

**KFN-Presskonferenz
München, den 11. Juni 2008**

Synthetische Arzneimittel Neuentwicklungen stoßen an ihre Grenzen

**Prof. Dr. Hartmut Morck
Eschborn / Marburg**

Methoden der Stofffindung

- Einzelsynthese nach Vorbildern
- Kombinatorische Chemie
- Aufbau von Bibliotheken
- Molecular Modeling (Enzyme, Rezeptoren)

Die neuen Arzneimittel der letzten 5 Jahre

	insgesamt	Synthetika	MAB	natürliche Vorbilder
2004	30	16	3	11
2005	18	10	2	6
2006	25	16	1	8
2007	30	15	2	13
2008	10	5	1	4
Gesamt	113	62	9	42

Bewertungskriterien

- **Sprunginnovationen**

Substanzen, die einen neuen Wirkungsmechanismus haben und/oder für eine neue Indikation zugelassen wurden. Hier gehören meist auch die Orphan Drugs

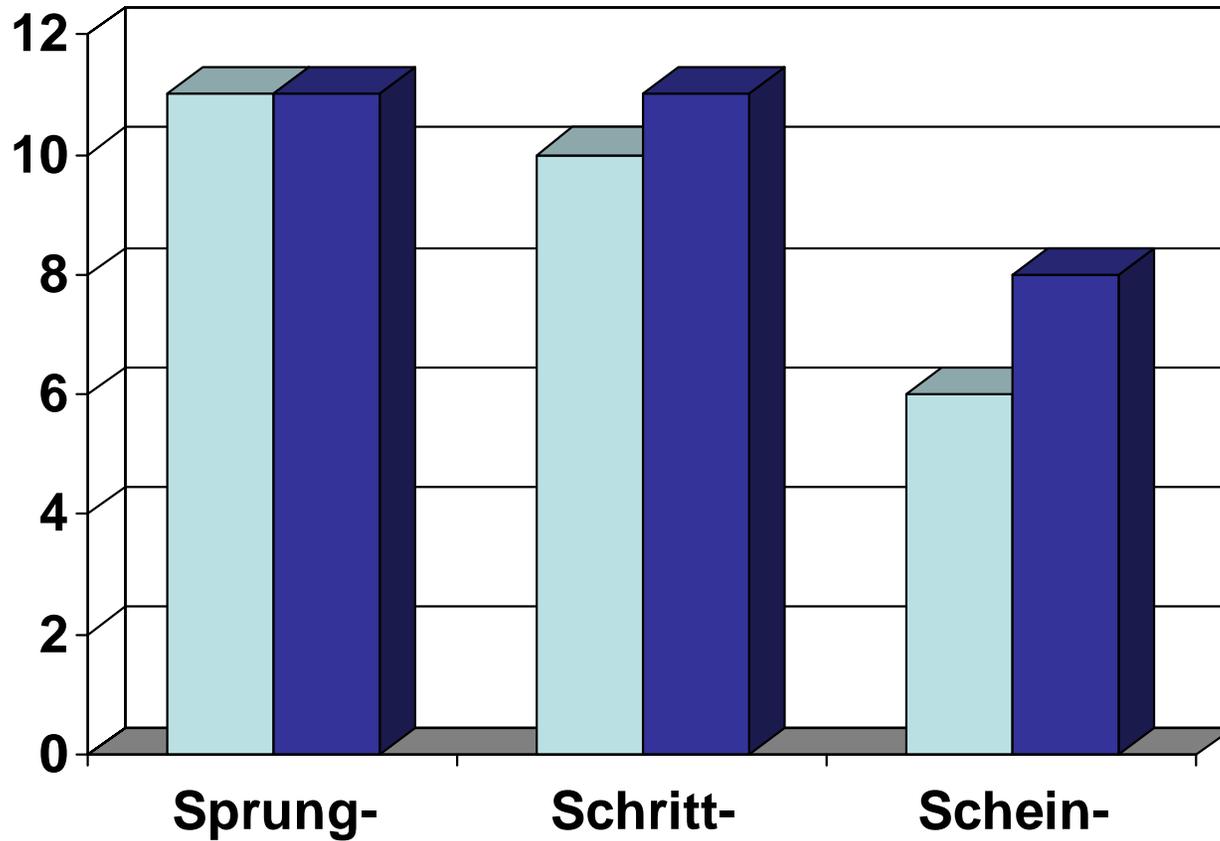
- **Schrittinnovationen**

Substanzen, die einen Fortschritt in einer bekannten Indikation bedeuten, pharmakokinetisch, pharmakodynamisch und klinisch

- **Scheininnovationen**

Substanzen, die keinen Fortschritt bringen. Sie werden auch als Analogpräparate oder Me-too-Produkte bezeichnet

Vorläufige Bewertung 2006 und 2007

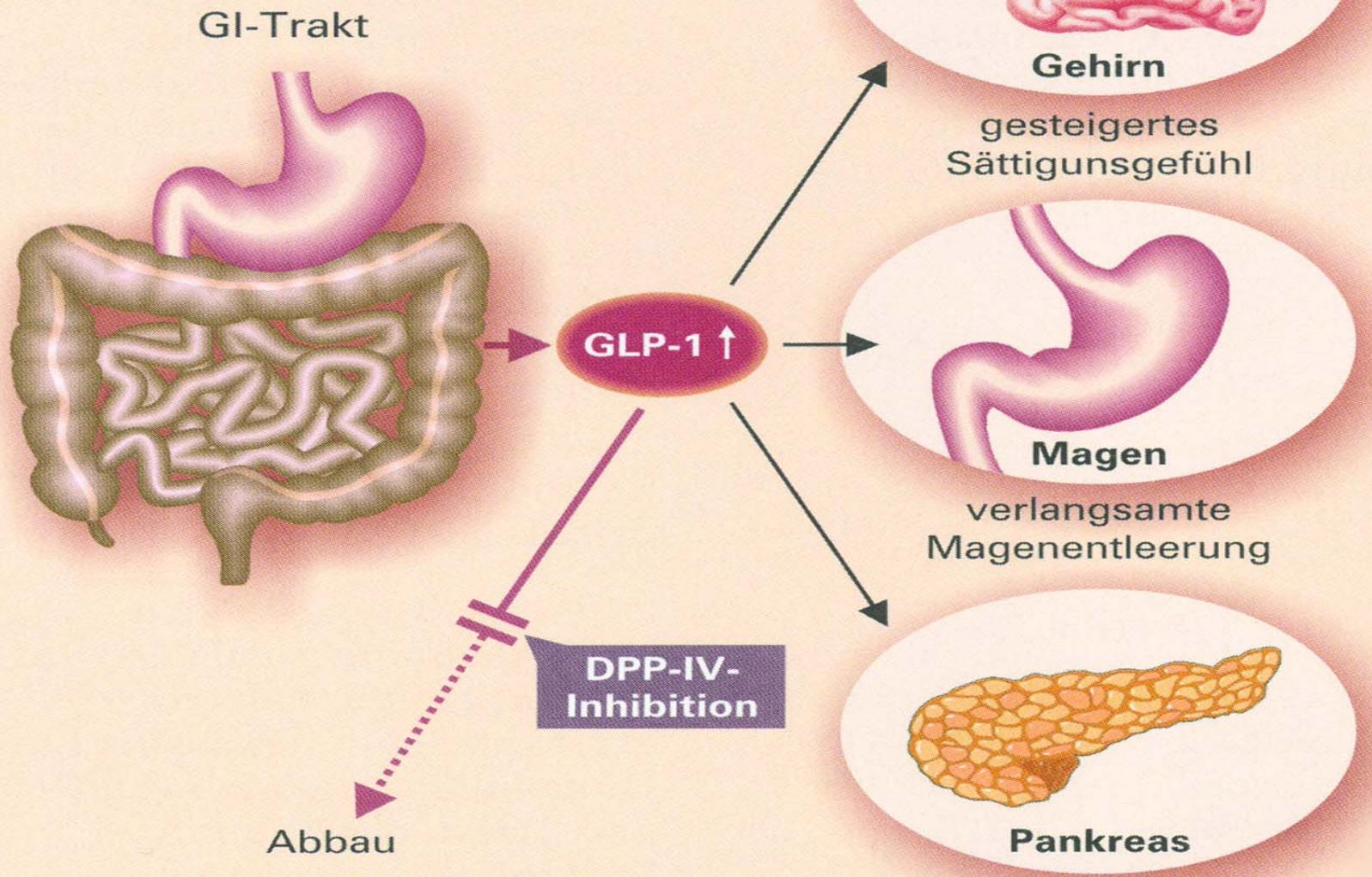


Sprunginnovationen 2007

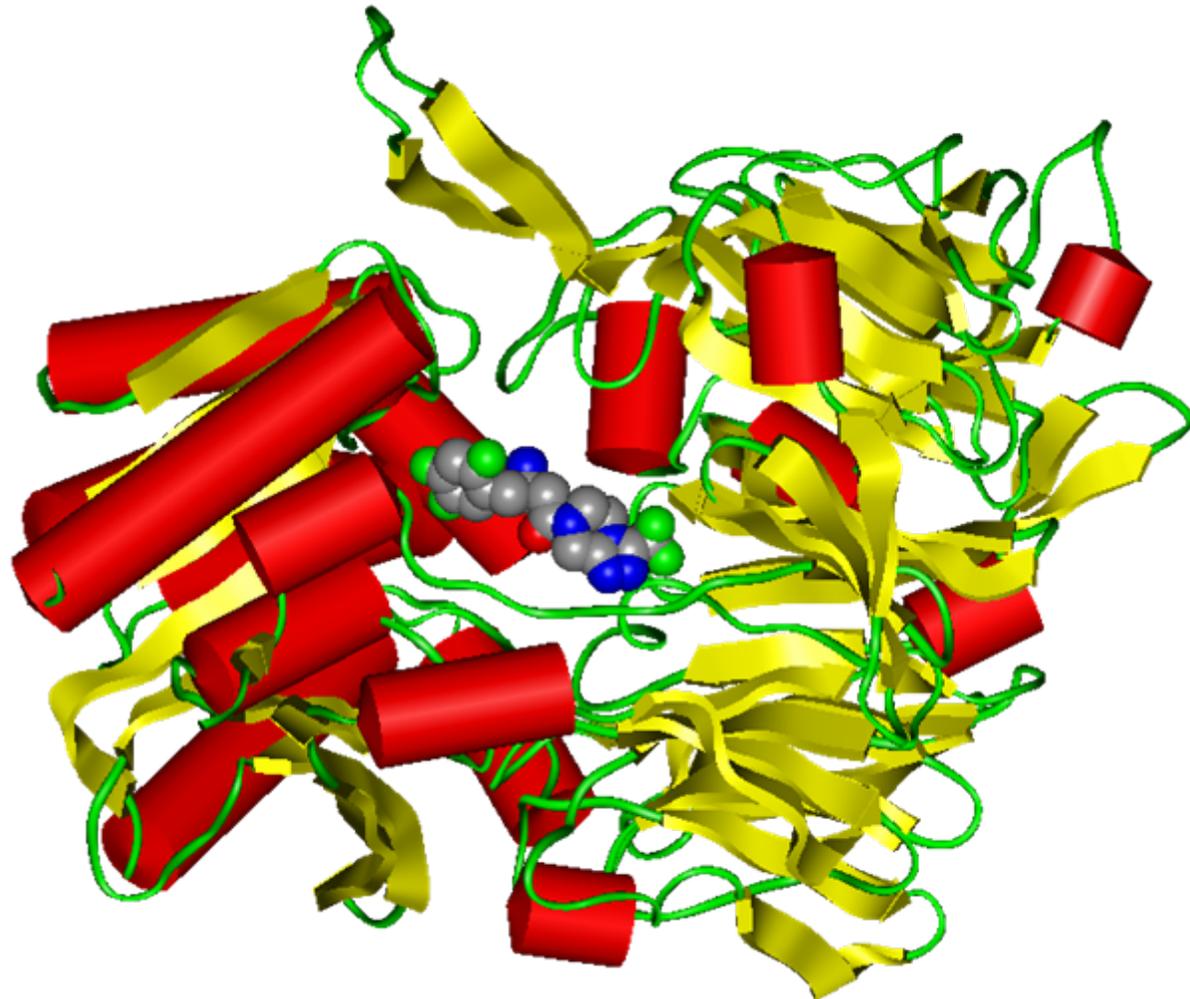
- Abatacept
- Eculizumab
- Maraviroc
- Retapamulin
- Exenatide
- Sitagliptin
- Vildagliptin
- Aliskiren
- Perflutren
- Idursulfase
- Eptotermin

Sprunginnovationen 2007

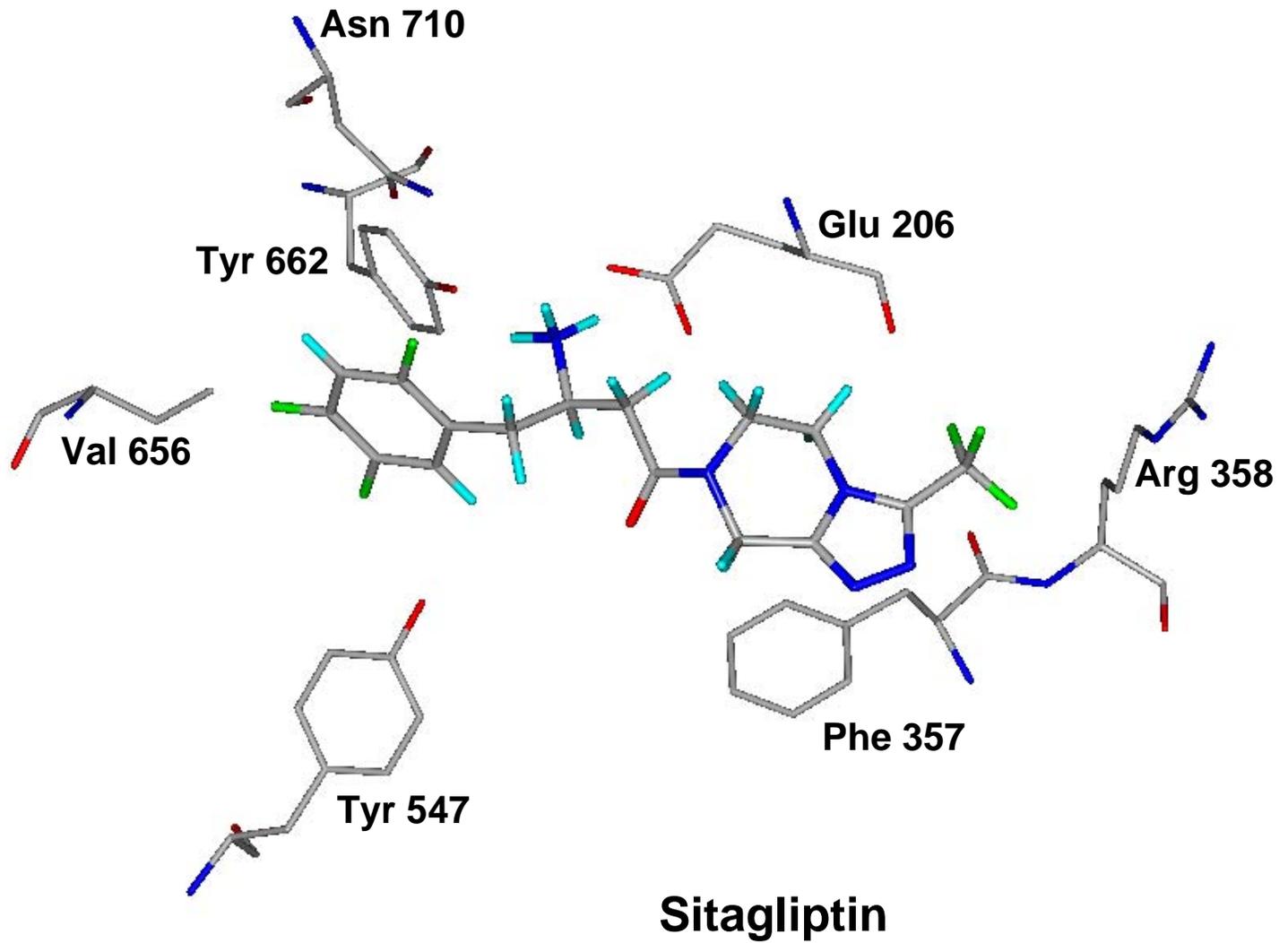
- Abatacept
- Eculizumab
- **Maraviroc**
- Retapamulin
- Exenatide
- **Sitagliptin**
- **Vildagliptin**
- **Aliskiren**
- Perflutren
- Idursulfase
- Eptotermin



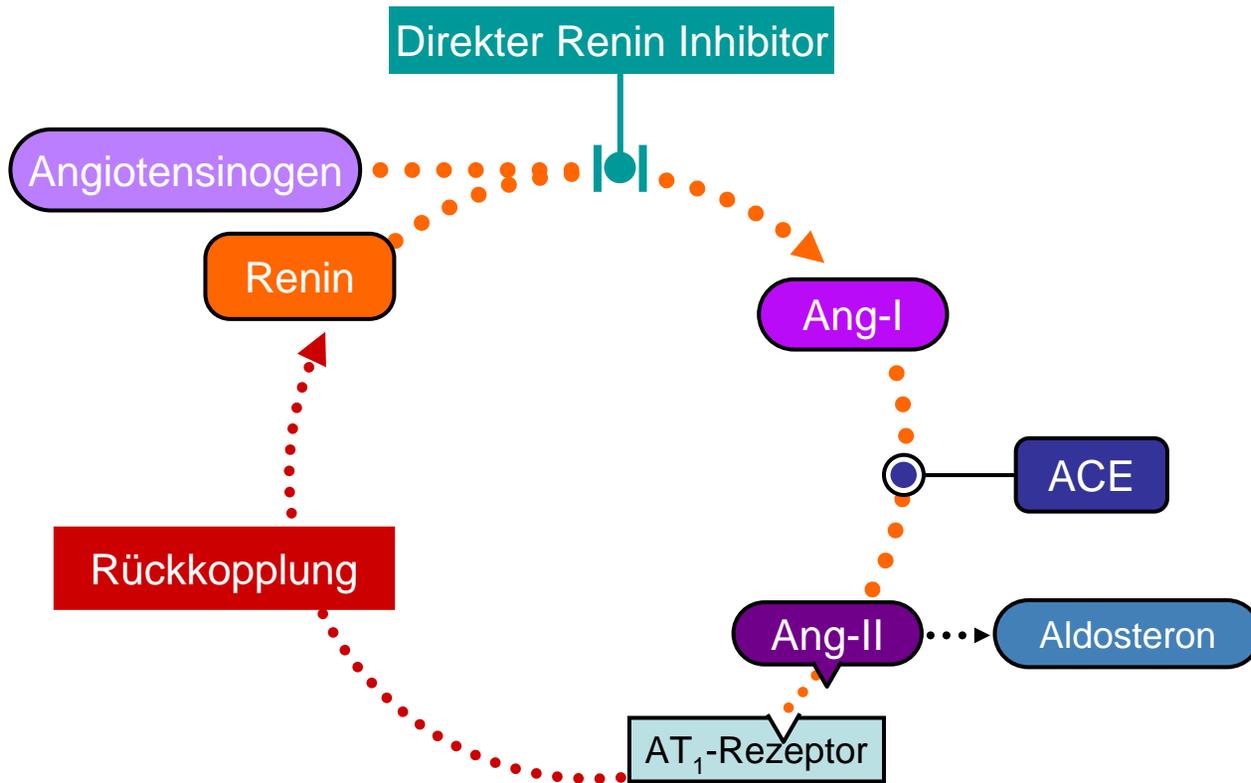
- erhöhte Insulinsekretion
- verbesserte β -Zellfunktion
- β -Zellprotektion



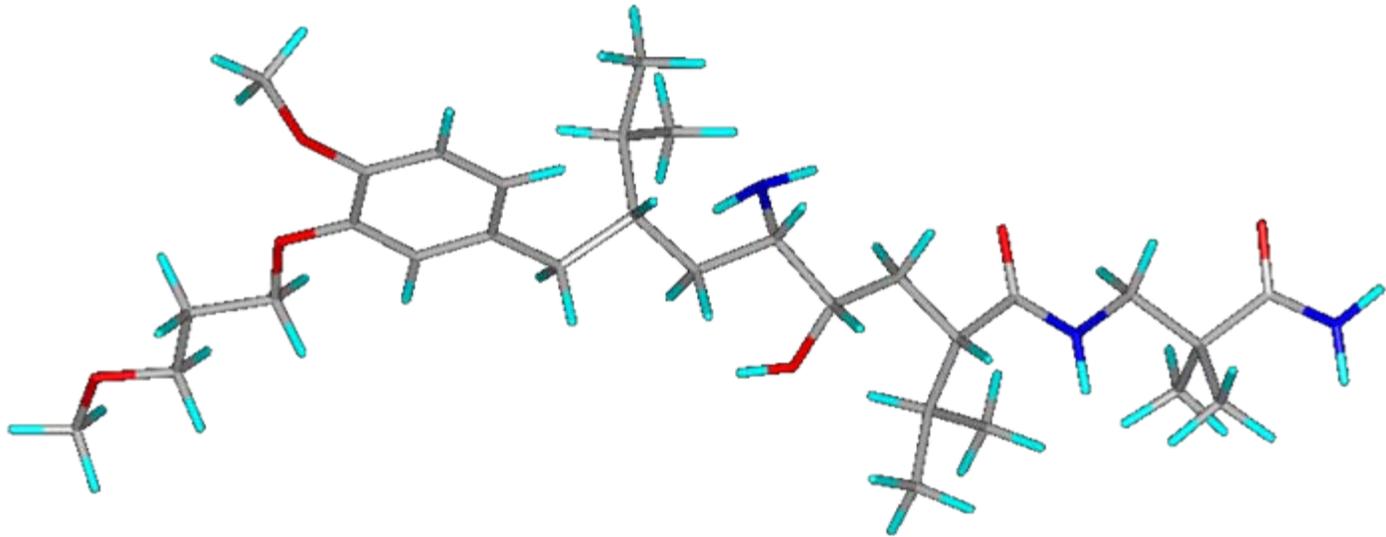
DPP-IV-Sitagliptin-Komplex (1X70)



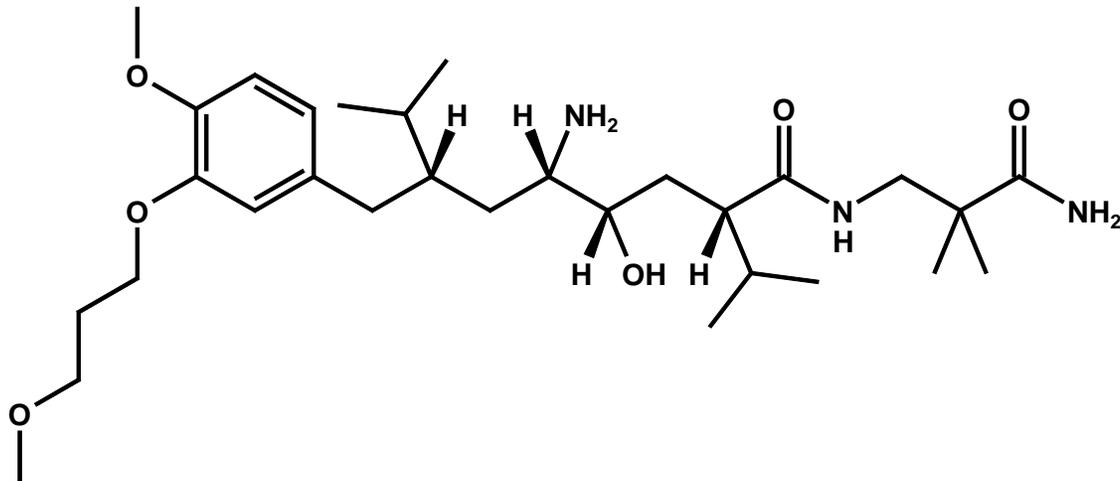
das RAA-System ist verantwortlich für den Bluthochdruck

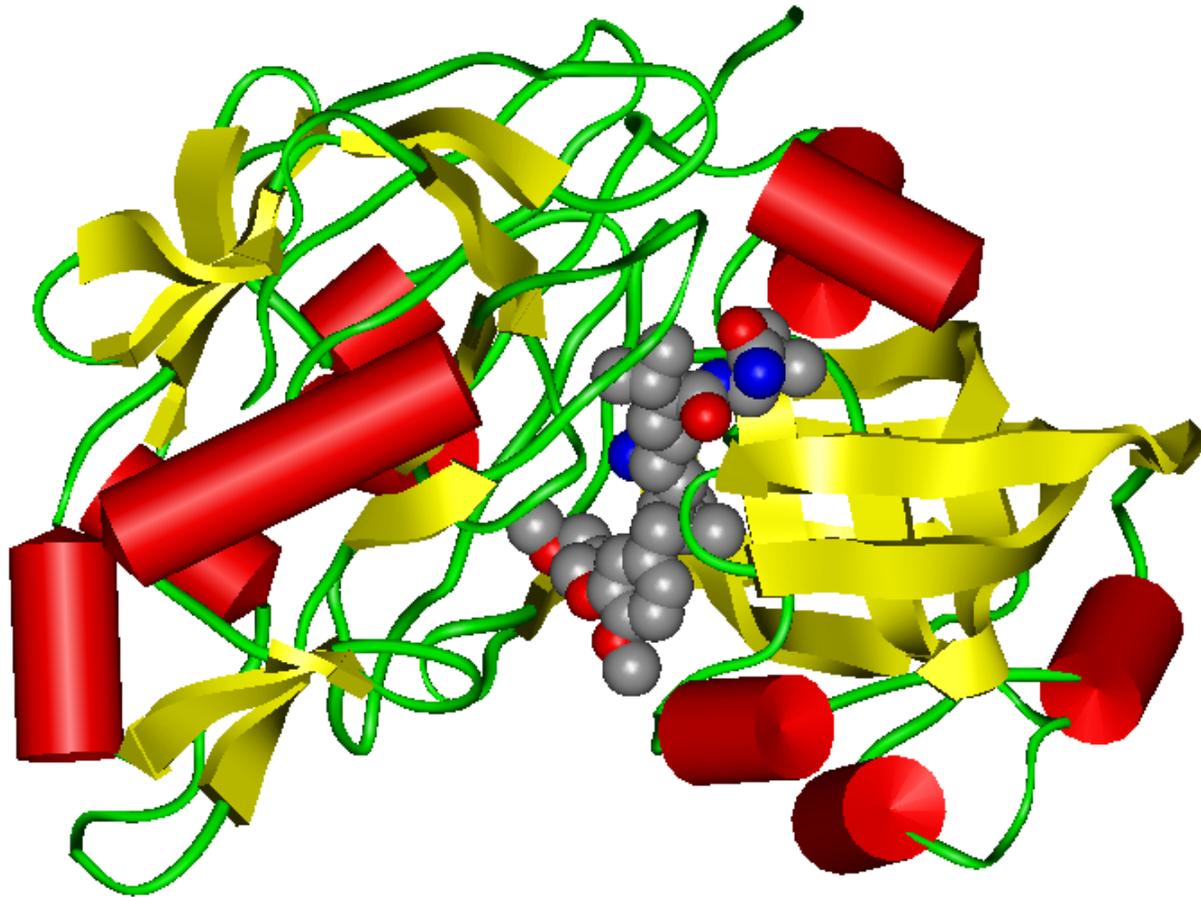


Modifiziert nach: Muller & Luft 2006



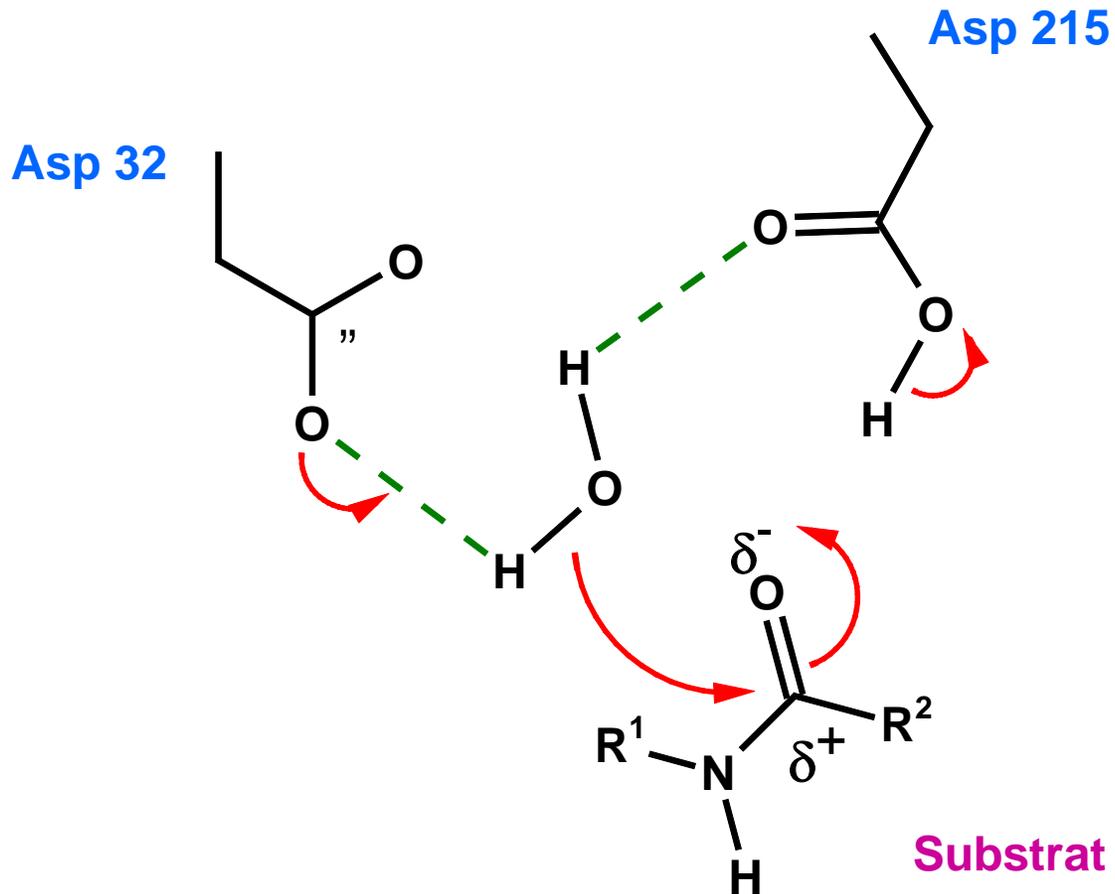
Aliskiren

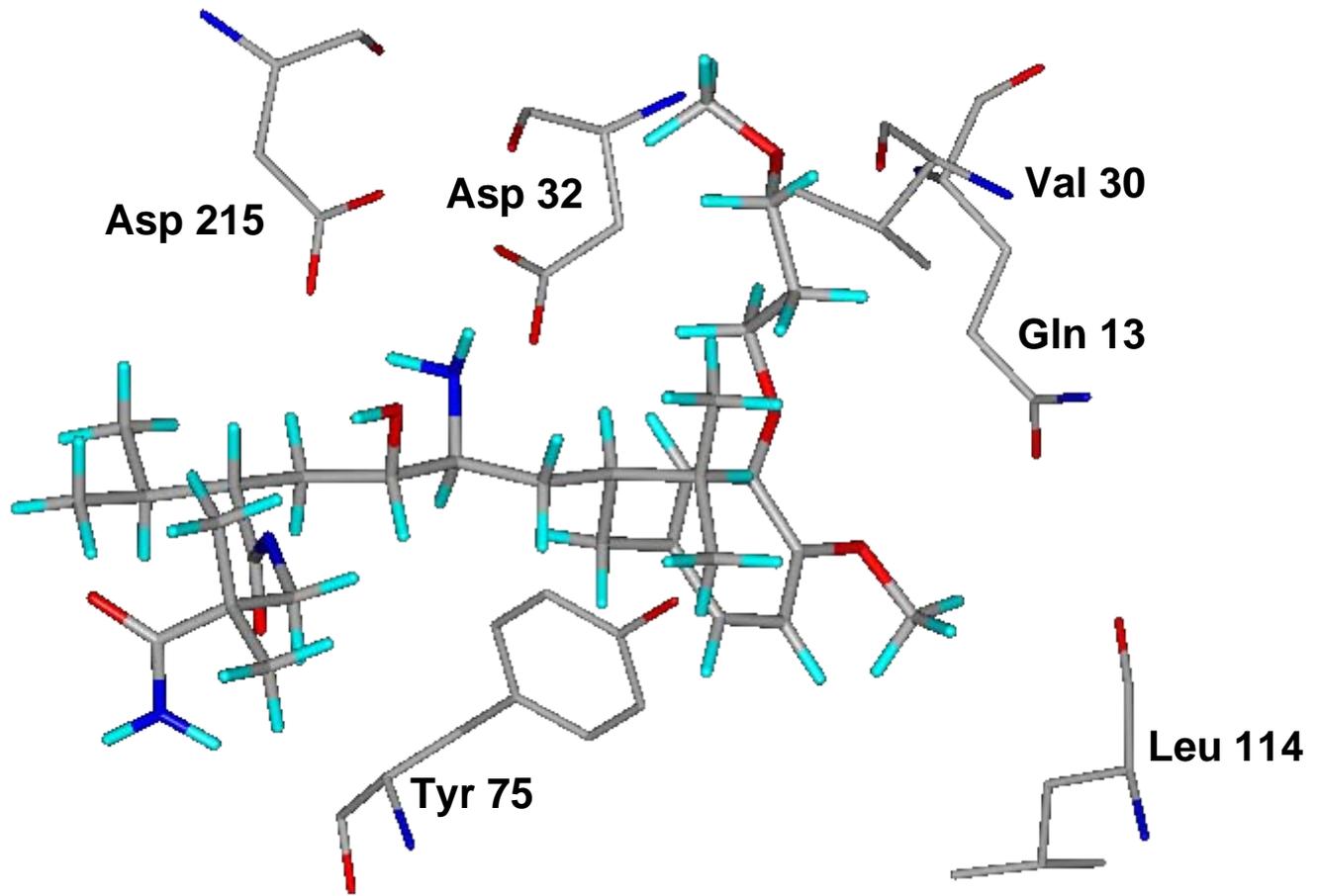




Renin-Aliskiren-Komplex (2V0Z)

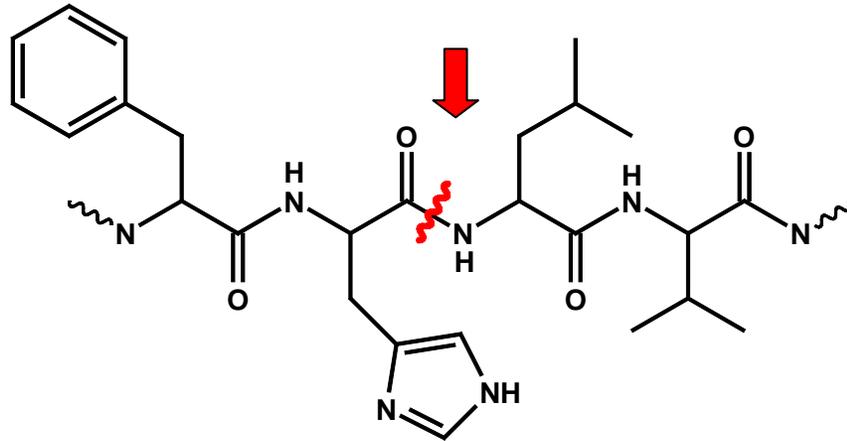
Mechanismus Aspartyl-Proteasen





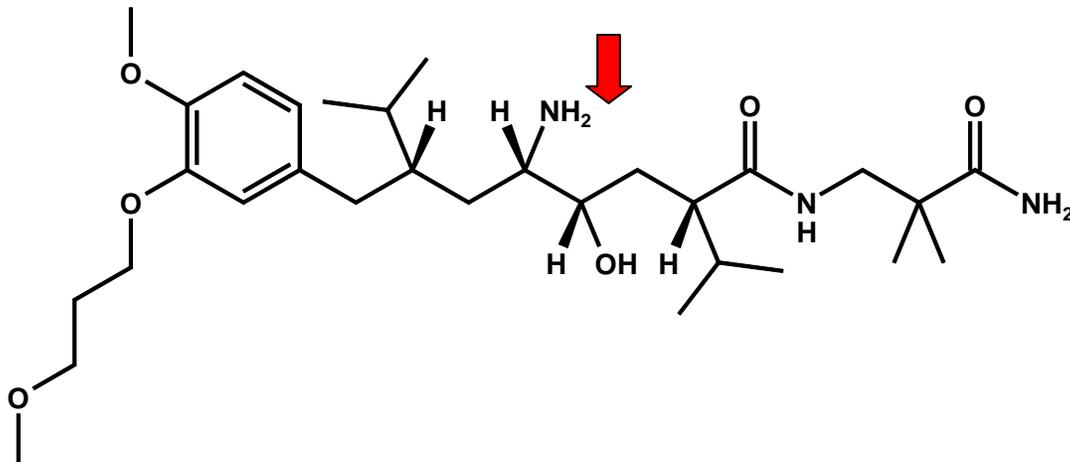
Aliskiren

Spaltstelle



Angiotensinogen

--- Phe His Leu Val ---



Aliskiren

Fazit

- Auf Zufälle sollte man sich nicht mehr verlassen
- Die Strukturen, an denen die Arzneistoffe angreifen sollen, müssen bekannt sein, um wirksame Stoffe zu finden