



浙江医药股份有限公司李春波董事长（右一）、台湾太景生物科技有限公司许明珠董事长（右四）与专家合影

喹诺酮类修饰创新不断拓展

复旦大学附属中山医院何礼贤教授系统讲述了喹诺酮类抗菌药物的过去、现在与未来。他介绍，从 1962 年第一代喹诺酮问世，到新一代不含氟的无氟喹诺酮类奈诺沙星于 2014 年在台湾地区上市，再到 2016 年大陆上市，其抗菌谱广、抗菌力强的特点得到肯定。

目前，喹诺酮类仍保持较高的临床需求。但近年来喹诺酮类药物遭遇诟病或指责增加，需正确客观地看待喹诺酮的快速耐药和交叉耐药、附加损害、不良反应等问题，而这些可通过评估和优选药物，从而有效避免。

独特结构成就了优势性能

“与传统的喹诺酮相比，奈诺沙星最大的优势是，为不含氟的 C8 - 甲氧基结构的喹诺酮类药物。”太景生物科技临床发展部张俐雯资深主任介绍了奈诺沙星的研发历程。

张俐雯主任说，研发团队通过多项研究发现，奈诺沙星通过去掉 6 位氟原子，改变侧链结构，加强了抗革兰阳性菌活性。

她强调，奈诺沙星可使高度耐药的细菌无法存活；且不会诱导 ParC 的突变，依然维持高度的抗菌活性；最不容易诱导耐药菌株的出现；不良反应亦明显降低。

药效学研究奠定卓越证据

奈诺沙星体外抗菌作用研究者、复旦大学附属华山医院抗生素研究所朱德妹教授指出，研究发现，奈诺沙星抗菌谱广，对需氧革兰阳性菌，包括其中的耐多药者如 MRSA、MRCNS、以及 PRSP 等均具有高度的抗菌活性和杀菌作用，并明显优于左氧氟沙星、环丙沙星和莫西沙星等。

研究发现，奈诺沙星对 MRSA、PRSP 和大肠埃希菌等的杀菌浓度检测结果显示，其具有较强杀菌作用；对上述细菌检测结果提示，奈诺沙星属浓度依赖型杀菌剂；对 CAP 的常见病原菌，包括肺炎链球菌、金葡菌、嗜血杆菌属、肺炎支原体等均具有良好的抗微生物作用。



奈诺沙星临床研究特殊贡献奖颁奖现场

奈诺沙星全国上市亮相

十年专研 结构独特 优势尽显

▲ 本报记者 许奉彦

究竟是什么样的药物上市，吸引了来自感染、呼吸、重症医学等领域的全国 200 余位专家与医师齐聚上海中心大厦？答案是“系出名门、独具特色”。

10 月 23 日，“抗菌·新高度”太捷信®（苹果酸奈诺沙星胶囊）全国上市会举行。奈诺沙星为国家 1.1 类新药，于今年 6 月通过国家食品药品监督管理局审核、获准生产。该药属无氟喹诺酮类，抗菌谱覆盖引起社区获得性肺炎（CAP）的常见病原微生物。与其他氟喹诺酮类药物相比，该药对耐青霉素和喹诺酮的肺炎链球菌（PRSP），以及耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌（MRSA）均具有强大的抗菌活性。

该药临床研究的领衔者、复旦大学附属华山医院抗生素研究所张婴元教授，解放军总医院呼吸病研究所所长刘又宁教授，上海交通大学医学院附属瑞金医院院长瞿介明教授，台湾大学医学部附属医院感染科薛博仁教授担任大会主席，同时全国知名的呼吸、感染、重症医学专家也悉数到场。

张婴元教授回顾，该药的研发始于本世纪初，自 2005 年开始进行体外药效学研究至目前获准生产并上市所进行的一系列研究，“可以说，奈诺沙星从开始研发到上市之路都是高起点、高要求！十年来，全面的评价结果让我们有信心宣布，奈诺沙星治疗 CAP 的有效性与安全性值得信赖！”

“十年磨一剑”，参与了奈诺沙星药物评审的刘又宁教授充分肯定了该药的高起点。他强调，该药的上市体现了创新思想，体现了科学为本，体现了为患者服务的最大追求。

浙江医药股份有限公司李春波董事长在致辞中介绍，浙江医药一直推行科技兴企、科技强企方针。医药行业的创新并不容易，研发新药往往要 10 年甚至 20 年，浙江医药始终秉承对社会负责、对患者负责、对医生负责也是对自身企业负责的态度，按照世界标准做药，实现了从“创仿结合，以仿为主”到“创仿结合、以创为主”的历史跨越。

为了感谢奈诺沙星从研发到 I ~ III 期临床研究作出突出贡献的专家，会议特举行“奈诺沙星临床研究特殊贡献奖”颁奖仪式！

焦点讨论

瞿介明、薛博仁教授共同主持了焦点讨论环节，引发了在场专家的热烈讨论。

浙江大学医学院附属邵逸夫医院副院长俞云松教授提出，目前，社区获得性 MRSA 在临床中呈上升趋势，奈诺沙星对 MRSA 的抗菌活性对临床具有一定意义，在覆盖 MRSA 的同时还可覆盖非典型病原体，将是很好的选择。

解放军总医院药物临床

试验机构主任王睿教授指出，与传统喹诺酮类相比，奈诺沙星作为新型的喹诺酮药，更不易产生耐药性是其最大特点。

复旦大学抗生素研究所所长王明贵教授认为，目前对 MRSA 研究的口服抗菌药很少。研究显示，奈诺沙星对 MRSA 的体外抗菌活性强，同时不易诱导细菌耐药，为临床提供了较佳的选择。

专家们表示，奈诺沙星有

许多特点和作用还有待于共同探讨，如奈诺沙星的药敏折点、肾功能减退患者中的应用、适应证的进一步扩大等。专家们各抒己见，为奈诺沙星的未来之路献计献策。

多位教授均提出，对药物的不断学术研究的过程就是使其保持生命力的过程，希望上市后临床研究等工作及早开展，从而让更多的患者获益，那才是最大的目标。



现场专家针对奈诺沙星的焦点问题展开热烈讨论

开展临床药理研究是临床试验成功的关键之一

复旦大学附属华山医院抗生素研究所副所长张菁教授介绍了奈诺沙星药代动力学特性，以及奈诺沙星药代动力学 / 药效学研究。结果发现，奈诺沙星口服吸收完全，生物利用度达 100%，在体内广泛分布，不被 P450 酶等代谢，主要通过肾脏排泄。PPK 研究结果提示，70 岁以下老年患者、不同性别、不同体重者（包括肥胖者）及轻度肾功能减退者（肌酐清除率 >50 ml/min）均不需调整用药剂量。

研究制定的给药剂量为：成人 CAP 患者（≥ 18 岁）口服奈诺沙星胶囊 500mg，每日 1 次。在此剂量下治疗由敏感细菌包括肺炎链球菌、流感嗜血杆菌、金葡菌及肺炎支原体等所致 CAP，可获得最佳临床和微生物学疗效。

临床数据夯实了上市之路

复旦大学附属华山医院抗生素研究所吴菊芳教授介绍了在 2009 年 8 月至 2012 年 8 月完成的奈诺沙星的 II / III 期临床研究结果。研究涵盖 II 期的 26 家中心，III 期的 53 家中心，后者包括中国大陆（40 家）及台湾地区（13 家），连同之前在南非等地进行的 II 期临床试验 1 项，共对近 1000 例的 CAP 患者进行了奈诺沙星的有效性和安全性评价。

通过 II / III 期临床研究发现，苹果酸奈诺沙星胶囊 500mg，每日 1 次，口服 7~10 d 治疗 CAP 具有良好的临床疗效和微生物学疗效。与左氧氟沙星片 500 mg，每日 1 次，口服 7~10 d 相比，其具有相仿的临床疗效和微生物学疗效。分析证实，奈诺沙星胶囊治疗 CAP 的临床疗效非劣效于左氧氟沙星。奈诺沙星胶囊发生的临床不良事件和实验室检查异常多数轻微，呈一过性，患者耐受性良好。与对照组相比，其不良事件发生率两组间差异无显著性。

依据临床试验结果，推荐口服奈诺沙星 500 mg，每日 1 次作为 CAP 的常规治疗剂量，疗程推荐为 7~10 d。