

您现在的位置: 首页 > 新闻中心 > 科研动态

上海药物研究所发现抗凝血候选药物

发表日期: 2014-10-16

打印 中 大 关闭 浏览次数:

长久以来, 血栓栓塞性疾病如深静脉血栓、肺栓塞、脑卒中、急性冠脉综合征等, 严重威胁着人类的生命健康, 而抗凝药物被广泛用于血栓栓塞性疾病的预防与治疗。传统抗凝药物如肝素(普通肝素、低分子量肝素), 维生素K拮抗剂(华法林)等, 在发挥其抗凝作用的同时, 由于其自身存在的诸多缺陷, 难以满足临床的广泛需求。因此开发新型可以口服, 疗效好, 安全性高的抗凝药物具有十分重要的意义。

凝血因子Xa在凝血通路中起着十分关键作用, 使其成为抗凝血领域的研究热点。中科院上海药物研究所杨玉社研究组以上市药物rivaroxaban为先导化合物, 通过结构优化策略, 设计、合成了一系列构象限制的[6, 6, 5]三环噁唑烷酮类化合物, 通过深入的构效关系及构代关系研究, 发现了候选化合物11a (YG-001)。YG-001表现出良好的体内外抗凝活性及相关酶选择性, 在大鼠及狗代谢研究中, 表现出比rivaroxaban更优的代谢性质, 值得进一步研究。

该研究成果由本组薛涛、丁实两位博士生共同完成, 研究结果发表在美国化学会药物化学期刊*Journal of Medicinal Chemistry*上。

这是该研究组本年内第三篇*Journal of Medicinal Chemistry*研究论文。

文章链接: <http://pubs.acs.org/doi/pdf/10.1021/jm501045e>

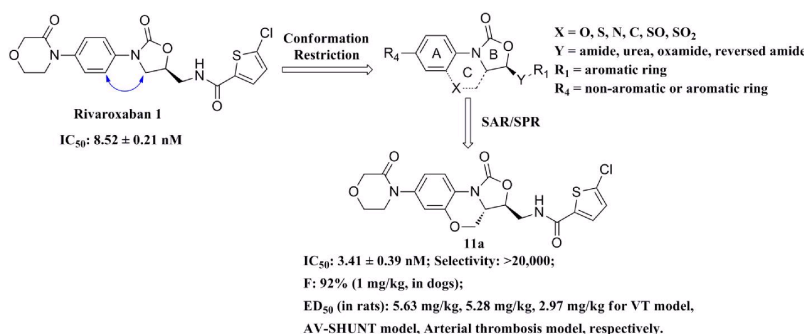


图1. 三环噁唑烷酮类FXa抑制剂的结构优化

(供稿部门: 杨玉社研究组)

评论



版权所有 中国科学院上海药物研究所 沪ICP备 05005386号
地址: 上海市浦东张江祖冲之路555号 邮编: 201203 电话: 86-21-50806600