这种纳米口服胰岛素可以有效控制血糖水平，帮助糖尿病患者避免因注射胰岛素而引起的副作用，比如低血糖或体重增加。亨特说，这也是该口服胰岛素与注射胰岛素相比的关键优势。

此外，据亨特介绍，这种口服胰岛素还具有快速作用和15分钟内有效的特点，允许患者进行剂量调整。

安全性方面，目前的证据显示这种纳米口服胰岛素没有毒性。亨特说，研究团队已经进行了100天的长期毒性研究，使用的剂量是计划进行人体研究剂量的100倍，结果显示没有毒性。他们还在模拟阶段1试验中对非人灵长类动物进行了毒性研究，没有发现毒性。随后，研究团队进行了GLP认证（药物非临床研究质量管理规范）的毒性研究，为临床试验做准备，他们将与人体伦理委员会合作，以证明这种技术的安全性，并进行剂量递增的第一阶段临床试验。

据亨特介绍，纳米口服胰岛素的思路源于研究团队之前对量子点（把激子在三个空间方向上束缚住的半导体纳米结构）的研究。此前他们观察到，口服纳米材料的独特尺寸使这些材料能够快速通过肝脏，随后，他们确定这些量子点可以用于药物输送。

亨特说，开发口服胰岛素的团队所面临的普遍关键挑战是实现剂量反应效应、成本有效的胰岛素需求、快速作用和副作用的减少。而他们所面临的独特挑战是：通过应用单个胰岛素分子的纳米尺度封装和设计对血糖水平做出反应、提供胃酸保护并在体内可降解的聚合物。为了找到传递胰岛素的最佳配方，他们测试了超过200种聚合物壳层。

据悉，该口服胰岛素的人体试验预计于2025年由Endo
Axion公司负责执行，这家公司专注于预防自身免疫性疾病和改善糖尿病患者的生活质量。

作者：曹年润 来源：澎湃新闻

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转发