

## 上海药物所抗耐药菌感染新型截短侧耳素衍生物研究获进展

文章来源：上海药物研究所

发布时间：2014-06-23

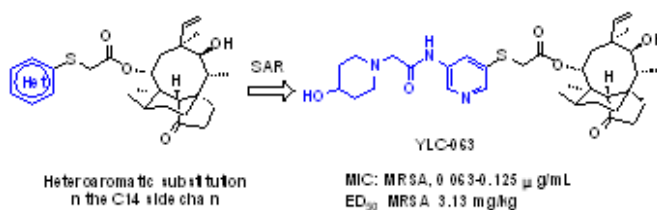
【字号：小 中 大】

随着抗菌药物的广泛使用，细菌耐药性问题变得日益严重，多药耐药菌感染已成为威胁人类健康的重要问题。因而临床上迫切需要结构新颖、作用机制独特、对耐药菌有效的新型抗菌药物。截短侧耳素是一类作用机制新颖的天然产物，对耐甲氧西林金黄色葡萄球菌（MRSA）、耐甲氧西林表皮葡萄球菌（MRSE）和耐青霉素肺炎链球菌（PRSP）等耐药菌具有较强的体外抗菌活性。目前除了2007年上市的局部外用药物Retapamulin以及Nabriva公司的BC-7013和BC-3781分别处于I期和II期临床研究，尚没有可以系统给药的截短侧耳素类抗菌药物上市。

中国科学院上海药物研究所杨玉社课题组以Nabriva公司在研药物BC-7013为先导化合物，设计合成了一系列芳杂环取代的新型截短侧耳素衍生物。通过深入的构效关系研究、构代关系研究以及成药性优化，发现了化合物YLC-063。YLC-063大鼠体内代谢性质较好，静脉给药后在MSSA感染小鼠模型中表现出和利奈唑胺相当的药体内抗菌作用，而在MRSA感染小鼠模型中的体内抗菌作用则明显优于利奈唑胺，值得进一步研究。

该研究成果由该组凌晨雨博士完成，发表在美国化学会药物化学期刊*Journal of Medicinal Chemistry*上（*J. Med. Chem.* 2014, 57, 4772- 4795）。

[文章链接](#)



芳杂环截短侧耳素衍生物的结构优化

打印本页

关闭本页