

浙江省科学技术奖公示信息表（单位提名）

提名奖项：自然科学奖

成果名称	新型高效 FGFR1 抑制剂的发现及其抗肿瘤活性研究
提名等级	二等奖
提名书 相关内容	<p>提名书的代表性论文（专著）目录：</p> <ol style="list-style-type: none"> 1、 Zhiguo Liu, Shufang Yu, Di Chen, Guoliang Shen, Yu Wang, Leping Hou, Dan Lin, Jinsan Zhang, Faqing Ye .Design, synthesis, and biological evaluation of 3-vinyl-quinoxalin-2(1h)-one derivatives as novel antitumor inhibitors of FGFR1. Drug Des Devel Ther. 2016 May 3;10:1489-500. 2、 Xuebao Wang, Di Chen, Shufang Yu, Zaikui Zhang, Yu Wang, Xiaolu Qi, Weitao Fu, Zixin Xie and Faqing Ye .Synthesis and evaluation of biological and antitumor activities of tetrahydrobenzothieno [2,3-d] pyrimidine derivatives as novel inhibitors of FGFR1. Chem Biol Drug Des. 2016 Apr;87(4):499-507. 3、 Faqing Ye, Liangfang Chen, Lichuan Hu, Tong Xiao, Shufang Yu, Di Chen, Yu Wang, Guang Liang, ZhiguoLiu, Sicen Wang .Design, synthesis and preliminary biological evaluation of C-8 substituted guaninederivatives as small molecular inhibitors of FGFRs. Bioorg Med Chem Lett. 2015 Apr 1;25(7):1556-60. 4、 Faqing Ye, Yuewu Wang, Siyun Nian, Yu Wang, Di Chen, Shufang Yu & Sicen Wang .Synthesis and evaluation of biological and antitumor activities of 5,7-dimethyl- oxazolo[5,4-d]pyrimidine-4,6(5H,7H)-dione derivatives as novel inhibitors of FGFR1. J Enzyme Inhib Med Chem. 2015 Dec;30(6):961-6. 5、 Ping Guo , Zixin Xie , Huan Zhang, Zaikui Zhang, Chao Han, Donghua Cheng, Dan lin, Yuan Zhang, Xuebao Wang, Xin Guo, Faqing

	<p>Ye .Design, synthesis, and biological evaluation of c-2 substituted 3h-thieno[2,3-d]pyrimidin-4-one derivatives as novel FGFR1 inhibitors. Med Chem. 2017;13(8):753-760.</p> <p>主要知识产权和标准规范目录；</p> <p>1、【发明专利】作用于 FGFR-1 的 3-乙烯基-喹喔啉-2(1H)-酮衍生物及其制备方法和用途，ZL201510180755.9，温州医科大学，2018 年 5 月 29 日，叶发青、俞淑芳、陈弟、王宇、谢自新、梁广、李校堃、王跃武、陈梁芳、宋晓琴、刘志国、林丹；有效。</p> <p>2、【发明专利】用于 FGFR1 的四氢苯并噻吩并[2,3-d]氨基嘧啶衍生物及其制备方法与应用，ZL201510274258.5，2018 年 1 月 23 日，温州医科大学，叶发青、陈弟、谢自新、刘志国、林丹、张金三、王学宝、张园、梁广、李校堃、王宇、俞淑芳；有效。</p> <p>3、【发明专利】一种作用于 FGF 受体的 4, 6-二甲基-噁唑并【5,4-d】嘧啶-5,7 (4H,6H) -二酮衍生物，ZL201410060513.1，2016 年 2 月 3 日，温州医科大学，叶发青、郭平、谢自新、刘剑敏、王跃武、宋晓琴、陈梁芳；有效。</p> <p>4、【发明专利】以 IKK-β为靶点的 2-氨基-8-取代鸟嘌呤衍生物、应用及其制备方法，ZL201410033369.2，2016 年 5 月 18 日，温州医科大学，叶发青、郭平、刘剑敏、谢自新、王跃武、宋晓琴、陈梁芳；有效。</p> <p>5、【发明专利】以 IKK-β为靶点的 2-乙酰氨基-8-取代鸟嘌呤衍生物、应用及其制备方法，ZL201410033587.6，2016 年 6 月 15 日，温州医科大学、叶发青、郭平、谢自新、刘剑敏、王跃武、宋晓琴、陈梁芳；有效。</p>
<p>主要完成人</p>	<p>叶发青，排名 1，教授，温州医科大学；</p> <p>王嗣岑，排名 2，教授，西安交通大学；</p> <p>谢自新，排名 3，实验师，温州医科大学；</p> <p>王学宝，排名 4，高级实验师，温州医科大学；</p> <p>刘志国，排名 5，研究员，温州医科大学；</p>

主要完成单位	1、温州医科大学 2、西安交通大学
提名单位	温州市人民政府
提名意见	<p>对肿瘤细胞内信号转导通路中关键分子的靶向性抑制已成为新一代抗肿瘤药物研发的焦点。FGFR 抑制剂能阻断 FGFR 磷酸化，抑制下游增殖信号传导和激活，从而抑制肿瘤发生发展，FGFR 已成为一类重要的药物靶标。</p> <p>该项目自 2014 年开始实施，主要以嘧啶、鸟嘌呤等不同母核为骨架，设计合成了不同系列的 FGFR1 抑制剂并对其体内外抗肿瘤活性进行了研究，从而发现了多个具有开发前景的新型高效的对 FGFR1 有抑制活性的化合物。该项目设计严谨，创新点突出，发表的 SCI 论文和授权的专利对开发新型高效 FGFR1 抑制剂意义重大。</p> <p>提名该项目为 2020 年度浙江省自然科学奖二等奖。</p>