



尹大力 博士，研究员，博士生导师，
1958年11月出生。

1998年在中国医学科学院药物研究所获药物化学专业博士学位。长期从事药物化学研究和新药开发工作，曾在美国康涅狄格州立大学药学院和日本大正制药创药研究所从事研究。承担国家重大科技专项“创新药物和中药现代化”项目(863)、国家“九五”重点攻关项目和国家重点基础研究项目(973)和多项国家自然科学基金项目等多项研究课题。负责一项国家一类新药的研究。

主要研究工作领域是抗肿瘤药和精神神经药物的研究。在抗肿瘤紫杉烷化合物的研究中，以本所自*Taxus yunnanensis*组织培养物中分离出的新型紫杉烷化合物 Sinenxan A为原料来源，合成紫杉醇类似物，寻找新的抗癌化合物，该项目得到多项国家自然科学基金的资助，已申请专利。

沉香是名贵中药，沉香呋喃类化合物是其挥发油中的主要成分。本所郭积玉教授在对沉香呋喃化合物进行结构改造中发现了AF-5，我们对其进行了深入的研究，发现该化合物具有显著的抗焦虑活性，且毒性低。已完成临床前研究工作。该项目已申请了包括中国在内的6个国家的发明专利，并获美国专利授权。项目得到国家新药基金和科技部的支持。

参加国家重大科技专项“创新药物和中药现代化”项目(863)“创新抗焦虑药AF-5的研究”，为课题负责人。参加国家重点基础研究项目(973)子课题“基于结构和机理的抗肿瘤药物分子设计，合成和生物学评价”，负责分课题“mdm2阻断剂的研究”。

目前课题组内有工作人员三名，博士研究生四名，硕士研究生一名。

已获得或已申请的专利：

1. New taxane derivatives, their preparation and application. Liang, Xiaotian; Guo, Jiyu; Yin, Dali; Zhang, Meng; Zhu, Weihua; Dai, Jungui; Han, Rui; Liu, Hongyan CN 1393438 A 29 Jan 2003, 49 pp.
2. 新的沉香呋喃衍生物，它们的制备方法，含它们的药物组合物及它们作为药物的用途。郭积玉，王维君，方洪矩，尹大力，孙素娟，刘瑞武，李春，刘海帆，王东辉。PCT/CN99/00196。WO 00/31058。中国专利申请号：98122447.4，申请日期：1998.11.19。中国专利公开号：1254713，公开日期：2000.05.31。

Agarofuan derivatives, their preparation, pharmaceutical

composition containing them and their use as medicine. Jiyu Guo, Weijun Wang, Hongju Fang, Qian Liu, Wuyan Zhang, Dali Yin, Sujuan Sun, Ruiwu Liu, Chun Li, Haifan Liu, Donghui Wang, United States Patent 6,486,201. November 26, 2002

3. 新的沉香呋喃衍生物，它们的制备方法，它们的药物组合物及它们作为药物的，中国专利用途申请号00108339.2
4. 去氢白木香醇衍生物作为治疗或预防脑退化性病变的药物,中国专利申请号00108338.4
5. 对氟-2-(2-甲基-3-氧丙基)-4-氧-N, 3-二苯基-苯丁酰胺的新合成方法以及其中的中间体。中国专利申请号00108004.0。
6. 制备2-(2-(4-烷基苯基)-乙基)-2-氨基-丙二醇的方法以及其中制得的中间体。中国专利申请号99102879.1

近年来发表的主要论文:

1. A New Deoxygenation Method for Taxanes Using Hypophosphorous Acid. Jun GU, Meng ZHANG, Da Li YIN*, Ji Yu GUO, Xiao Tian LIANG. Chinese Chemical Letters 2004, 15(6):649-651
2. A facile synthesis of 3-substituted phthalides. Guo Li, Dali Yin, Xiao-Tian Liang. Synthetic Communications 2004, 34(7): 1183 - 1189
3. Advances in research of antianxiety agents. Ning, Xinghai; Yin, Dali. Jingxi Yu Zhuanyong Huaxuepin, 2003, 11(11): 3-5
4. Synthesis and drug resistant reversal activities of taxane-like multi-drug resistance of sinanexan A derivatives. Zhang, Meng; Yin, Dali; Liu, Hongyan; Guo, Jiyu; Liang, Xiaotian. Yaoxue Xuebao 2003, 38(6): 424-429
5. New Stereoselective Synthesis of 4-Butyl- α -agarofuran. Chun LI, Dali YIN, Hui Qin HUANG, Xiang Hong WU, Ji Yu GUO. Chinese Chemical Letters 2003, 14(9):881-882
6. Stereoselective synthesis of an anxiolytic candidate —AF-5 from (+)-dihydrocarvone. YIN Da-li, LIU Qian, LI Chun, WANG Dong-hui, GUO Ji-yu, LIANG Xiao-tian. Chinese Journal of Medicinal Chemistry(中国药物化学杂志) 2003, 13(4): 187-193
7. Synthesis of deuterium-labelled 4-butyl- α -agarofuran for use as an internal standard in a GC/MS method. LI Chun, YIN Da-li. Chinese Journal of Medicinal Chemistry(中国药物化学杂志) 2003, 13(3): 148-152
8. Synthetic study of 1,7,9-trideoxypaclitaxel via sinenxan A. Meng Zhang, Dali Yin, * Ji-Yu Guo and Xiao-Tian Liang. Tetrahedron Letters

9. A mild and efficient approach for the deprotection of silyl ethers by sodium periodate. Mijuan Wang, Chun Li, Dali Yin* and Xiao-Tian Liang. *Tetrahedron Letters* 2002, 43(48): 8727-8729
10. The initial evaluation of non-peptidic small-molecule HDM2 inhibitors based on p53-HDM2 complex structure. Jianhua Zhao, Mijuan Wang, Jie Chen, Zhihua Liu, Dali Yin, Min Wu. *Cancer Letters* 2002, (183): 69-77
11. A highly regioselective deacetylation of taxanes. Meng Zhang, Dali Yin, Ji-Yu Guo, Xiao-Tian Liang. *Chinese Chemistry Letters*. 2002, 13(6): 501-504
12. Entry into major groups retaining taxol via sinenxan A. Meng Zhang, Dali Yin, Ji-Yu Guo, Xiao-Tian Liang. *Chinese Chemistry Letters* 2002, 13(2): 135-138
13. 14 β 侧链紫杉醇衍生物的合成及抗肿瘤活性. 刘瑞武, 尹大力, 郭积玉, 梁晓天, 龟尾一弥, 关口喜功. *天然产物研究与开发* 2000, 12(1): 26-34
14. 10位结构修饰14 β 侧链紫杉醇衍生物的合成及抗肿瘤活性. 刘瑞武, 尹大力, 郭积玉, 梁晓天, 龟尾一弥, 关口喜功. *中国药物化学杂志* 2000, 10(1): 18-25
15. A facile approach for the construction of the oxetane ring from 5 α -acyloxy- $\Delta^4(20)$ -taxoids. Liu, Ruiwu; Yin, Dali; Guo, Jiyu; Liang, Xiaotian. *Chinese Journal of Chemistry* 2000,18(2): 236-246
16. Synthesis of Analogues of Paclitaxel with 14 β -Side chain from Sinenxan A. Yin Dali, Liu Ruiwu, Wang Donghui, Guo Jiyu, Liang Xiaotian, Yoshinori Sekiguchi, and Kazuya Kameo. *J. Chin. Pharm. Sci.* 1999,8(4): 191~200.
17. Attempted Removal of Oxygen Function at 1-Position of 10-Deacetylbaccatin III. Dali Yin, Yoshinori Sekiguchi, Kazuya Kameo. *Chinese Chemistry Letters* 1998, 9: 373-375.
18. 新型14 β -侧链紫杉醇衍生物的合成及构效关系研究. 刘瑞武, 尹大力, 王东辉, 李春, 郭积玉, 梁晓天. *药学学报*, 1998, 33(12): 910-918

