

Trend and Analysis of New Chemical Entities in the World

世界新药动态与分析

主 编 邹 栩 任文霞
副主编 陈 玲 顾 凯



第二军医大学出版社

Tropical Forest Biodiversity and Heavy Commercial Logging in Borneo

by **PAUL A. BAKER** and **JOHN A. BAKER**

1994 288 pp.
\$35.00



ALLEN & UNWIN

世界新药动态与分析

主 编 邹 栩 任文霞

副主编 陈 玲 顾 凯

主 审 王明时

第二军医大学出版社

图书在版编目(CIP)数据

世界新药动态与分析/邹栩,任文霞主编.-上海:第二军医大学出版社,2010.10

ISBN 978-7-5481-0130-7

I. ①世… II. ①邹… ②任… III. ①新药-研究-世界
IV. ①R97

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2010)第 194752 号

出版人 石进英
责任编辑 尹 茶

世界新药动态与分析

主 编 邹 栩 任文霞

第二军医大学出版社出版发行

上海市翔殷路 800 号 邮政编码:200433

发行科电话/传真:021-65493093

全国各地新华书店经销

南京工大印务有限公司印刷

开本:787×1 092 1/16 印张:16.5 字数:564 千字

2010 年 10 月第 1 版 2010 年 10 月第 1 次印刷

ISBN 978-7-5481-0130-7/R·934

定价:150.00 元

前 言

药物的研发是人类进步的一个重要的标志,也是制药行业永恒的主题。随着科学的发展,药物对于人们生活水平的提高也越来越占主要的位置。而作为一个发展中的大国,药物的开发与研究同样成为中国跻身世界发达国家行列的重要环节。

近年来,在新药研究与开发方面,得到了国家与地方政府的高度重视,为满足我国重大疾病防治和医药产业发展的需要,2009年,国家公布了“重大新药创制”科技重大专项和“十二五”实施计划,加大新药研制的步伐,为了配合我国新药研发及自主创制新药决策参考,追踪世界新药研究的前沿动态,分析全球上市的新药信息,本课题组申报了江苏省科技厅组织的科研课题,出版了这本《世界新药动态与分析》一书,全面反映国际制药界新药研究的方向,期望能为我国医药行业在新品开发及产品的技术创新与结构调整方面提供重要的参考资料。

本书收集了2003-2008年世界首次上市的新化合物(NCEs)154个。详细介绍了每种药物的药名(中英文名)、结构式、分子式、相对分子质量、商品名、别名、类别、化学名、CAS号、研制公司、上市国家、药品性状、药理作用、临床研究、给药方法、不良反应、适应症、制剂规格、生产厂家、新药的专利号等等,是目前国内介绍世界新药方面最详尽、系统、全面的工具检索书。

本书不仅为新药研究与开发的科技工作者提供信息,同时对广大医院的医务工作者也有很好的帮助。

由于我们的水平有限,书中一定存在不妥之处,敬请读者给予批评指正。

编 者

2010.7

编写说明

1. 本书中上市新药是指 2003 – 2008 年世界上市的新化学实体 (Scrip), 编排顺序是以药物的英文通用名的字母顺序为准。
2. 结构式的右下角为该药物的分子式和相对分子质量。
3. [CAS] 指该药的 CAS 号, 如为该药物的盐或其他结合方式, 则有相应的 CAS 号给予说明。
4. 部分药品的商品名是指该药物的成盐形式, 大部分在相应的结构式中已经标出。
5. [用法与用量] 项中内容根据文献报道内容编写, 仅供读者参考。医务人员及患者用药时, 请按药品说明书中的剂量使用, 本项内容不作为临床用药的依据。
6. 为便于读者检索, 本书目录有药品英文通用名索引、药品中文通用名索引和药品商品名索引, 书后附有药品按药效分类索引。
7. 2007 和 2008 年上市的新药因时间间隔短, 收集的内容可能不全, 留待再版时增补。
8. 主要参考文献: 1) Merck Index; 2) Scrip; 3) Drugs of Future; 4) Drug Information Journal; 5) 国外各大制药公司研发机构网站; 6) 国内药学信息杂志。

编 者

2010.7

目 次

前言

编写说明

世界上市新药动态及分析——中国自主创制新药决策参考	(1)
世界上市新药专利情况	(10)
世界上市新药进口及国产情况数据分析	(17)
全球心血管药物研发动态	(22)
全球抗抑郁药市场前景及最新研发动态	(34)
世界新药研发动向	(38)
2009 年全球上市新药介绍	(44)
2008 至 2009 年世界上市新药一瞥	(45)
2003 至 2008 世界上市新药介绍	(49)
药品通用名索引(英文)	(I)
药品通用名索引(中文)	(IV)
药品商品名索引	(259)
药品药效分类索引	(262)

Generic Name Index

药品通用名索引(英文)

¹³¹ I-Tositumomab	49	Clofarabine	90
A		Conivaptan Hydrochloride	92
Abarelix	50	D	
Abatacept	52	Dabigatran Etexilate	93
Adalimumab	53	Daptomycin	96
Alefacept	56	Darifenacin Hydrobromide	99
Aliskiren	57	Darunavir	100
Alvimopan	57	Dasatinib	101
Ambrisentan	59	Decitabine	101
Anecortave Acetate	59	Deferasirox	102
Anidulafungin	60	Desvenlafaxine Succinate	104
Anti-Hepatitis-B Ab	61	Doripenem	105
Anti-IL-8-Mab	65	DTP-polio Vaccine Booster	107
Aprepitant	67	Duloxetine Hydrochloride	109
Atazanavir Sulfate	67	Dutasteride	111
Atomoxetine Hydrochloride	68	E	
Azacitidine	73	Ecuzumab	113
Azelnidipine	74	Eltrombopag Olamine	113
B		Emtricitabine	115
Belotecan	75	Enfuvirtide	118
Bevacizumab	76	Entecavir	120
Blonanserine	78	Eplerenone	125
Bortezomib	80	Erlotinib	128
C		Eszopiclone	130
Ceftobiprole Medocaril	81	Etravirine	133
Ceramides, cholesterol and fatty acids	82	Everolimus	135
Certolizumab Pegol	82	Exenatide	136
Ciclesonide	84	F	
Cinacalcet Hydrochloride	86	Fesoterodine Fumarate	138
Clevidipine butyrate	88	Fosaprepitant Dimeglumine	140
Clevudine	89	Fosfluconazole	144

G		Mozavaptan	181
Galsulfase	144	N	
Garenoxacin	145	Natalizumab	181
Grass Pollen Vaccine	147	Nelarabine	182
H		Nilotinib	182
Hepatitis A and B Combined Vaccine	147	NOV-002	183
HPV Vaccine	149	O	
Hyaluronidase	151	Octocog Alfa Recombinant Coagulation Factor VIII	183
I		Omalizumab	184
Icatibant	152	Oxycodone	185
Idursulfase	153	P	
Ilaprazole	154	Paediatric 疫苗	187
Inactivated Influenza Vaccine(Split Virion)	157	N-Palmitoylethanolamide	187
Indisetrone Hydrochloride	157	Palonosetron	187
Insulin Detemir	159	Panitumumab	187
Ivabradine	162	Pegaptanib Octasodium	188
L		Pemetrexed	190
Lacosamide	162	Pirfenidone	192
Lanthanum Carbonate	164	Pitavastatin Calcium	194
Lapatinib Ditosylate	165	Plerixafor	196
Laronidase	168	Posaconazole	196
Lenalidomide	169	Pralmorelin	198
Levoleucovorin Calcium	170	Pramlintide	198
Lisdexamfetamine Dimesylate	171	Pregabalin	201
Lubiprostone	171	Alpha-1-proteinase Inhibitor	203
Lumiracoxib	172	R	
M		Raltegravir	204
Maraviroc	173	Ramelteon	205
MAS063DP	174	Ranibizumab	206
Measles Rubella Vaccine	174	Ranolazine	209
Methoxy Polyethylene Glyco-epoetin β	175	Rasagiline Mesylate	211
Methylnaltrexone Bromide	176	Regadenoson	212
Midafenacin	177	Repel-CV	214
Miglustat	178	Revaprazan Hydrochloride	214
Mitiglinide	178	Rilonacept	215
		Rimonabant	216

Rivaroxaban	216	Talaporfin Sodium	241
Romiplostim	218	Tamibarotene	242
Rosuvastatin Calcium	218	Telbivudin	243
Rotavirus Vaccine	220	Temsirolimus	244
Rufinamide	221	THC: CBD	245
Rupatadine	222	Thrombin alfa	246
S		Tigecycline	247
Sevelamer Carbonate	223	Tocilizumab	249
Silodosin	224	U	
Sitafloxacin Hydrate	225	Udenafil	250
Sitagliptin Phosphate	226	Ustekinumab	250
Sitaxsentan Sodium	226	V	
Solifenacin Succinate	229	Vardenafil	251
Somatomedin-1	230	Varenicline Tartrate	253
Sorafenib Tosylate	231	Vildagliptin	253
Strontium Ranelate	233	Virulizin	255
Sugammadex Sodium	236	X	
Sunitinib Malate	237	Ximelagatran	256
T		Z	
Tadalafil	239	Ziconotide	257
Tafluprost	240		

Generic Name Index

药品通用名索引(中文)

- ¹³¹I-托西莫单抗 49
- N-棕榈酰乙醇酰胺 187
- α 1-蛋白酶抑制剂 203
- α -凝血酶 246
- A**
- 阿巴瑞克 50
- 阿巴西普 52
- 阿达木单抗 53
- 阿法赛特 56
- 阿利克仑 57
- 阿尼芬净 60
- 阿瑞吡坦 67
- 阿维莫泮 57
- 阿扎胞苷 73
- 阿折地平 74
- 埃罗替尼 128
- 艾度硫酸酯酶 153
- 艾库组单抗 113
- 艾普拉唑 154
- 艾曲波帕 113
- 艾替班特 152
- 安贝生坦 59
- 奥马佐单抗 184
- B**
- 贝伐单抗 76
- 贝洛替康 75
- 吡非尼酮 192
- 泊沙康唑 196
- 布南色林 78
- C**
- 草花粉疫苗 147
- 促生长因子-1 230
- 醋酸阿奈可他 59
- D**
- 达比加群酯 93
- 达芦那韦 100
- 达沙替尼 101
- 达托霉素 96
- 地拉罗司 102
- 地特胰岛素 159
- 地西他滨 101
- 丁酸氯维地平 88
- 度他雄胺 111
- 多尼培南 105
- E**
- 厄唑匹隆 130
- 恩夫韦地 118
- 恩曲他滨 115
- 恩替卡韦 120
- F**
- 伐地那非 251
- 福沙吡坦二甲葡胺 140
- 福司氟康唑 144
- 复方类固醇乳膏 174
- 富马酸非索罗定 138
- H**
- 琥珀酸去甲文拉法辛 104
- 琥珀酸索非那新 229
- 环索奈德 84
- J**
- 加雷沙星 145

加硫酶	144	马拉维诺	173
甲苯磺酸索拉非尼	231	咪达那新	177
甲、乙型肝炎联合疫苗	147	米格列蔡	178
甲磺酸雷沙吉兰	211	米格鲁司特	178
甲氧基聚乙二醇促红细胞生成素-β	175	莫扎伐普坦	181
酒石酸伐仑克林	253	N	
聚乙二醇化塞妥珠单抗	82	那他珠单抗	181
K		奈拉滨	182
抗人白细胞介素-8 单克隆抗体	65	尼罗替尼	182
可吸收性预防粘连隔离膜	214	牛胆汁提取物	255
克来夫定	89	P	
克罗拉滨	90	帕尼单抗	187
L		哌加他尼钠	188
拉科酰胺	162	培美曲唑	190
拉罗尼酶	168	硼替佐米	80
拉帕替尼二甲苯磺酸酯	165	匹伐他汀钙	194
来那度胺	169	破伤风类毒素与减低白喉类毒素以及吸附无	
兰尼单抗	206	细胞百日咳疫苗	107
雷美替胺	205	普拉莫瑞林	198
雷尼酸锶	233	普兰林肽	198
雷诺嗪	209	普乐沙福	196
雷特格韦	204	普瑞巴林	201
利伐沙班	216	Q	
利莫那班	216	齐考诺肽	257
利纳西普	215	羟考酮	185
磷酸西他列汀	226	氢溴酸达非那新	99
流行性感胃裂解疫苗	157	R	
硫酸阿他那韦	67	人乳头状病毒疫苗	149
卢非酰胺	221	人重组抗血友病(FⅧ)因子	183
卢帕他定	222	瑞加德松	212
鲁比前列酮	171	瑞舒伐他汀钙	218
轮状病毒疫苗	220	S	
罗美昔布	172	沙替菲克口腔喷雾剂	245
罗米司亭	218	神经酰胺,胆固醇和脂肪酸	82
M		舒尼替尼苹果酸酯	237
麻疹/风疹疫苗	174	苏加马德钠	236

T		溴化甲基纳曲酮	176
		Y	
他氟前列素	240	盐酸阿托莫西汀	68
他拉泊芬钠	241	盐酸度洛西汀	109
他米巴罗汀	242	盐酸考尼伐坦	92
泰地那非	239	盐酸帕洛诺司琼	187
碳酸镧	164	盐酸瑞伐拉赞	214
碳酸司维拉姆	223	盐酸西那卡塞	86
替比夫定	243	盐酸吡地司琼	157
替加环素	247	氧化型谷胱甘肽	183
头孢比普酯钠	81	伊伐布雷定	162
透明质酸酶	151	依普利酮	125
妥西利珠单抗	249	依曲韦林	133
W		依森泰德	136
维格列汀	253	依维莫司	135
乌地那非	250	乙型肝炎病毒免疫球蛋白	61
X		优特克单抗	250
西罗莫司类似物	244	Z	
西洛辛	224	右旋苯异丙胺二甲磺酸酯	171
西他沙星水合物	225	左旋甲酰四氢叶酸钙	170
西他生坦钠	226	Paediatric 疫苗	187
希美加群	256		

世界上市新药动态与分析

——中国自主创制新药决策参考

药物的研发是人类进步的一个重要的标志,也是制药行业永恒的主题。随着科学技术的发展,药物对于人们生活水平的提高也越来越占重要的位置。而作为一个发展中的大国,药物的研究与开发同样成为中国跻身世界发达国家行列的重要环节。为了配合我国医药行业新品开发及产品的技术创新,为我国医药产品结构调整提供参考,及时反映国际制药界新药研究的方向,本课题组首先对全球新药研发进行了全景分析,从新药研发的投入、全球新药研究现状(面临的困难与机遇)、新药研究的模式等方面进行了分析,其次,调研了世界在研新药及近5年全球上市的新药近500种,初步完成2003~2008年世界上市新药(174个)的所有相关资料的收集、整理、分类并进行了初步分析,根据这些新药的所有相关资料的整理,根据治疗热点领域品种、产品所采用的新技术、研发风险提示等方面进行了介绍,为我国新药研究部门提供开发新药的决策参考依据。

新药创新是全球医药行业及医药市场快速发展的推动力,也是医药企业的生命线,新产品能尽早进入市场,企业就掌握了市场的先机。因此,全球众多制药企业都希望能通过药物研发把自己的“重磅炸弹”级的新产品投放市场,获得市场的主动权和高额利润并由此形成企业的良性循环。

1 世界制药公司逐年加大新药研发的投入

多年以来,世界新药研发投入在全球创新中占有巨大的份额。根据美国药品研究与制造协会(PhRMA)等机构的研究结果,1990~2004年欧美制药业研发投入力度持续增长。2005年美国仅生物制药公司的研发投入已达518亿美元,与2004年统计数据相比增长了8.8%。

2004~2009年期间,全球各大制药公司在新药研发投入保持每年7%的增长速率。据文献报道,未来20年间,研发的投入比例还要再上涨10%~30%。

在一些原创型的制药公司,新药的研发投入甚至占到公司销售额的20%以上。

全球制药企业前十名每年新药的研发投入分别达20~50亿美元,是20年前的6倍。美国辉瑞公司2007年研发投入55亿美元,占总销售额的16.7%,而净利润是16.2%;美国默克公司研发投入33亿,占总销售额的20.0%,而净利润只有12.2%;先灵葆雅研发投入20亿,占销售额的23.1%,而净利润是15%。

由此可见,各大制药企业为了抢占潜在市场,不惜投入巨额资金研发新药,竞争日趋激烈,靠新药来占领市场是跨国制药公司求生存的必然举措,研发投入是最大的支出。2008年辉瑞公司680亿美元并购惠氏公司,罗氏公司460亿美元买下Genetech公司,默克公司410亿美元将先灵葆雅纳入旗下。辉惠联合的最终目的是在当前金融危机的背景下,强强联手,以节约40亿美元的研发投入。

2 全球新药研发全景分析——处于开发的平台期但机遇仍然存在

2.1 化学药物的发展面临“平台期”

2.1.1 传统的化学药物开发模式难度加大 在当今知识爆炸的大环境下,以传统的化学药物开发模式寻找新药的创新点越来越难,化学药品的研发其实就是要从多种化合物中筛选出有用的分子,而筛选出新的化学物质的难度逐渐加大。

2.1.2 全球对新药上市后安全性关注度加大 患者对于药品安全性越来越关注,出现了很多不良反应事件导致上市新药撤出市场。例如,2006 年新药研发领域的重要事件中,最引人瞩目的是德国 TeGenero 公司首个产品 TGN1412(抗 CD28 人源化单克隆抗体)在英国 I 期临床试验中惨遭失败,这一意外事件几乎占据了所有报刊的头版头条。TGN1412 的开发目的是用于治疗类风湿性关节炎和多发性硬化等自身免疫性疾病和白血病。该药能与 T 细胞上 CD28 受体结合,并能够单独激活 T 细胞,使 T 细胞增殖分化,进一步激活体内免疫系统。虽然该药在临床前动物实验中相对安全,但在 I 期临床试验中,除 2 名安慰剂给药者外,其余 6 名志愿者均在药物注射后 90 min 内出现了严重的全身炎症反应,继而出现多个脏器功能衰竭,最终出现淋巴细胞和单核细胞耗竭。虽经抢救 6 名志愿受试者脱险,并无死亡事件发生,但该试验却给受试者带来了许多长期影响,其中不良反应最严重的志愿者进行了部分手指和足趾的切除手术。事件发生后英国立即成立了专家小组研究临床试验失败的原因,并于 2006 年 12 月 7 日发布了最终的研究报告,提出了 22 条关于如何改善药物 I 期临床试验安全性的建议。

在新药研发过程中,还有许多药物与 TGN1412 有着类似的命运,有的耗资甚至更为巨大。如辉瑞公司花了近 15 年时间,投入 10 亿美元研制的降胆固醇药物 Torcetrapib(托彻普),在由 15 000 名患者参与的 III 期临床试验中,虽然 Torcetrapib 可将高密度脂蛋白(HDL)水平提高 60%,但同时也相应地增加了患者的病死率。其他研究还表明,Torcetrapib 对堵塞的动脉疏通几乎无效。因此,2006 年底辉瑞公司忍痛终止了对 Torcetrapib 的研发。

近年影响较大的撤市产品还有:2004 年 9 月在全球范围内治疗类风湿性关节炎的 COX-2 抑制剂万络(罗非昔布);相继还有 COX-2 抑制剂伐地考昔(valdecoxib, Bextra)和糖尿病治疗药物曲格列酮(troglitazone);2006 年 5 月从美国和加拿大撤市了喹诺酮类(沙星类)抗菌药品加替沙星片剂和注射剂;2007 年胃肠道疾病治疗药物“泽马可”(马来酸替加色罗)撤市;治疗晚期肺癌药物易瑞沙(Iressa)在欧洲自动撤市。

在生物技术药物方面,2004 年 11 月,美国 FDA 批准 Biogen Idec 公司生产的一种治疗多发性硬化症的新药那他珠单抗(natalizumab,商品名:Tysabri),由于出现了一种罕见的中枢神经系统严重不良反应(进行性多病灶脑白质病)和死亡病例,上市仅 3 个月就宣布从市场撤出并停止使用;另外治疗类风湿性关节炎药物英夫利昔单抗(infliximab),上市后发现有严重的肝脏毒性,还可能出现白细胞、粒细胞和全血细胞减少,引起严重感染,危及生命或死亡,FDA 要求该企业对其说明书进行修改和加黑框警告。

2005 年 4 月 7 日 FDA 向公众和医疗机构发布了对 21 种非甾体抗炎药(NSAIDs)上市销售的警示:包括所有选择性 COX-2 抑制剂和非选择性(传统)非甾体抗炎药(包括处方药和非处方药),FDA 要求生产厂商修改其使用说明书,增加黑框警告,提醒使用这些药物存在增加心血管疾病和胃肠道出血等的潜在风险。随后 FDA 网站上发布了许多药品的安全警告,其目的是指导非甾体抗炎药谨慎并合理地使用,在保证治疗效果的同时,将风险降至最小。

2.1.3 相关监管部门对于新药的审批越来越严格 以美国为例:美国 FDA 批准的新药数量近年来持续保持低的态势,业界人士分析其原因为美国相关法规更为谨慎,而且制药企业缺乏创新药物所致。

2008 年美国 FDA 共批准了 65 种新药,是 1999 年以来最少的一年。2007 该局批准了 64% 的申请,比 2006 的 73% 有所下降。

追究新药数量锐减的原因,FDA 和制药公司看法不一。制药行业认为 FDA 在批准新药时更加小心,因为最近几年 FDA 因批准一些具有风险性的药物而遭受批评,如止痛药 Vioxx 和 Bextra,这两种药都已不在市场上销售。如果新药相对于已有的药物没有明显的优势,同时含有未知的风险,FDA 不倾向于批准上市。FDA 认为他们遴选新药的标准并未改变,新药的批准率在 1997~2005 年期间稳定地保持在 80% 左右。

2.1.4 新药研究陷入困境的其他原因 与过去相比,开发创新药物愈发艰难,现在已经逐渐成为所有跨国制药企业的难题。全球性的新药研发陷入困境的原因还有以下几个方面。

(1) 基因组学研究陷入困境

虽然 20 世纪 90 年代基因组学的重点研究为新药发现和开发提供了新颖的作用靶点,但缺乏对靶点有效的作用力使得生物学验证阶段成为了新药研究过程中的主要瓶颈。例如,虽然进入 II 期临床研究阶段的新药数量增加了,但大多数药物无法跨入 III 期临床研究的门槛。经过十几年的努力,基因相关药物研究就像无底洞,投入的研发成本巨大,却没有真正产出几个重磅炸弹级的新药。

(2) 利用仿生学研究开发新药,前景并不乐观

原以为最有成功希望的研究领域遭受严重打击,最经典的范例就是艾滋病疫苗,在几十个临床试验之后,人类对 HIV 病毒的了解越详尽,研究出疫苗的希望越渺茫。

(3) “靶点旁路”研究

从癌症发生的活性蛋白做出抗癌新药曾经是创制新药的立题的出发点。但是,癌症细胞的已知蛋白、生化信号、传递通道错综复杂,特异性最强的单一靶点药物其实疗效并不理想。

3 全球新药研发机遇

尽管全球新药研发面临的困难重重,但是新药研究工作者并没有因此而放慢研究的步伐,种种失败反而成为激励他们不断研制新药的动力。目前,研发也存在着良好的机遇。

(1) 新药研究的新模式

新药的研究大致有两种模式,一种是针对疾病作用机制和疾病发生发展过程进行了解,从中找到疾病发生发展过程的某个环节,用来作为药物治疗的靶点,研制临床上有效的药物;另一种是依赖计算机辅助进行药物设计,利用分子生物学、结构生物学的成果,了解药物作用靶分子的三维结构,用计算机辅助设计药物。这两种方法是相辅相成的,研究人员既要了解疾病的发生过程,又要了解这些靶分子的三维空间结构。

通过蛋白质组学的研究,找到有功能的蛋白质,把这些功能蛋白质或晶体蛋白质做成各种数据库,比如三维结构数据库、功能数据库,采用分子生物学等方法对其进行分析,得到很多有用的信息。这些信息为药物研究提供了新的模式,即:用计算机模拟的方法进行大量的药物筛选。在传统模式中,一般采用动物或者细胞做成模型,进行药物筛选,效率很低。

如果利用计算机辅助,采用化学模拟的方法,将几十万个,甚至几百万个化学小分子设计

成和生物大分子相互作用的模型,了解它们相互作用的各种参数,采用打分的方式对其进行评价,就可进行初步的药物筛选。而传统的方法是一个化合物一个化合物地筛选,现在是采用高通量的筛选方法。这样一种新的模式在药物的合成方面改变了许多传统的方法。过去是将化合物一个个地合成,现在采用组合化学的方法,利用现代化的仪器,一批可以合成几百个甚至几千个化合物。因此,模式的转变使得药物研制的效率大大提高,效率的提高给药物的研发注入了新的活力。新的药物研究模式改变了过去盲目的、命中率非常低的药物研究方法,使我们能更有目的地去寻找新的药物。

(2) 药物生物技术的蓬勃发展,为研制新药研发提供了重要的理论基础和新的技术支撑。

(3) 新的靶点不断涌现

尽管基因组学研究困难重重,但是人类基因组计划的完成对新药研究将产生革命性的影响,为药物研究提供了一个非常好的机遇。人类利用基因组学研究寻找药物靶点的工作一刻也没有停留。进一步研究各种基因的功能,了解这些基因可以找到一些药物治疗靶点的新生物靶分子。

(4) 虽然新药开发与早些时候相比难度增加,但是,制药厂商仍然认为存在开发的空间及领域,特别是对于创新空间大的生物技术、疫苗、药物的新靶点的发现方面,开发商期望有所突破,力争发现“重磅炸弹”级的新药,为企业带来高额的利润回报。

(5) 医疗卫生事业的发展,对包括癌症在内的重大疾病治疗药物提出了更高的要求,巨大的市场需求,激励研发企业进行深入的研究,期望为企业带来可观的经济效益和社会效益。

(6) 制药厂商广泛的重组、并购与结盟,通过强强联合,为新药研发提供了充足的资金和丰富的研发管理经验。

(7) 国内外审批和立法部门正在努力改善审批环境,为新药的研究与开发提供了更加宽松的环境。

(8) 多重机制疾病和多靶点作用药物的研发,为寻找新药提供了新的契机,如阿尔茨海默病及癌症等。

4 2003 ~ 2008 年全球上市的新活性物质 (new active substance, NAS) 与新化学实体 (new chemical entities) 分析

本课题组调研了 2003 ~ 2008 年全球上市的新活性物质与新化学实体 174 个,并以此作为全球药品研发的风向标,分析全球新药研发的动向,供我国制药企业及研究人员参考。

尽管全球新药研发正处于“瓶颈区”,但是 2003 ~ 2008 年每年仍有平均 29 个新药上市。

4.1 生物药物产品异军突起

近年来,随着生物技术与基因工程的快速发展,治疗学领域提出了生物药物 (biologic agents) 的概念。生物药物可分为:生化药物、生物制品、微生物药物及生物技术药物 4 大类。有些难以成规模化生产的微量生命活性物质,经分离纯化研究确认其结构、药效后,利用生物技术方法进行规模化生产,统称为生物技术药物,如基因重组技术、蛋白质工程获得的在医药领域应用的产品,如基因重组多肽、蛋白质类药物、基因疫苗、反义核酸药物等。生物制药行业前景广阔,受新技术、新材料等高新技术产业发展的带动,成为全部医药工业中资产增长最快的行业。目前生物医药产业的销售额已成为上市新药中继化学制药之后所占份额做多的新产