



刘昌孝,湖南永兴人,药代动力学专家,中国工程院院士。现任天津药物研究院学术委员会主任和名誉院长,释药技术与药代动力学国家重点实验室主任,中国药理学学会副理事长,天津药学会理事长,天津药理学学会理事长,中国药典委员会执行委员等职。曾承担多项国家重大研究项目,获得 34 项(次)国内和国际不同级别的科技成果奖。

卷首语 Foreword

科技导报 2011,29 (27)

创新释药技术,引领高端制剂发展

当前,药物研发进入制剂创新时代,药物释放技术是药物创新的前沿,它推动着医药产业的发展。创新制剂的研发与新实体药物的研发比较具有成本低、周期短、见效快等优势。虽然中国药物释放技术近年有较迅速的发展,但仍低于国际先进水平。国内释药技术基础理论研究比较落后,特别是理论与实际的结合和产业化研究欠缺,严重影响成果转化。近几年为加速释药技术发展,国家科技部采取和启动了释药技术相关的国家重点实验室建设的重要举措。

新药开发风险越来越大,技术要求显著提高,药物研发进入了制剂创新的时代,新型高端制剂的研究已成为药物创新的前沿。因此国外一些大公司由新实体药开发转向制剂研发,其药物制剂创新之路值得中国借鉴。新型高端制剂的研究开发是中国医药产业发展和转型的必由之路,通过它的发展,可扭转低端原料药生产高消耗、高污染和低值出口的落后局面。在巨大的国际市场上,特别是国家出台了“十一五”、“十二五”重大创新专项以及一系列的配套政策,都为中国制药业新型高端制剂的研究开发和产业化带来发展的机遇,同时也使其面临着严峻的挑战。

国内创新制剂发展面临挑战。首先,制剂研发需要强大的资金做后盾;管理软件不足,不能达到国际注册要求的数据和 cGMP 条件;国际制剂技术人才、国际认证人才、知识产权保护意识缺乏,专利起点低。其次,在策略上既要考虑开发具有核心竞争力的产品,又需要兼顾国际、国内高端市场和国际合作,建立良好机制掌握创新制剂技术,实现产品的更新换代,将高端制剂进入国际市场。第三,应对创新制剂国际化应突破技术瓶颈的挑战,实现高端制剂国际化,需要考虑研发的技术壁垒;要拥有自主知识产权,就要考虑回避已有专利。第四,研发高端制剂的关键是突破产业化的技术瓶颈。以蛋白质多肽药物为例,长效药物微球可以长时间发挥体内疗效作用,减少给药次数,降低药物在体内转运过程中代谢消除和药物毒副作用。而蛋白质多肽药物的产业技术瓶颈在于载药技术和制备技术研究。为此需要解决这类产品的设备、技术、工艺、辅料、质量标准等,而且需要拥有自己的核心技术,只有这样才能开发高端制剂产品,增强国际竞争力。

必须考虑制剂产品国际化的策略,开发具有核心竞争力的高端创新制剂,采用多种灵活的合作方式,充分利用国内的资源和成本优势,找准制剂创新发展方向。以下发展方向值得思考:

- 1) 药物传输系统设计理论和技术:化学小分子药物新型口服缓释及控释系统的设计、靶向给药系统、无损伤给药系统的设计及相关方法学研究给制剂创新提出新目标。
- 2) 现代中药制剂:现代中药制剂的优势取决于中药复方的物质基础、药效基础与中药理论的结合。
- 3) 生物技术制剂:生物大分子药物品种迅速增加,对非注射给药剂型,无损伤性的口服给药途径和经皮给药途径剂型研究的要求增加。
- 4) 生物芯片和基因治疗系统:生物芯片是药物制剂的重要组件,生物芯片的规范化、精确化和实用化是其应用于生物医学领域的突破。生物芯片将加速基因疗法的发展,提高人类基因的破译速度。生物芯片、电脑芯片和微传输系统结合,实现生物传感、信息控制和反馈、药物传输的一体化。基因治疗利用基因转移技术将外源重组基因或核酸导入人体靶细胞内,以纠正基因缺陷或其表达异常。利用灭活病毒、脂质体和其他微粒形成载体系统,通过传输系统的设计实现基因有效转移并顺利表达。

在自主创新的思想指导下,认清挑战严峻性,找准制剂创新发展方向,突破释药的技术和产业化的技术瓶颈,我国高端创新制剂发展一定前途光明!

刘昌孝

(天津药物研究院,释药技术与药物动力学国家重点实验室,天津 300193)

