
抗艾滋病新药塞拉维诺获批进入临床研究

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/5066.html>

本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

抗艾滋病新药塞拉维诺获批进入临床研究。由中国科学院上海药物研究所和中国科学院昆明动物研究所合作开发的抗艾滋病化学1类新药塞拉维诺(Thioraviroc)于5月5日获得国家药品监督管理局颁发的临床试验通知书，同意开展临床试验。

塞拉维诺是由上海药物所研究员柳红、中科院院士蒋华良和研究员吴蓓丽课题组以及中科院昆明动物研究所研究员郑永唐课题组组成的科研团队联合开发。蒋华良课题组通过计算机辅助药物设计，采用基于结构和改变代谢途径的药物设计策略，设计新结构类型CCR5拮抗剂;柳红课题组通过高效合成技术开展CCR5拮抗剂的多轮结构改造和成药性优化;吴蓓丽课题组解析了马拉维诺和多个CCR5拮抗剂与CCR5受体的复合物晶体结构;郑永唐课题组开展CCR5拮抗剂的HIV病毒抑制活性筛选。科研团队在此基础上，紧密合作进行深入结构修饰、药效评价和成药性优化，发现候选药物塞拉维诺——一种具有全新骨架的CCR5拮抗剂。临床前研究结果显示，与现有唯一针对CCR5靶点的临床药物马拉维诺相比，塞拉维诺对CCR5受体具有更好的拮抗活性，对多种艾滋病病毒株、临床株以及耐药株的抑制活性和治疗指数优于上市药物马拉维诺或与其相当;塞拉维诺具有良好的大鼠和犬的药代动力学特性，种属差异小、对CYP450酶无抑制和诱导作用，无潜在的药物-药物相互作用;安全性良好。塞拉维诺及其系列化合物目前已获得美国、欧洲、俄罗斯、韩国和澳大利亚等国的专利授权。

塞拉维诺是国内首个获批进入临床研究的CCR5受体拮抗剂，曾先后获得十三五“重大新药创制”科技重大专项、中科院战略性先导科技专项以及中科院自主部署项目等的资助;早期的基础研究工作发表在国际期刊Science(Science2013, 341, 1387-1390)和Journal of Medicinal Chemistry上(J. Med. Chem.2018,61, 9621-9636)上。

上海药物所谢欣课题组开展了CCR5拮抗剂细胞水平的活性筛选工作。塞拉维诺研发还得到上海药物所药物代谢中心研究员陈笑艳、神经药理学研究国际科学家工作站研究员高召兵、中国药科大学安评中心教授杨勇等课题组的大力支持。

目前该项目现正在开展临床I期研究的准备工作。



抗艾滋病新药塞拉维诺获批进入临床研究

更多 科学进展 请访问 <https://www.iikx.com/news/progress/>

本文版权归作者所有，请勿用于商业用途，[爱科学iikx.com](https://www.iikx.com)转发