

上海药物所新型广谱抗耐药真菌三氮唑类药物研究获进展

文章来源：上海药物研究所

发布时间：2014-06-05

【字号：小 中 大】

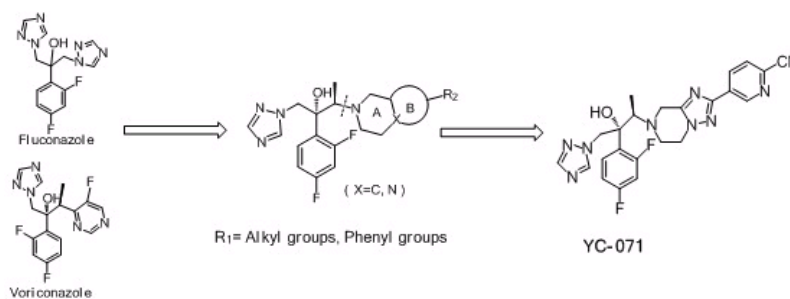
近年来，深部真菌感染在临床上已成为艾滋病和恶性肿瘤等重大疾病死亡的重要原因之一，然而临床普遍使用的三氮唑类抗真菌药物受抗菌谱较窄、交叉耐药性严重等限制，因此开发一种广谱的，既能注射又能口服，特别是对耐药菌有效的新型三氮唑类抗真菌药物具有十分重要的意义。

中国科学院上海药物研究所杨玉社课题组综合考虑抗菌谱、耐药特性、水溶性以及代谢性质等，采用生物电子等排、变换分子骨架、药效团转化等结构优化的策略，设计合成了一系列100多个具有自主知识产权的新型哌嗪或哌啶并杂环类三氮唑衍生物，并从中筛选出候选药物YC-071。该化合物不仅对常见的致病菌株有较强的体外抑制活性，更重要的是，其对多株氟康唑耐药的菌株也具有较弱的抑制活性且优于伏立康唑。YC-071具有良好的药代动力学性质，大鼠口服生物利用度超过100%，对敏感白色念珠菌(SC5314)以及氟康唑耐药菌(白色念珠菌103)感染的小鼠有较强的保护作用，并且表现出了良好的剂量效应关系。

该研究工作主要由该组曹旭峰博士和北师大胡文浩教授联合研究生孙照栓完成，研究结果已于近期在线发表于美国化学会药物化学期刊*J. Med. Chem.* 2014, 57, 3687-3706。

候选药物YC-071已得到国家“十二五重大新药创制科技重大专项”(No. 2014ZX09101004-003)的资助。

文章链接



上海药物所新型广谱抗耐药真菌三氮唑类药物研究获进展

打印本页

关闭本页