**上海市技术发明奖提名书**

**（2020年度）**

**一、项目基本情况**

|  |  |
| --- | --- |
|  |  |
| 提名者 | 上海市教委 | 提名等级 | 特等 |
| 项目名称 | 抗RNA病毒DHODH候选药物的发现与应用 |
| 主要完成人 | 李洪林、徐可、徐玉芳、赵振江、刁妍妍、朱丽丽、李诗良、钱旭红、黄瑾、王蕊、朱俊生、宋文琳、任小利、王佳炜、栾国琴 |
| 主要完成单位 | 华东理工大学、武汉大学 |

**四、知识产权情况（限10个）**

|  |  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- | --- |
| 国别 | 知识产权类别 | 授权号 | 名称 | 发明人 | 核心专利 |
| 中国、PCT、美国、欧洲、日本 | 发明专利 | CN107382902A（公开）、WO2017/198178A（公开）、US2019292162 (A1)（公开）、EP3459937(A1) （公开）、JP2019519604 (A) （公开） | 噻唑类衍生物及其应用 | 李洪林、徐玉芳、王蕊、赵振江、宋文琳、徐刘昕 | 是 |
| 中国 | 发明专利 | 202010136724.4（申请） | 抗 RNA 病毒药物及其应用 | 李洪林、徐可、李诗良、朱丽丽、赵振江 | 是 |
| 中国 | 发明专利 | 202010099375.3（申请） | 抗RNA病毒药物及其应用 | 李洪林、徐可、赵振江 | 是 |
| 中国、PCT、美国 | 发明专利 | 201610392348.9（申请）、WO2017/206955A（公开）、US2019134008(A1) （公开） | 新型噻唑类衍生物在治疗病毒感染中的应用 | 徐可、李洪林、徐玉芳、赵振江、朱丽丽、宋文琳、童依 | 否 |
| 中国 | 发明专利 | ZL201510961003.6（授权） | 噻唑类衍生物及其在抑制二氢乳清酸脱氢酶中的应用 | 李洪林、徐玉芳、赵振江、宋文琳、李诗良、王佳炜、全丽娜、徐刘昕、王蕊、朱丽丽 | 否 |
| 中国、PCT | 发明专利 | ZL201280048338.3（授权）、WO2013/075596A1（公开） | 作为DHODH抑制剂的噻唑衍生物及其应用 | 赵振江、黄瑾、李洪林、徐玉芳、朱丽丽、韩乐、许鸣豪、高瑞、刁妍妍、朱俊生、曹贤文、崔坤强 | 否 |
| 中国、PCT、瑞士、德国 | 发明专利 | ZL201280048200.3（授权）、WO2013/075596A1（公开）、CH707498B1（授权）、DE112012004878T5（公开） | 作为DHODH抑制剂的五元二氢杂环酮类衍生物及应用 | 李洪林、赵振江、黄瑾、徐玉芳、许鸣豪、刁妍妍、周洪昌、金黄涛、高瑞、朱俊生 | 否 |
| 中国、PCT | 发明专利 | 201710262810.8（申请）、WO2018/192535A1（公开） | 噻唑衍生物在治疗非淋巴细胞性白血病中的应用 | 李洪林、陈卓、赵振江、齐甜甜、杨婷媛、宋文琳、韩乐、孙德恒 | 否 |
| 中国、PCT | 发明专利 | 201510319723.2（申请）、WO20161/97959A（公开） | 检测二氢乳清酸脱氢酶的化合物 | 徐玉芳、李洪林、赵振江、朱丽丽、许鸣豪、吴方舒、朱俊生、王佳炜、李诗良、陈卓 | 否 |
| 中国、PCT、美国 | 发明专利 | 201610329012.8（申请）、WO2017/198179 A（公开）、US2019290620 (A1) （公开） | 新型噻唑类衍生物在治疗炎性肠病中的应用 | 李洪林、赵振江、王蕊、徐玉芳、王婉琦、杨迎芳 | 否 |

**五、发表论文、著作情况（限20篇）**

|  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- |
| 序号 | 论文著作 | 通讯作者 | 引用次数 |
| 1 | Junsheng Zhu#, Le Han#, Yanyan Diao#, Xiaoli Ren, Minghao Xu, Liu-Xin Xu, Shiliang li, Qiang Li, Dong Dong, Jin Huang, Xiaofeng Liu, Zhenjiang zhao, Rui Wang, Lili Zhu\*, Yufang Xu, Xuhong Qian\*, and Honglin Li\*. Design, Synthesis, X-ray Crystallographic Analysis, and Biological Evaluation of Thiazole-Derivatives as Potent and Selective Inhibitors of Human Dihydroorotate Dehydrogenase [J]. ***J. Med. Chem.***, 2015, 58(3): 1123-1139 | 朱丽丽、钱旭红、李洪林 | 25 |
| 2 | Minghao Xu#, Junsheng Zhu#, Yanyan Diao#, Hongchang Zhou, Xiaoli Ren, Deheng Sun, Jin Huang, Dongmei Han, Zhenjiang Zhao, Lili Zhu\*, Yufang Xu\*, and Honglin Li\*. Novel Selective and Potent Inhibitors of Malaria Parasite Dihydroorotate Dehydrogenase: Discovery and Optimization of Dihydrothiophenone Derivatives [J]. ***J. Med. Chem.***, 2013, 56 (20): 7911–7924 | 朱丽丽、徐玉芳、李洪林 | 25 |
| 3 | Yanyan Diao#, Weiqiang Lu#, Huangtao Jin, Junsheng Zhu, Le Han, Minghao Xu, Rui Gao, Xu Shen, Zhenjiang Zhao, Xiaofeng Liu, Yufang Xu, Jin Huang\*, and Honglin Li\*. Discovery of Diverse Human Dihydroorotate Dehydrogenase Inhibitors as Immunosuppressive Agents by Structure-Based Virtual Screening [J]. ***J. Med. Chem.***, 2012, 55: 8341-8349 | 黄瑾、李洪林 | 22 |
| 4 | Shiliang Li#, Guoqin Luan#, Xiaoli Ren#, Wenlin Song, Liuxin Xu, Minghao Xu, Junsheng Zhu, Dong Dong, Yanyan Diao, Xiaofeng Liu, Lili Zhu, Rui Wang, Zhenjiang Zhao\*, Yufang Xu\*, Honglin Li\*. Rational Design of Benzylidenehydrazinyl-Substituted Thiazole Derivatives as Potent Inhibitors of Human Dihydroorotate Dehydrogenase with in Vivo Anti-arthritic Activity [J]. ***Sci. Rep.***, 2015, 5: 14836 | 赵振江、徐玉芳、李洪林 | 7 |
| 5 | Wenlin Song#, Shiliang Li#, Yi Tong#, Jiawei Wang, Lina Quan, Zhuo Chen, Zhenjiang Zhao, Yufang Xu, Lili Zhu\*, Xuhong Qian\*, Honglin Li\*. Structure-based Design of Potent Human Dihydroorotate Dehydrogenase Inhibitors as Anticancer Agents [J]. **Med. *Chem. Commun.***, 2016, 7: 1441-1448 | 朱丽丽、钱旭红、李洪林 | 2 |
| 6 | Jiawei Wang, Yanyan Diao, Junsheng Zhu, Shiliang Li, Zhenjiang Zhao, Honglin Li\*, Lili Zhu\*. Biological evaluation of quinoline derivatives as inhibitors of human dihydroorotate dehydrogenase [J]. ***Med. Chem. Commun.***, 2016, 7: 853-858 | 李洪林、朱丽丽 | 1 |
| 7 | 宫荥恢，刘莉，齐甜甜，李洪林，朱丽丽\*，赵振江\*. 二氢乳清酸脱氢酶抑制剂的设计、合成和构效关系研究[J]，**药学学报**，2017, 52 (2): 264-270 | 朱丽丽、赵振江 | 0 |
| 8 | 单继伟，齐甜甜，李洪林，朱丽丽，赵振江\*. 二氢乳清酸脱氢酶抑制剂前药的合成和稳定性及活性评价[J]，**药学学报**，2018, 53 (3): 410-415 | 赵振江 | 0 |
|  |  |  |  |