Пептид, представляющий собой чередующиеся элементы структуры GIP и GLP-1, показал впечатляющие результаты в контроле уровня глюкозы и снижении веса на серии экспериментов с животными.

Новая разработка является плодом сотрудничества нескольких научных коллективов под руководством Ричарда ДиМарчи (Richard D. DiMarchi) из департамента химии в Университете Индианы в Блумингтоне (Department of Chemistry, Indiana University, Bloomington) и Маттиаса Чопа (Matthias H. Tschöp) из института диабета и ожирения центра Гельмгольца в Мюнхене (Institute for Diabetes and Obesity at the Helmholtz Zentrum, München). Обе научные группы уже давно подбирают ключи к рецепторам инкретинов, и в этот раз им удалось успешно пройти этап доклинических исследований.

Последняя опубликованная работа ДиМарчи, Чопа и коллег показывает значительный прогресс в поиске лечения того, что многие называют глобальной эпидемией. Речь идет об ожирении и метаболическом синдроме, при котором ожирение сопутствует гипертензии, повышенному уровню триглицеридов, гипергликемии и низкому уровню холестерина липопротеинов высокой плотности. Согласно международной федерации диабета, до 20% взрослого населения Земли имеют проявления метаболического синдрома, что делает их особенно чувствительными к инфаркту и инсульту.

Наилучшие доступные на рынке препараты этого класса действуют на рецепторы GLP-1. Предыдущие исследования, направленные на рецептор GIP, показали неоднозначные результаты. Например, некоторые свидетельствовали о повышении массы тела при активации GIP-рецепторов. Вместе с тем новое вещество, одновременно действующее и на GIP, и на GLP рецепторы, показало синергичный эффект, превышающий по масштабам то, что было опубликовано ранее.

Высокий потенциал гибридной молекулы говорит о возможности использования препарата в уменьшенных дозах, что может снизить выраженность побочных эффектов, таких как тошнота и рвота. Авторы отмечают, что препараты, имеющиеся сегодня на рынке, достаточно эффективны, однако лишь незначительно снижают вес, и не всегда адекватно нормализуют уровень глюкозы. По сравнению с одобренными препаратами, новое вещество в экспериментах на животных оказалась эффективнее по обоим параметрам – в некоторых опытах выраженность действия была эквивалентна десятикратно увеличенной дозе одного из контрольных веществ. Первые клинические исследования были непродолжительными и длились всего шесть недель. За это время

трудно обнаружить значимое снижение веса, но показатели уровня глюкозы, а также безопасность нового вещества, оказались весьма позитивными.

Оригинал публикации:

Unimolecular Dual Incretins Maximize Metabolic Benefits in Rodents, Monkeys, and Humans – Science Translational Medicine, 2013, DOI: 10.1126/scitranslmed.3007218.