

获奖成果

您现在的位置: 首页 > 机构设置 > 研究机构 > 国家级研究中心 > 新药研究国家重点实验室 > 科研成果 > 获奖成果

代表性论文

发明专利

获奖成果

出版著作

## 年度重要获奖

作者: 管理员 发布日期: 2018-08-16   【中大】 【关闭】

“国家1.1类新药盐酸安妥沙星”获2017年度国家技术发明二等奖

主要完成人: 杨玉社、王祥、蒋华良、陈凯先、张沐和嵇汝运等

氟喹诺酮(沙星类)是我国抗菌药物三大主力品种之一,对保障我国人民身体健康发挥着重要作用。虽然我国早在1967年就仿制了第一代喹诺酮药物萘啶酸,但在长达40多年的时间里,该领域创新药物一直是空白。杨玉社-嵇汝运团队从1993年开始,在国家自然科学基金、“863”计划、国家新药创制重大专项、中科院知识创新工程的支持下,潜心研究氟喹诺酮类抗菌药物的合成方法学、构效关系、构代关系、构毒性关系、成药性等,并在此基础上通过合理药物设计,采用结构优化的策略,设计合成了5类62个新化合物,历时16年最终于2009年成功上市了我国第一个具有新颖化学结构(NCE)和自主知识产权的1.1类化学新药盐酸安妥沙星。

盐酸安妥沙星是具有新颖化学结构的新分子实体,通过创造性地分子结构优化,在母核5-位引入氨基,显著提高了抗菌活性(优于氟喹诺酮类抗菌药中的优秀品种环丙和氧氟沙星)和代谢性质,且极大地改善了心血管安全性,消除了光毒性,并获得了相应的化合物、合成方法和用途授权专利(ZL 97106728.7)。

盐酸安妥沙星是我国科研院所和企业联合开发创新药物的一个成功范例。2001年安徽环球药业股份有限公司接受安妥沙星及其衍生物原始专利技术转让,共同开展I、II、III期临床研究,产研结合,加速了本品研发上市的步伐。

与同类药物相比,盐酸安妥沙星无论疗效还是安全性均优势突出。

一是几乎没有光毒性,二是心脏安全性大幅改善,三是药代性能十分优秀,四是临床治疗各种急性细菌感染性疾病,疗效优异、安全性好。此外,盐酸安妥沙星还克服了原有氟喹诺酮类药物抗菌活性不强、代谢性质欠佳和副作用较大等缺陷,是更安全、更高效的新一代氟喹诺酮类抗菌药物,造福了我国广大患者。至2016年底,盐酸安妥沙星片已在北京、重庆等22个省市自治区的150多家医院和医疗机构使用,进入10余个地方省市医保目录,销售282万余盒,销售额约2.35亿元,使100余万人次患者受益。

盐酸安妥沙星的研制成功填补了我国氟喹诺酮类抗菌药物领域40多年的自主创新空白,是1993年我国实施药品专利法以来我国科学家创制的第一个化学创新药物,对推动我国医药工业从仿制到创新的历史性转变做出了积极贡献,被评为“十一五”《国家重大新药创制专项》重大标志性成果。