
科学家从海洋链霉菌中发现新型酰基取代氨基寡糖类降糖活性候选药物

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/2989.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！

科学家从海洋链霉菌中发现新型酰基取代氨基寡糖类降糖活性候选药物。10月23日，Marine Drugs 在线发表了中国科学院分子植物科学卓越创新中心/植物生理生态研究所王勇研究组题为Acylated Amino oligosaccharides with Inhibitory Effects against α -Amylase from *Streptomyces* sp. HO1518 的论文。该研究报道了系列结构新颖的酰基取代氨基寡糖类化合物，均较临床上使用的降糖药物——阿卡波糖(acarbose)具有更强的 α -糖苷酶抑制活性。

糖尿病已成为严重危害人类健康的公共卫生问题。多脏器并发症是糖尿病引起死亡及残疾的主要原因，大量研究表明，波动性高血糖比持续性高血糖更能促进糖尿病慢性血管并发症的发生与发展。以 α -糖苷酶为靶标的抑制剂类药物能有效控制餐后血糖波动，是目前糖尿病治疗中的一线药物。目前应用于临床的 α -糖苷酶抑制剂类药物有三个，包括阿卡波糖、伏格列波糖和米格列醇等，但其制备工艺复杂，生产成本低，有肠胀气等不良反应。因此，设计和筛选新型的 α -糖苷酶抑制剂是目前抗糖尿病药物的开发热点之一。

研究组从我国日照采集到的黄海海泥样品中，分离获得了一组富含氨基糖苷类化合物的菌株。针对其中的HO1518菌株，结合氨基糖苷类化合物的质谱裂解规律，对其进行追踪，最终发现并获得一系列结构新颖酰基取代的氨基寡糖类化合物。经体外生物活性筛选发现，这组酰基取代的氨基寡糖类化合物均较临床上使用的降糖药物——阿卡波糖具有更强、更为理想的 α -糖苷酶抑制活性。其中，D6-O-acetyl-acarviostatin II03 (1)和D6-O- β -hydroxybutyryl-acarviostatin II03 (2)，其IC₅₀值仅为0.029和0.049 mM，较阿卡波糖(15.7mM)强约540和320倍；D6-O-acetyl-acarviostatin I03 (3)，D6-O-propionyl-acarviostatin I03 (4)和D6-O- β -hydroxybutyryl-acarviostatin I03 (5)，其IC₅₀值分别为0.693，0.625和0.495 mM，较阿卡波糖强约23-80倍。上述系列酰基取代的氨基寡糖类化合物，有望开发成为新型降糖活性候选药物，值得深入的研究与开发。

该研究工作由王勇研究组副研究员刘海利和博士生鄂恒超合作完成，博士生程文波、上海海洋大学实习生谢定桢、利物浦大学实习生陶宛琪参与了相关工作。该研究工作得到国家自然科学基金委、中科院分子植物科学卓越创新中心、中科院战略先导B等资助。核磁测试、高分辨质谱测试得到中科院分子植物科学卓越创新中心/植物生理生态研究所公共技术服务中心技术平台的支持。

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