**重庆市科技进步奖公示**

1. **项目名称**：药物新制剂关键技术及其产业化应用

**二、提名单位：**重庆市渝中区人民政府

**三、提名等级：**重庆市科技进步奖 二等奖

**四、主要完成单位：**重庆医科大学、福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司

**五、主要完成人：**余瑜、张涛、王杰、王立、刘宇、徐霞

**六、项目简介：**

本项目围绕药物制剂学科发展、地区和国家重大需求，且高度重视校企的产学研合作成果转化“落地”的产品成新质生产力。药物的溶解及其制剂选择涉及到药物的吸收、分布、药效和安全性，是制剂技术的世界性难题，其技术的优劣标志着一个国家医药和医疗科学水平的高低，因此，本项目的校企合作研究团队瞄准药物新制剂技术的国际发展前沿，着力攻克临床治疗药物口服吸收少、选择性差等重大共性关键问题。经过10多年的努力，构建了药物新剂型关键技术研究平台，取得了一系列创新型研究成果：创建和完善了口服制剂、长效注射剂和脂质体关键技术体系，并在药物制剂中获得广泛和成功的应用，实现了从无到有突破，促进了药物吸收，改变分布，提高药效和降低毒性，着力解决了药物的溶解、吸收等问题方面受到的限制。

1. 创建口服制剂技术。利用体内外相关性评价关键技术平台，以反向解析技术和体内外相关性评价为核心，采用制剂显微结构分析、拉曼光谱分析等手段，以原研药物制剂为对照，结合高精度药物溶解速度分析和体内数据处理等评估，成功应用于口服制剂的产业化。其关键是确保药物以分子状态分散，通过大量筛选优化，突破了辅料选择、制剂技术落后等难题，开发成功新配方。完成了25项的开发和注册工作，其中15项向SFDA申报注册，10项已获得新药证书，有5项获准上市，其中枸橼酸托瑞米芬片、巴氯芬片为国内的首家。

2. 创建长效注射剂技术。利用新型液晶凝胶技术，成功应用于长效注射剂的产业化。重点攻克药物液晶凝胶、稳定缓释等关键工艺技术难题，使酒石酸布托啡诺注射剂质控标准提升，该制剂质量稳定、生物相容性和安全性都很好。完成了6项向SFDA申报注册，7项已获得新药证书。

3. 创建脂质体肺靶向给药技术。已获发明专利（ZL200910 103135.X）及PCT专利（WO/2010/083778）。项目以多西他赛为模型药物，开展肺癌靶向递送系统的DbaumNC专利新技术多西他赛脂质体研究，该脂质体技术能将多西他赛主要（90%以上）传递至肺部，解决了其肺靶向的科学问题，显著提高了疗效，降低了毒副作用；突破了现有脂质体工业化生产较难的瓶颈问题，具有工业化生产的前景。

本项目创建的口服制剂、长效注射剂和脂质体等关键药物新制剂技术，成功实现了多种高端制剂的产业化，并产生了显著的社会经济效益，极大地推动了本领域科学技术的发展，有效地促进了高端制剂行业的进步。

本项目药物新制剂技术在多家高新企业成功转化，创建的药物新制剂技术目前仍然是最先进的口服促吸收技术；也将成为多种先进药物新制剂技术与高价值产品的开发基础。

本项目构建的新型药物制剂及其关键技术平台，涵盖抗肿瘤、中枢神经系统等治疗领域，其中研发的枸橼酸托瑞米芬片、巴氯芬片、盐酸昂丹司琼片、盐酸格拉司琼片、盐酸乐卡地平片、酒石酸布托啡诺注射液等药品，具有较强的推广性、较好的临床应用前景和市场竞争力。创新制剂累计销售约13亿元，3年销售约8亿；培育出二个年销售过亿的大品种（枸橼酸托瑞米芬片、酒石酸布托啡诺注射液）。

**七、主要知识产权和标准规范等目录：**

|  |  |  |  |  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- |
| **知识产权（标准）类别** | **知识产权（标准）**  **具体名称** | **国家**  **（地区）** | **授权号（标准编号）** | **授权（标准发布）日期** | **证书编号 （标准批准发布部门）** | **权利人（标准起草单位）** | **发明人（标准起草人）** | **发明专利（标准）有效状态** |
| **发明专利** | **注射用肺靶向载药前体脂质体及其使用方法** | **中国** | **ZL200910103135.X** | **2011-03-16** | **747373** | **重庆医科大学** | **余瑜，赵领，李伟，钟小东，梁艳，张雪梅** | **有效** |
| **发明专利** | **LUNG TARGETING INJECYABLE PHARMACEUTICAL COMPOSITION LIPOSOME** | **中国** | **WO/2010/083778** | **2010-01-23** | **WO/2010/083778** | **重庆医科大学** | **YU Yu，LI Wei，LIU Yu，ZHAO Ling** | **有效** |
| **其他** | **枸橼酸托瑞米芬片** | **中国** | **国药准字H20061284** | **2021-05-06** | **2021B01328** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **巴氯芬片** | **中国** | **国药准字H19980103** | **2022-05-16** | **2022B02074** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **盐酸昂丹司琼片** | **中国** | **国药准字H10960146** | **2023-02-20** | **2023B00838** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **非布司他片** | **中国** | **国药准字H20233188； H20233189** | **2023-02-14** | **2023S00226；**  **2023S00227** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **枸橼酸托法替布片** | **中国** | **国药准字H20233279** | **2023-03-15** | **2023S00345** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **酒石酸布托啡诺注射液** | **中国** | **国药准字H20233094； H20233095** | **2023-01-29** | **2023S00112;**  **2023S00113** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **盐酸左西替利嗪口服溶液** | **中国** | **国药准字H20234579** | **2023-12-05** | **2023S01918** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |
| **其他** | **吡拉西坦片** | **中国** | **国药准字H20247002** | **2024-01-02** | **2024B00009** | **福安药业集团重庆礼邦药物开发有限公司** |  | **有效** |