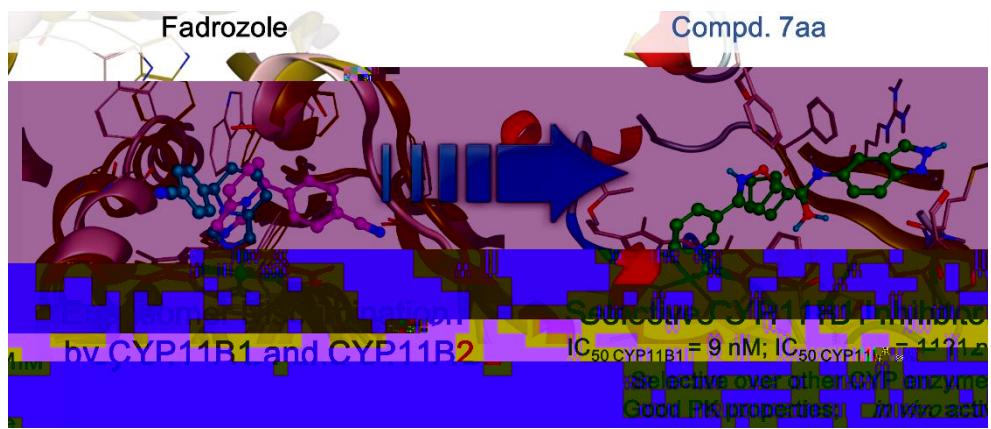


中药学院胡庆忠教授团队在 *J Med Chem* 期刊发表 高水平研究论文

近日，我院胡庆忠教授、尹利娜教授课题组在著名学术期刊《*Journal of Medicinal Chemistry*》上发表题为《Design, Synthesis, and Biological Evaluations of Pyridyl 4,5,6,7-Tetrahydro-4,7-Methanobenzo[*d*]isoxazoles as Potent and Selective Inhibitors of 11 -Hydroxylase 》（doi : 10.1021/acs.jmedchem.2c01037）的研究性论文。

《*Journal of Medicinal Chemistry*》（影响因子 8.0）是药物化学二级学科最重要的经典学术期刊之一，在创新药物发现领域有着广泛影响。这是我校首次作为单独第一作者单位及单独通讯作者单位在该杂志发表研究性论文，是双一流学科建设及杏林学者计划结出的又一硕果。

该研究从一对高度相似的同源酶 CYP11B1 及 CYP11B2（同源一致性超过 93%）对于先导物 Fadrazole 的不同光学异构体具有差异性亲和力出发，在对此 Enantiomer Discrimination 进行深入研究分析后，设计了 Pyridyl 4,5,6,7-Tetrahydro-4,7-Methanobenzo[*d*]isoxazoles 类化合物，不但实现了对于靶点 CYP11B1 的高抑制活性，而且对于同源酶 CYP11B2 表现出很好的选择性，并具有较好的药代动力学性质及体内活性。该研究不但发现了有望治疗可的松相关严重疾病的候选药物，而且为小分子药物如果实现选择性这一创新药物发现中的共性难题提供了新的策略。



(撰稿人：胡庆忠；审核人：詹若挺)