

[Akceptuje](#)

W ramach naszej witryny stosujemy pliki cookies w celu świadczenia państwu usług na najwyższym poziomie, w tym w sposób dostosowany do indywidualnych potrzeb. Korzystanie z witryny bez zmiany ustawień dotyczących cookies oznacza, że będą one zamieszczone w Państwa urządzeniu końcowym. Możecie Państwo dokonać w każdym czasie zmiany ustawień dotyczących cookies. Więcej szczegółów w naszej [Polityce Prywatności](#)

[Portal](#) [Informacje](#) [Katalog firm](#) [Praca](#) [Szkolenia](#) [Wydarzenia](#) [Porównania międzylaboratoryjne](#)
[Kontakt](#)



[Laboratoria](#)
[.net](#)
[Innowacje](#)
[Nauka](#)
[Technologie](#)



[Logowanie](#) [Rejestracja](#) [pl](#)

Newsletter

zapisz się

Naukowy styl życia

Nauka i biznes

- [Nowe technologie](#)
- [Felieton](#)
- [Tygodnik "Nature"](#)
- [Edukacja](#)
- [Artykuły](#)
- [Przemysł](#)

[Strona główna](#) > [Informacje](#)

Leki wpływające na dwa rodzaje receptorów nowością w leczeniu cukrzycy



Leki peptydowe, które oddziaływałyby z dwoma receptorami hormonalnymi jednocześnie już od długiego czasu przyciągały zainteresowanie naukowców mających nadzieję na stworzenie nowej metody leczenia cukrzycy. Wielu z nich z nadzieją patrzy na pojawiające się dane kliniczne na temat nowej klasy leków przeciwcukrzycowych zaprojektowanych na wzór hormonów jelitowych zwanych inkretynami, które stymulują wyrzut insuliny z komórek beta trzustki.

Mimetyki inkretyny znajdujące się obecnie na rynku działają modulująco tylko na jeden receptor. Na przykład eksenatyd oraz liraglutyd wykazują powinowactwo do receptora dla peptydu glukagonopodobnego typu 1 (glucagon-like-peptide-1 - GLP-1). Adekwatną kontrolę glikemii można uzyskać dzięki zastosowaniu tych leków w dużych dawkach, co często wywołuje u pacjenta wymioty i nudności. Odległymi skutkami terapii jest zwiększone ryzyko wystąpienia zapalenia trzustki, raka trzustki oraz raka tarczycy.

Problem z receptorami GLP-1 polega na tym, że nie znajdują się one tylko i wyłącznie na komórkach jelitowych. Znajdują się bowiem także na powierzchni komórek innych organów, zwłaszcza tarczycy, trzustki, opon mózgowych, nerki i kości. W marcu bieżącego roku Amerykańska Agencja Żywności i Leków rozpoczęła przegląd badań dotyczących agonistów GLP-1 i ich wpływu na ryzyko zachorowania na zapalenie trzustki oraz wystąpienia zmian przedrakowych w jej komórkach. We wrześniu tego roku francuska firma Sanofi wycofała ze sprzedaży w Stanach Zjednoczonych lixisenatyd - wstrzykiwany raz dziennie agonista GLP-1 - ze względu na niejednoznaczny profil bezpieczeństwa leku odnośnie objawów sercowo-naczyniowych.

Według producentów leku, farmaceutyk, który oddziałuje z dwoma receptorami jednocześnie może stanowić rozwiązanie bardziej przypominające - utracone przez chorych - procesy fizjologiczne. Nadzieja związana ze stosowaniem tych leków wynika z tego, że mogłyby być one stosowane w niższych dawkach, co zmniejsza ryzyko wystąpienia reakcji niepożądanych.

Obok omówionego receptora GLP-1 istnieje jeszcze inny hormon stymulujący poposiłkowy wyrzut insuliny - glukozeozależny peptyd insulintropowy (glucose-dependent insulinotropic peptide - GIP). Niektórzy naukowcy uważają, że aktywność właśnie tych dwóch hormonów jest zmieniona w przebiegu cukrzycy typu 2. W artykule opublikowanym w drugiej połowie października bieżącego roku zamieszczono szczegółowy opis wpływu nowo opracowanej cząsteczki - początkowo zwanej MAR701 przez firmę Indiana's Marcadia Biotech, która brała udział w początkowej fazie prac - która wiąże się i pobudza receptory zarówno GLP-1 jak i GIP. Zamieszczono w nim dane pochodzące z drugiej fazy badań klinicznych - przeprowadzonych wspólnie z firmą Roche (będącą szwajcarskim gigantem farmaceutycznym) - w której wzięło udział 53 pacjentów chorych na cukrzycę typu 2 leczonych nieadekwatnie.

Wyniki badań wskazały na zależny od dawki spadek stężenia hemoglobiny A1C (HbA1C) u pacjentów, u których zastosowano lek wynoszący od 0,53% aż do 1,11%; dla porównania - w grupie placebo zarejestrowano średni spadek tego parametru o 0,16%. Żadna z osób biorących udział w badaniu nie cierpiała na wymioty - ajczęstszy rodzaj działania niepożądanego typowego dla mimetyków

inkretynowych dostępnych na rynku; kilka osób doświadczyło nudności. W artykule stwierdzono również, że w modelach zwierzęcych podwójni agoniści zmniejszają stężenie glukozy we krwi oraz kontrolują wagę o wiele bardziej efektywnie.

Niezwykła inkretyna?

Według autora tego badania – Matthiasa Tschöpa, dyrektora naukowego Helmholtz Diabetes Center w Monachium, badania nad lekami peptydowymi o właściwościach podwójnych agonistów inkretynowych w leczeniu cukrzycy nabrały w ostatnich latach prędkości. Tschöp i jego współpracownik Richard DiMarchi, chemik z Indiana University, pracowali wcześniej nad współ-agonistą dla receptorów glukagonowego i GLP-1 (we współpracy z firmą Merck z siedzibą w New Jersey), a także nad współ-agonistą dla receptorów GLP-1 oraz estrogenowego, który wykazał potencjalne działanie zmniejszające objawy zespołu metabolicznego u gryzoni.

Inni badacze prześcigają się w wynajdowaniu podobnych leków. Naukowcy z firmy Amylin Pharmaceuticals, która w minionym roku została przejęta przez nowojorską firmę Bristol-Myers Squibb, pracują nad hybrydowymi lekami peptydowymi składającymi się z cząsteczki analogu eksenatydu połączonego z cząsteczką leku o nazwie davalintide, będącego analogiem amyliny, hormonu uwalnianego przez komórki beta trzustki wpływającego na poposiłkową regulację stężenia glukozy we krwi. „Hybrydowe leki peptydowe – analogi eksendyny i amyliny (...) poprawiają tolerancję glukozy, zmniejszają stężenie HbA1C u gryzoni z cukrzycą oraz powodują spadek wagi – i czynią to lepiej niż analogi zastosowane osobno”, mówi Soumitra Ghosh, dyrektor ds. programów badawczych i współpracy w firmie Amylin Pharmaceuticals.

Badacze z Uniwersytetu w Kopenhadze oraz z University of Alberta w Kanadzie, we współpracy z duńską firmą Zealand Pharma oraz firmą niemiecką Boehringer Ingelheim, pracują nad opracowaniem cząsteczki, która budową przypominałaby hormon jelitowy zwany oksyntomoduliną, który posiada aktywność receptorową wobec receptorów dla GLP-1 oraz glukagonu. Zespół ten konkuruje z zespołem firmy Merck, któremu udało się już zbadać mimetyki oksyntomoduliny, w tym jeden lek o nazwie DualAg5.

Niektóre zespoły badawcze poszukują peptydów oddziałujących z trzema receptorami równocześnie. Nigel Irwin, farmakolog z Diabetes Research Group Uniwersytetu w Ulster w Irlandii jest członkiem zespołu badawczego, który skupia się na poszukiwaniu nowych peptydów pomocnych w leczeniu zespołu metabolicznego oraz otyłości. Zespół Irwina opublikował wyniki swoich badań w październiku tego roku. Wskazują one na to, że potrójny agonista posiadający właściwości GLP-1, GIP oraz glukagonu doprowadzał do spadku ciężaru ciała, znacząco poprawiał tolerancję glukozy oraz czułość insuliny u myszy karmionych pożywieniem z dużą ilością tłuszczu, w porównaniu do tradycyjnych leków przeciwcukrzycowych. „Wydaje się nam także, że jednoczesna aktywacja trzech różnych receptorów zmniejszy potencjalne ryzyko wystąpienia działań niepożądanych, które pojawiają się przy nadmiernej stymulacji jednego receptora”, twierdzi Irwin.

Autor tłumaczenia: Bartłomiej Taurogiński

Źródło: <http://www.nature.com/nm/journal/v19/n12/full/nm1213-1549.html>

<http://laboratoria.net/aktualnosci/20189.html>



09-09-2024

Jak poradzić sobie z końcem wakacji?

Dobrym sposobem jest opracowanie planu na „po urlopie”.



09-09-2024

Zalecenia w sprawie mpox są racjonalne i adekwatne

Wytyczne dotyczące mpox są adekwatne do obecnej sytuacji.



09-09-2024

Przydatność organów do przeszczepu

Syntetyczna krew może istotnie wpłynąć na transplantologię.



09-09-2024

Naukowcy zbadali, jak powstają nowe słowa w mediach społecznościowych

Język ewoluuje w kontekście społecznym, a jego odmiany zawsze konkurują ze sobą.



09-09-2024

Telefony komórkowe nie powodują nowotworów mózgu

Wykazują naukowcy w najnowszych badaniach.



09-09-2024

Ryzyko zawału i udaru mózgu u kobiet

Z 30-letnim wyprzedzeniem zwykłym testem krwi można je wykryć.



09-09-2024

[Galaktyki są dużo większe, niż sądzono](#)

Galaktyka Andromedy już od dawna oddziałuje na Drogę Mleczną.



09-09-2024

[System inteligentnego zarządzania pojazdami nagrodzony przez...](#)

Nagrodzony przez Siemens i PW.

Informacje dnia: [Jak poradzić sobie z końcem wakacji? Zalecenia w sprawie mpox są racjonalne i adekwatne](#) [Przydatność organów do przeszczepu](#) [Naukowcy zbadali, jak powstają nowe słowa w mediach społecznościowych](#) [Telefony komórkowe nie powodują nowotworów mózgu](#) [Ryzyko zawału i udaru mózgu u kobiet](#) [Jak poradzić sobie z końcem wakacji? Zalecenia w sprawie mpox są racjonalne i adekwatne](#) [Przydatność organów do przeszczepu](#) [Naukowcy zbadali, jak powstają nowe słowa w mediach społecznościowych](#) [Telefony komórkowe nie powodują nowotworów mózgu](#) [Ryzyko zawału i udaru mózgu u kobiet](#) [Jak poradzić sobie z końcem wakacji? Zalecenia w sprawie mpox są racjonalne i adekwatne](#) [Przydatność organów do przeszczepu](#) [Naukowcy zbadali, jak powstają nowe słowa w mediach społecznościowych](#) [Telefony komórkowe nie powodują nowotworów mózgu](#) [Ryzyko zawału i udaru mózgu u kobiet](#)

Partnerzy