



新分子 找先导

成都先导药物开发股份有限公司



股票代码:成都先导 (688222.SH)



CEO致辞：



李进 董事长兼首席执行官

李进博士，成都先导药物开发股份有限公司创始人、董事长兼首席执行官，拥有超过30年的药物研发和科研管理经验，主要方向为化学、计算化学、计算生物学以及化合物筛选优化。

李进博士毕业于英国阿斯顿大学高分子专业，随后在曼彻斯特大学进行博士后研究。1990年加入Protherics（后来被Tularik/Amgen收购）并担任DockCrunch项目的总负责人，验证了大规模虚拟筛选的可行性与实用性，该项目是世界上第一个公开的此类大规模虚拟筛选实验。在创立成都先导之前，李进博士一直担任英国阿斯利康的全球化合物科学总监，负责阿斯利康先导化合物开发平台在全球的有效运作和改进。李进博士也是英国皇家化学协会会士、四川大学客座教授，他和他的团队曾获多种奖项。

“ 尊敬的客户与合作伙伴：
感谢您对成都先导的支持和关注！

成都先导是一家从事新药研发的生物技术公司，致力于打造国际领先的新药发现与优化研发体系，为未满足的临床需求寻找创新的解决方案，贡献于更好的人类生命健康。

新药研发过程中，非常关键的环节之一就是在知道疾病靶点之后，如何在分子层面找到调控靶点功能的解决方法。DNA编码化合物库（DEL）技术的出现，为实现这一目标提供了有效方案，显著缩短了先导化合物发现时间，提高了重大疾病疑难靶点的药物发现效率。作为新药研发的平台型技术，DEL技术有望能更加高效地为新药研发提供更多的新分子实体。经过十余年的努力以及与国际研究机构的合作，成都先导已经建立了新药研发的“巨型新药种子库”，公司的DEL库分子数量已超万亿。

为了更加全面高效地支持合作伙伴的新药研发需求，成都先导近几年在DNA编码化合物库（DEL）技术的基础上整合开发了基于分子片段和三维结构信息的药物设计技术（FBDD/SBDD）、寡聚核酸新药研发平台相关技术（STO）、靶向蛋白降解平台相关技术（TPD）等核心技术平台以及公司其他关键新药研发能力（药化、计算科学、生物评价、药学研究等），赋能从靶点到新药申报、创新药发现及优化的全过程。公司以开展对外新药合作研发实现可持续的经济效益，以早期新药项目转让为中期发展动力，以建立自主新药研发管线实现企业长期发展目标，承载“聚焦新药创制，解除人类病痛”的重要使命，助力推动医药行业的发展，为患者带来健康福音。

我们真诚地希望与您一起，在新药研发的道路上共同谱写新篇章，开启新药创制新未来！

”

李进博士
董事长兼首席执行官



成都先导药物开发股份有限公司

关于 成都先导

成都先导药物开发股份有限公司(上海证券交易所股票代码:688222.SH, 股票名称:成都先导)致力于打造国际领先的创新型生物医药企业,总部位于中国成都,在英国剑桥、美国休斯顿设有子公司。公司聚焦小分子及核酸新药的发现与优化,着力打造了国际领先的DNA编码化合物库技术(DEL)平台,并拓展了基于分子片段和三维结构信息的药物设计技术(FBDD/SBDD)、基于寡核苷酸的药物研发技术(OBT)和靶向蛋白降解技术(TPD)的核心技术平台;同时,公司正在建设DEL+AI+自动化DMTA(设计-合成-测试-分析)分子优化能力平台,以期加速临床前候选药物发现及优化过程。通过新药研发服务、不同阶段在研项目转让以及远期的药物上市等多元化的商业模式,成都先导与全球数百家制药公司、生物技术公司、化学公司、基金会以及科研机构建立了合作。目前,公司有多个内部新药项目处于临床及临床前不同阶段。



研发团队



博士:约20%



硕士:约30%



学士及其他:约50%



成都先导药物开发股份有限公司

地址:中国四川省成都市双流区(天府国际生物城)慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导



先导大事记

2012

成都先导成立

02月 成都先导总部位于中国成都，主要致力于DNA编码化合物库 (DEL) 设计及筛选技术平台，发现、开发原创新药及新的治疗方案。

12月 成功举办第一届先导化合物技术与产业发展国际论坛。

2013

“新药种子库”容量：3亿

10月 李进博士当选英国皇家化学协会 (Royal Society of Chemistry) 会士;成功举办第2届先导化合物技术与产业发展国际论坛。

12月 成都先导荣获由成都市委组织部颁发的“成都人才计划顶尖创新创业团队”奖。

2014

“新药种子库”容量：13亿

09月 李进博士荣获由中华全国归国华侨联合会颁发的“第五届中国侨界 (创新人才) 贡献奖”。

12月 成都先导荣获由四川省委组织部颁发的“四川省千人计划顶尖创新创业团队”奖。

2015

“新药种子库”容量：42亿

01月 成都先导得到由四川省人力资源和社会保障厅做出的“四川省博士后创新实践基地”认定; 李进博士荣获由中国四川省委颁发的“第十二批四川省突出贡献优秀专家”奖。

10月 核心专利获得授权: ZL20121055548.3 ZL201210555088.4

2016

“新药种子库”容量：80亿

公开的合作伙伴有:



04月 国务院总理李克强度点赞成成都先导“巨型新药种子库”; DEL技术先驱、美国 Scripps 研究所前所长 Richard A. Lerner, 2001年诺贝尔化学奖催化氧化反应得奖者 K. Barry Sharpless 教授来访。

05月 全球最早的国际性科技期刊《Nature》杂志发布文章《DNA-Encoded Drug Libraries Come of Age》肯定成都先导等 DEL 公司对全球新药研发做出的贡献。

07月 成都先导美国子公司成立。

11月 成功举办第一届创新药物发现的前沿与实践2016战略高峰论坛; 成都先导得到由科技部做出的“国家高新技术企业”认定。

2017

“新药种子库”容量：> 850亿

公开的合作伙伴有:

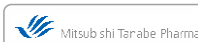


07月 成都先导再登《Nature》:《Chinese Biopharma Starts Feeding the Global Pipeline (中国生物制药开始“反哺”全球新药市场)》。

2018

“新药种子库”容量:3,000亿

公开的合作伙伴有:



05月 成都先导1类新药HG146获国家药品监督管理局 (NMPA) 批件进入一期临床研究。

07月 李进博士被英国阿斯顿大学授予荣誉科学博士学位, 这是首位中国生物医药领域的企业家获得此项特殊荣誉。

09月 成都先导荣登2018年度“中国最具投资价值企业50强” (Venture 50)。

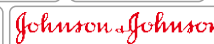
10月 成功在中国成都举办“2018创新药物发现的前沿与实践国际高峰论坛”及“第8届DNA编码化合物库技术国际高峰论坛”

11月 生物医药行业权威杂志《BioCentury Innovations》封面文章刊登了对成都先导的报道:《HitGen's DNA For Small Molecules》。

2019

“新药种子库”容量:4,000亿

公开的合作伙伴有:



08月 成都先导被Cortellis评为2019年亚太制药公司创新第一名。

10月 成功举办2019创新药研发前沿与实践国际高峰论坛, 参会人员1200余人。

12月 成都先导被智联评为2019年中国最佳雇主奖。

2020

“新药种子库”容量：>5,000亿

公开的合作伙伴有：



03月 成都先导二代NTRK/ROS1双靶点抗肿瘤药HG030获临床试验许可。

04月 成都先导药物开发股份有限公司正式在上海证券交易所科创板挂牌上市，股票代码：成都先导（688222.SH）。

09月 公司与天士力签约创新药开发同盟，共同致力于中国创新药研发，坚定我们开启国内循环的决心。

10月 公司宣布对英国Vernalis (R&D) Limited的收购，迈出了海外并购的第一步。

11月 公司进入国家企业技术中心公示名单，入围中国新经济企业500强，获得“成都市上市重点产业上市龙头企业”称号，荣获四川专利创新创业奖。

12月 公司与白云山签订了HG030产品中国大陆转让协议，实现了公司首个自研品种的转让，正式确认为国家企业技术中心。

2021

“新药种子库”容量：>10,000亿

公开的合作伙伴有：



04月 成都先导STING激动剂HG0381获临床试验许可，HDAC抑制剂HG146再度获批用于治疗实体瘤。

05月 成都先导《DNA编码化合物库平台赋能新药研发白皮书》重磅发布。

09月 成都先导上榜上市公司2020年业绩说明会优秀实践案例名单。

10月 成都先导荣获2020年度中国医药研发50强。

2022

“新药种子库”容量：>12,000亿

公开的合作伙伴有：



01月 成都先导抗肿瘤创新药HG030临床试验申请获美国FDA批准。

03月 成都先导宣布达成新的基于DEL技术的药物研发合作。

04月 成都先导携手PACS1综合征研究基金会开展配体发现研究，共克PACS1基因突变难题。

06月 成都先导通过ISO27001认证，信息安全管理能力获国际认可；成都先导推出OpenDEL®3.0，全新升级让药物发现更便捷。

12月 成都先导再获美国化学会化学文摘社登记认证，新颖分子结构受权威认可。

2023

“新药种子库”容量：>12,000亿

公开的合作伙伴有：



01月 成都先导荣膺“2022第十二届中国上市公司口碑榜”之生物医药最具成长上市公司。

03月 成都先导成立十周年暨上市三周年庆典圆满举行；全国社会保障基金理事会副理事长陈文辉莅临成都先调研。

05月 成都先导与ARase Therapeutics达成基于DEL技术的新药研发合作。

06月 成都先导荣登“2022年度中国CXO企业TOP20排行榜”。

07月 成都先导发布DEL for系列服务。

08月 生物医药行业权威杂志《BioCentury Innovations》封面文章刊登了对成都先的报道：《HitGen's DNA For Small Molecules》。

11月 成都先导控股子公司四川先东制药有限公司正式投产。

2024

“新药种子库”容量：>12,000亿

公开的合作伙伴有：



02月 先东制药与玻思稻宣布达成战略合作，加速推动核酸新药研发；成都先导全资子公司Vernalis与Hox Therapeutics达成肿瘤药物研发合作。

03月 成都先导与LabCentral、BioLabs、MBC BioLabs达成合作，DEL技术助力初创企业加速药物研发。

08月 成都先导与Bridge Biotherapeutics携手推进新型抗癌药物研发；成都先导创始人、董事长李进博士荣获成都市“金沙友谊奖”；成都先导成功入选上证科创板创新药指数和上证科创板 200 指数；蓉创先导并购基金正式成立。

10月 成都先导与盛世君联签署战略合作协议，携手开展AOC药物研发服务。

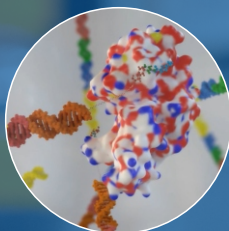
11月 成都先导药入选“2024中国医药创新企业100强”、“2024中国生命科学服务企业品牌100强”，公司董事长兼首席执行官李进博士入选“创新十年未来十年”筑新人物。

12月 成都先导分析检测平台获得CNAS实验室认可证书。

商业 模式



定制DNA编码化合物库



DNA编码化合物库筛选



化学合成服务



战略合作/合资企业



新药项目转让/自主研发



创新药物一站式研发服务

公开合作伙伴



成都先导药物开发股份有限公司

地址：中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话：+86 (28) 85197385

传真：+86 (28) 83310298

网址：www.hitgen.com

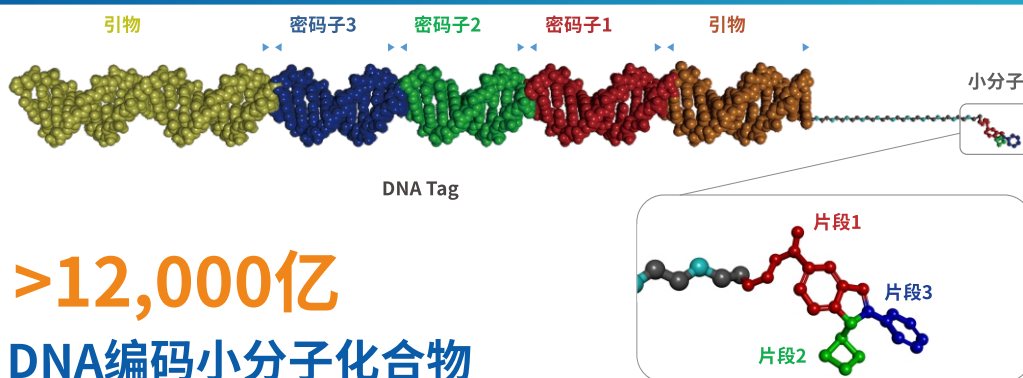
邮编：610200

商务合作：bd@hitgen.com

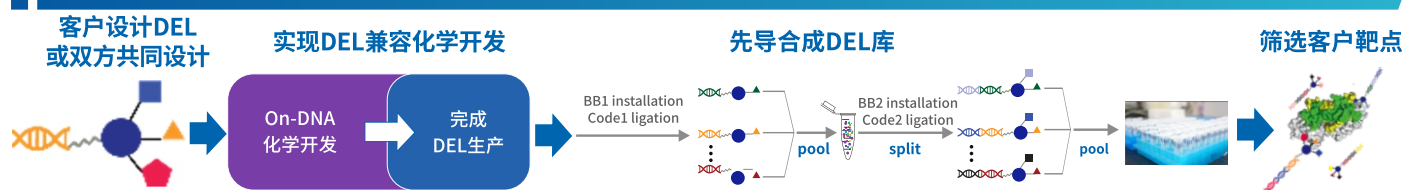
投资者关系：investors@hitgen.com

新分子 找先导

DNA编码化合物的基本结构



DNA编码化合物库设计与合成



产品模式优势:

- 结合客户独有新药开发需求和资源, 量身打造
- 客户独享 (不受靶点排他性限制)
- 项目针对性强 (针对已有结构或靶点进行针对设计)
- 使用无忧 (筛选技术转让或委托筛选服务)

高质量的DEL产品和定制服务能力:

- 经验丰富的DEL设计与合成有机化学、分子生物学和分析化学团队
- 覆盖核酸设计合成、分子骨架合成、DNA化学反应开发与验证的内部研发能力
- 完整的质量控制体系和可交付的合成数据包
- 高效快速合成 (几个月合成数百万到数亿的分子)

丰富的合作经验

辉瑞
强生
默沙东
Forma
.....

客户需求和经验结合成都先导DEL技术平台能力, 提升DEL质量, 降低使用难度

自动化设备助力高质量DNA编码化合物库合成



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

DNA编码化合物库成品与可交付产品

- 客户可根据药化经验与化学资源设计DEL库；
- 先导构建并交付高质量含有数十亿化合物的DEL库；
- DEL合成与QC记录可追踪；
- 该合作模式下的DEL库可用于筛选任意靶点；
- 允许客户自己做筛选、测序、数据分析与hit-proposal。

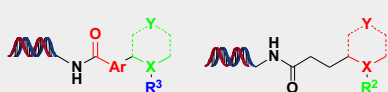


- 一次合成即可提供用于成百上千次筛选的样品；
- DEL样品以干粉形式储存于-20℃的冰箱；
- DEL产品保质期可长达数年；
- DEL所有信息包括合成过程与QC数据可随DEL产品一起交付。

不同类型DNA编码化合物库

多样化小分子DEL库

化学驱动库(光氧化还原为例):



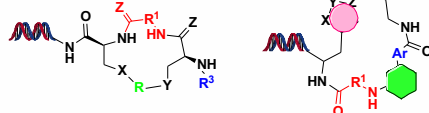
优势结构覆盖度:



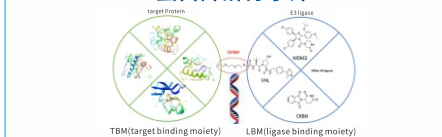
适于不同靶点类型库(CNS库为例):



大环库



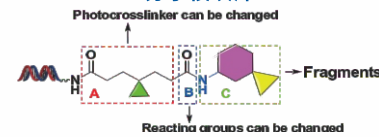
蛋白降解分子库



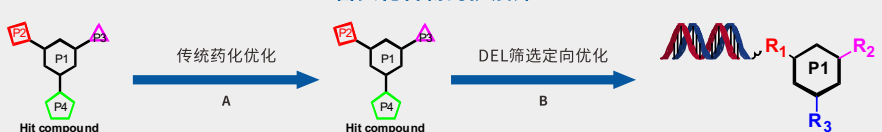
共价化合物库



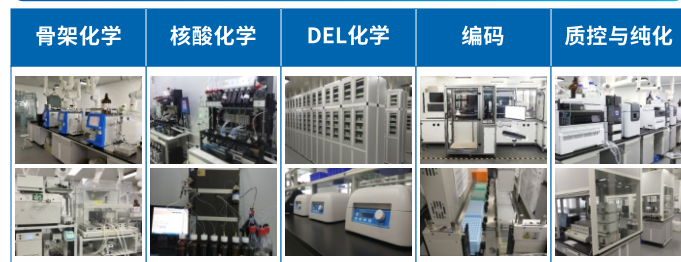
分子模块库



苗头化合物的扩展库



DNA编码化合物库合成平台

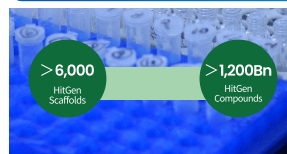


从库设计到终产品:

同一团队包括经验丰富的核酸化学家,有机化学家,计算化学家与分子生物学专家;

可靠的内部设备能够支持DEL库合成与质控的全部流程,实现高通量合成与质控。

先导在DEL合成领域的成就



先导化合物合集:

- 超过10,000亿DNA编码化合物并持续增加;
- 超过1,000种骨架与30,000种试剂。



4家公开合作建库伙伴

2018年Biocentury在封面文章中报道了成都先导DEL技术平台。



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

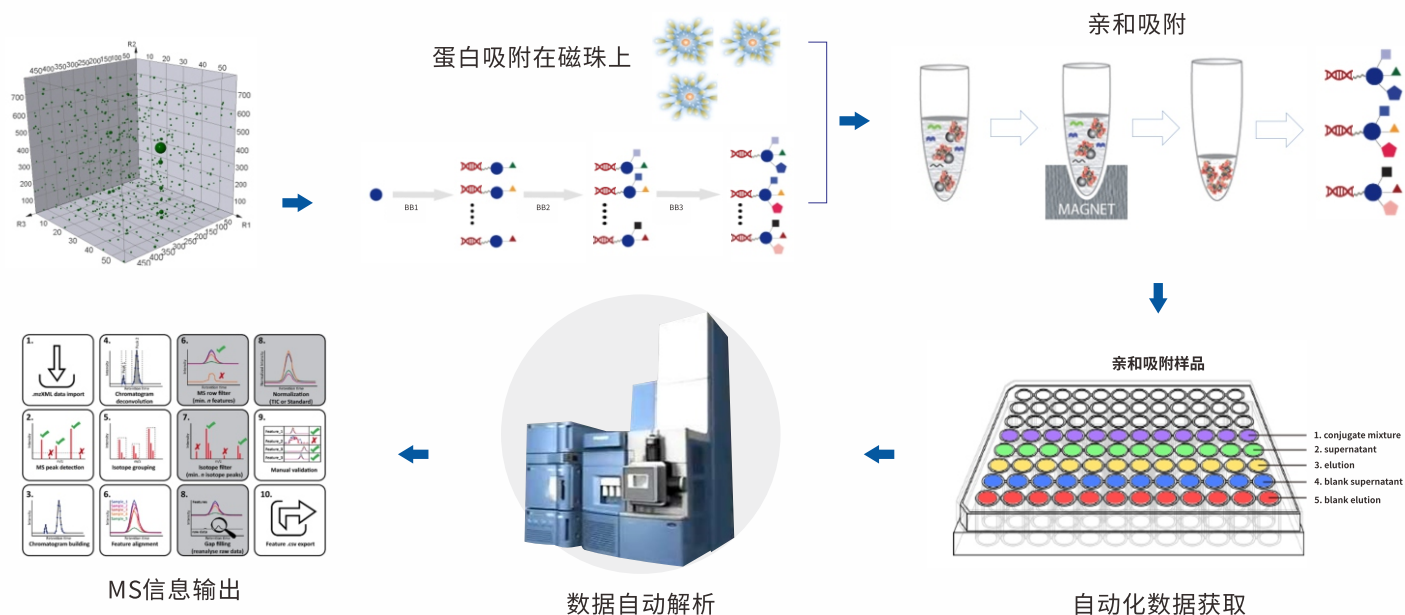
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

On-DNA ASMS平台



Feature proposal

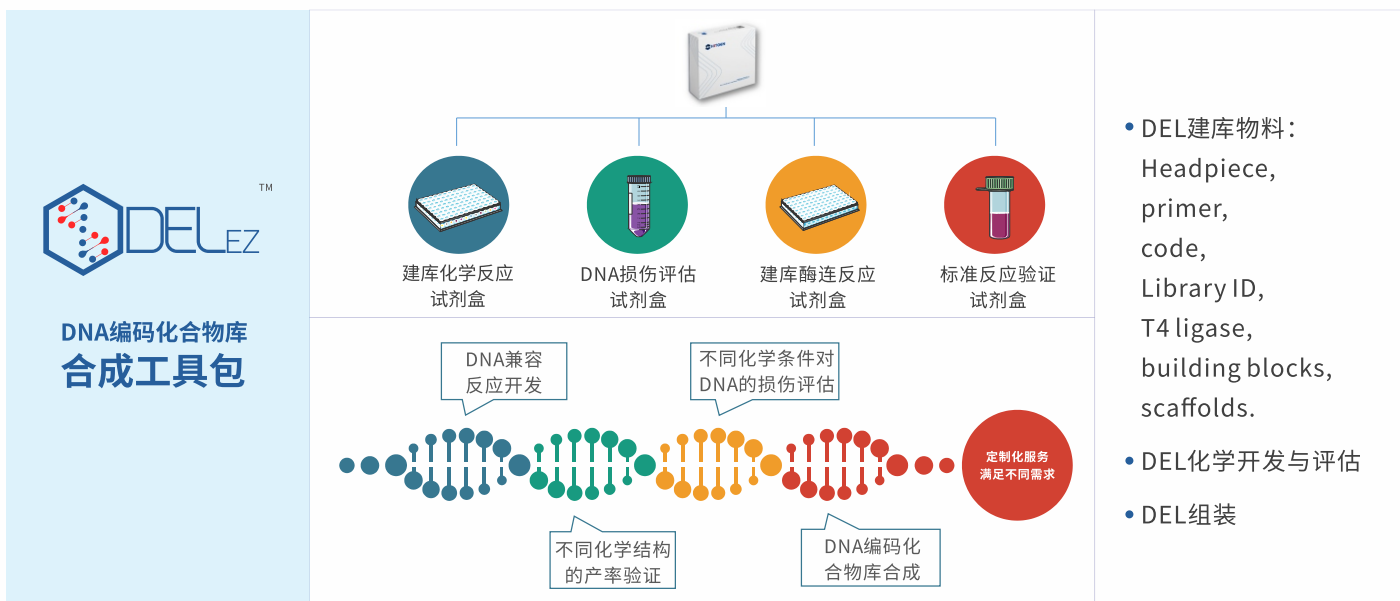
on-DNA合成

MS方法建立与分析
(结合与功能)

MS数据处理

Off-DNA合成

DELTM: DNA编码化合物库自助工具包



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

OpenDEL® - 易得好用的药物研发助推器

结构公开 —— 分子发现养料 / 数据公开 —— 人工智能沃土

OpenDEL®开放式的小分子筛选产品

- ▶ 完整的信息披露
 - 分子结构信息 · 分子砌块信息 · 化合物库编码信息
 - 骨架结构信息 · 合成路线图 · 完整的筛选实验指南
- ▶ 无需为分子结构信息额外付费
- ▶ 无需为IP产权额外付费

OpenDEL®赋能小分子药物研发

- ▶ AI/ML:
 - 完善的筛选数据包, 为AI/ML提供海量数据
- ▶ 药物发现:
 - 高效便捷的靶点发现
 - 全新先导化合物的快速获取



OpenDEL® 试剂盒



DEL
筛选样本



PCR正向引物
(Primer F)



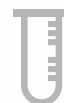
PCR反向引物
(Primer R)



qPCR标准
曲线样品



Salmon sperm
DNA (ssDNA)



空管



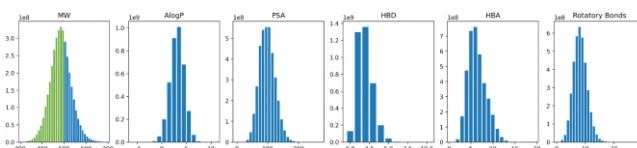
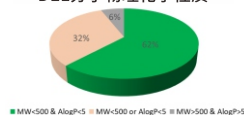
筛选指导手册

OpenDEL®产品特征

- ▶ 超30亿DNA编码化合物分子
- ▶ 50个DNA编码化合物库
- ▶ 10个2维DNA编码化合物库
- ▶ 40个3维DNA编码化合物库
- ▶ 无4维DNA编码化合物库
- ▶ DNA编码信息列表
- ▶ 实体分子和产品
- ▶ 筛选操作手册
- ▶ DNA编码化合物库合成路线
- ▶ 合成砌块信息列表

库分子理化性质

DEL分子理化性质



	平均分子量 (Da)	MW<500 & AlogP<5	MW<550	MW<500	MW<450
2-Cycle DELs	414	88%	99.7%	95%	74%
3-Cycle DELs	484	62%	91.5%	66%	23%

OpenDEL®及后续服务

成都先导能为您提供完整的小分子发现全流程服务



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

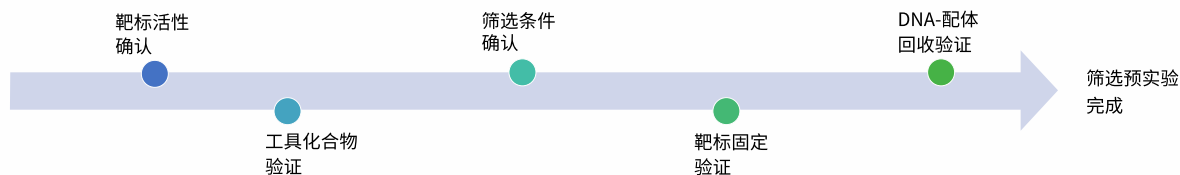
商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

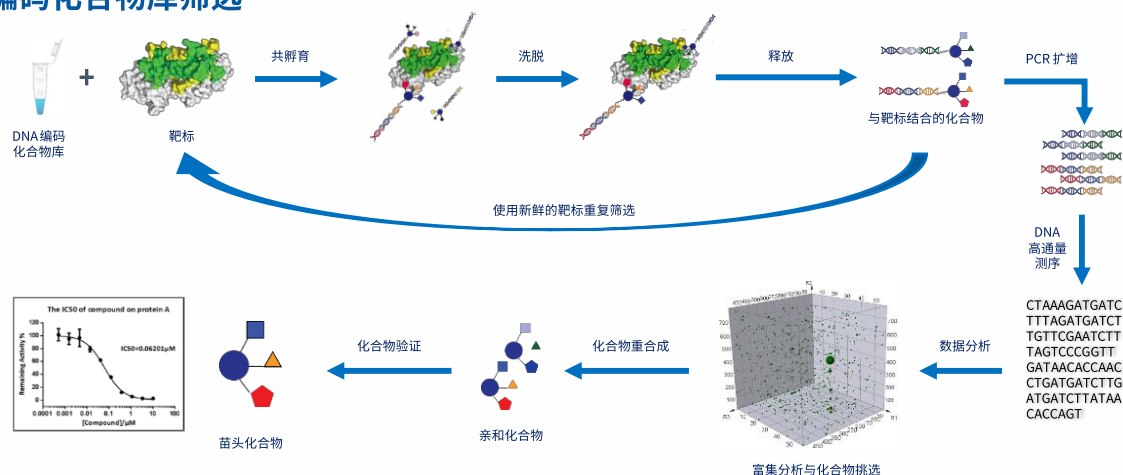
DNA编码化合物库筛选

筛选前预实验

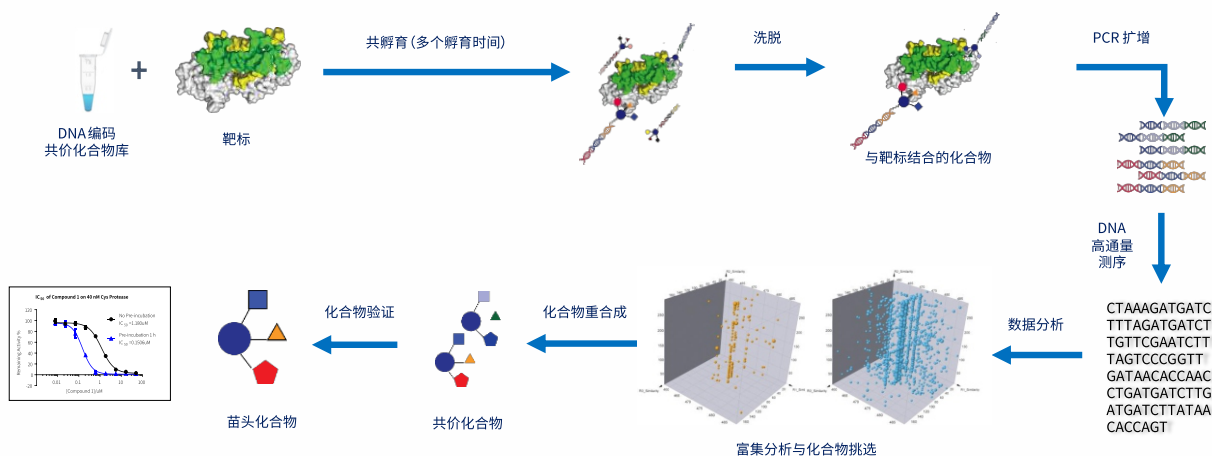


DNA编码化合物库的筛选均涉及以下一般步骤：靶标与DNA编码化合物库孵育、去除未结合分子和解离回收结合分子。筛选的每个环节对筛选结果都至关重要。成都先导提供涉及不同类型库的筛选，每种DNA编码化合物库类型的筛选有其独特的筛选流程。筛选完成后，将进行DNA高通量测序。为了获得较高的数据使用效率，每个样本中拷贝数的适当范围至关重要。为了实现这一点，我们用定量实时PCR (qPCR) 监测洗脱的总拷贝数，并决定需要进行多少轮筛选。

经典DNA编码化合物库筛选



共价DNA编码化合物库筛选



成都先导药物开发股份有限公司

地址：中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话：+86 (28) 85197385

传真：+86 (28) 83310298

网址：www.hitgen.com

邮编：610200

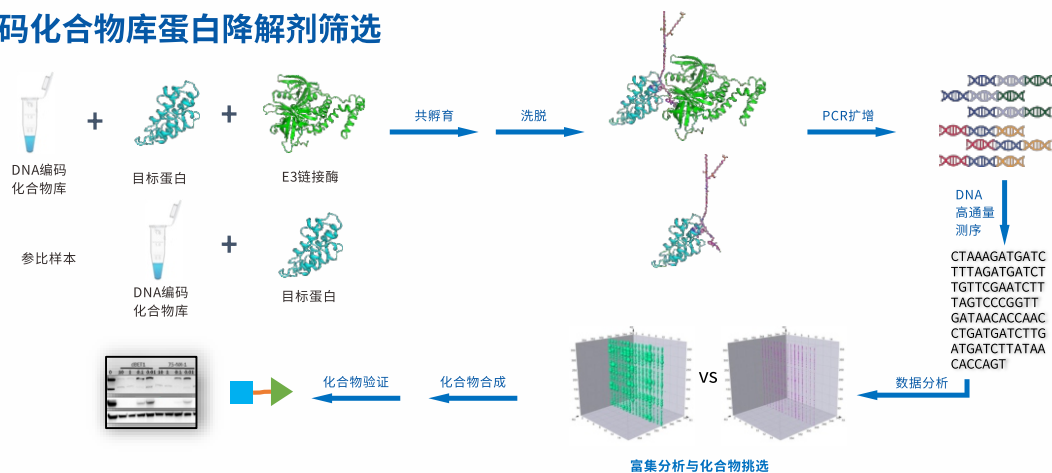
商务合作：bd@hitgen.com

投资者关系：investors@hitgen.com

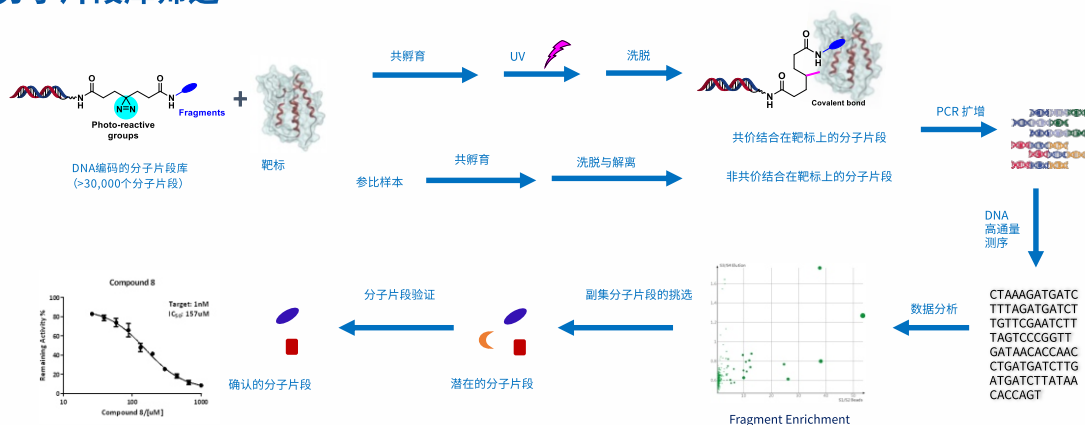
新分子 找先导

DNA编码化合物库筛选

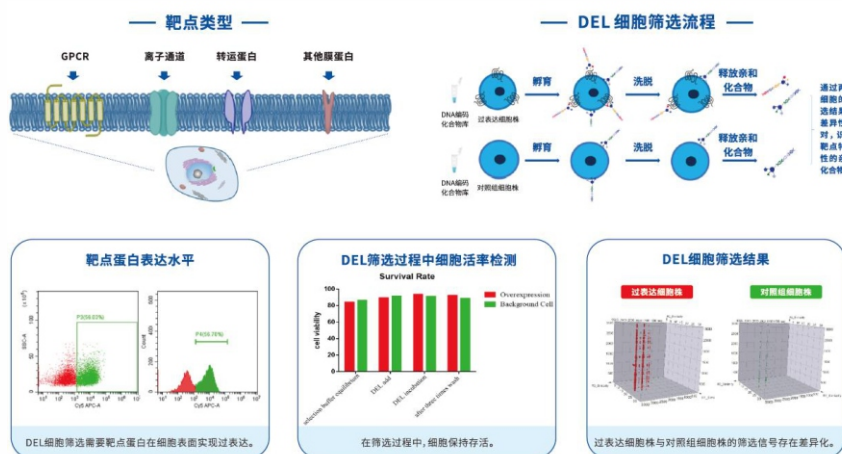
DNA编码化合物库蛋白降解剂筛选



DNA编码分子片段库筛选



DNA编码化合物库的细胞筛选



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

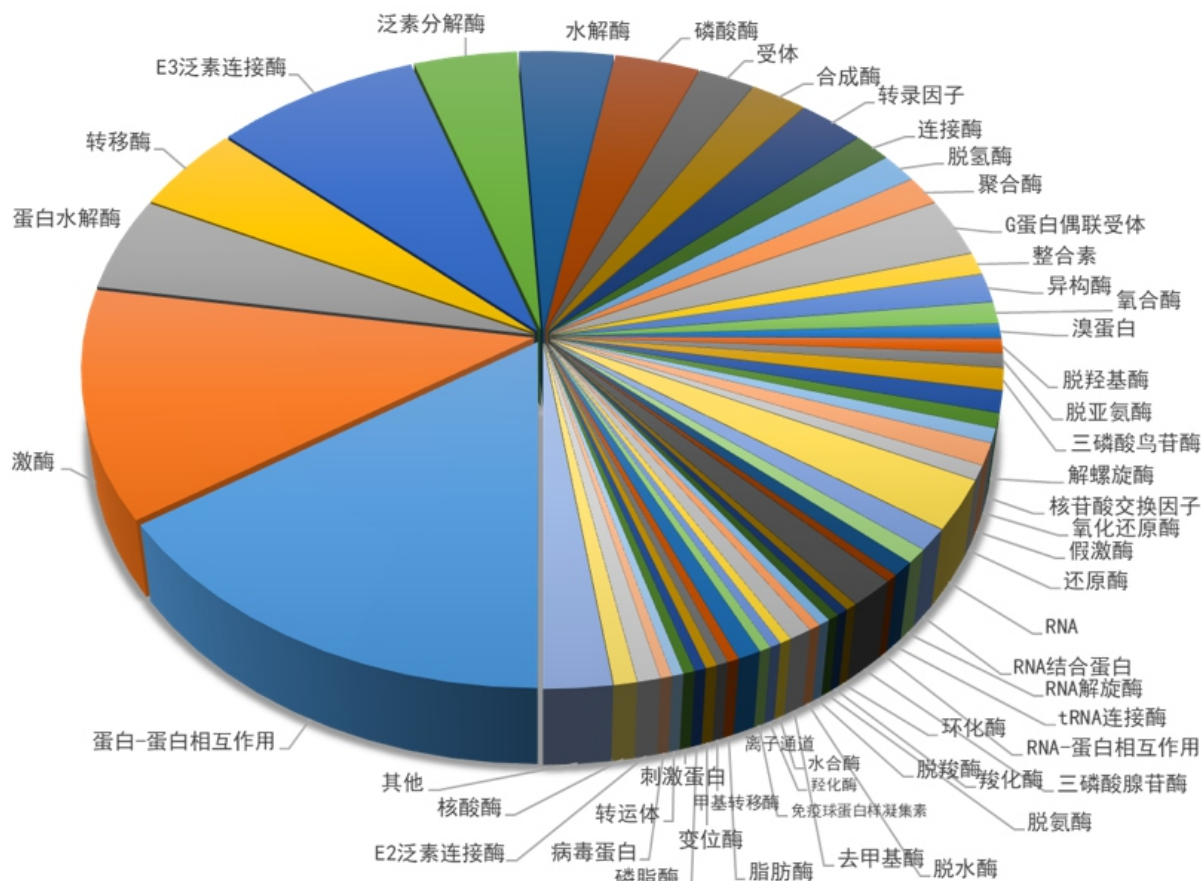
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

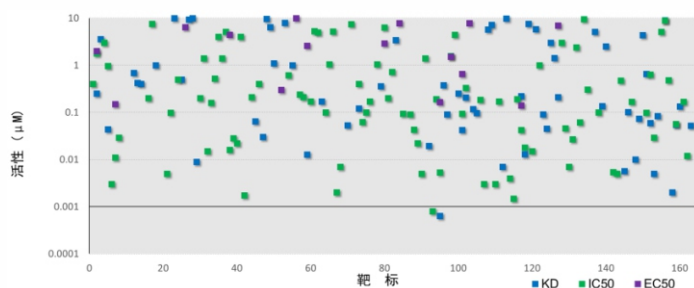
新分子 找先导

先导DNA编码化合物库已筛选靶点类型

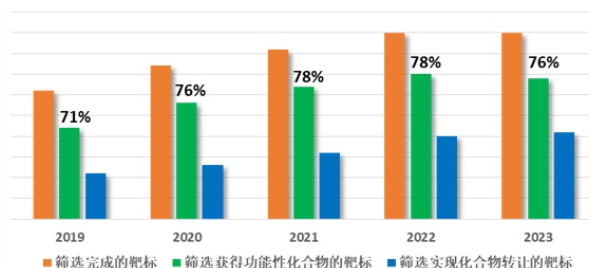


筛选靶标类型与分布(累计53种)

代表性化合物的活性范围



筛选成功率与转让



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

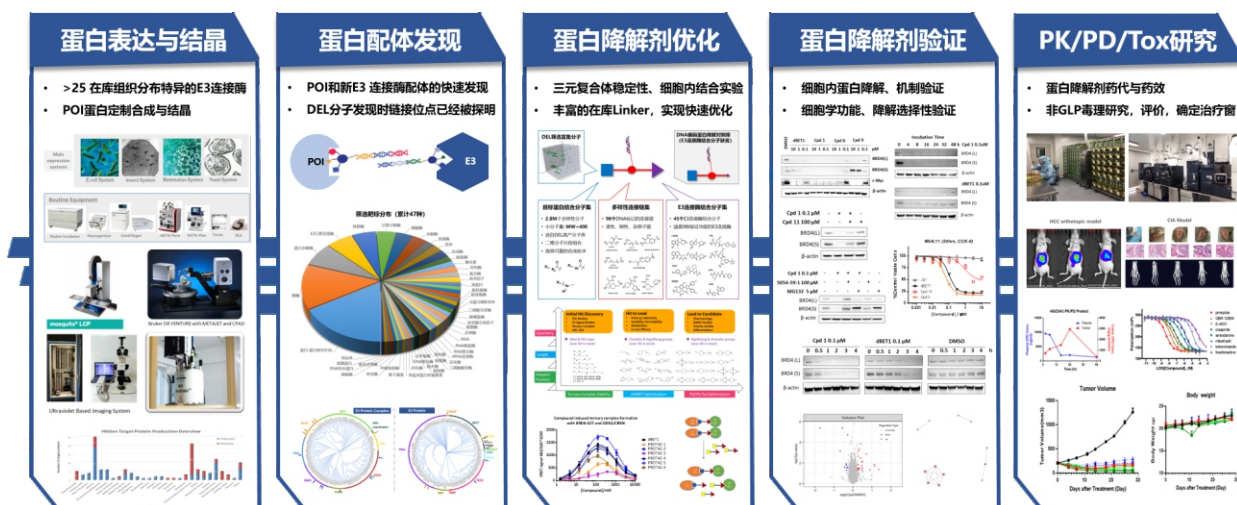
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

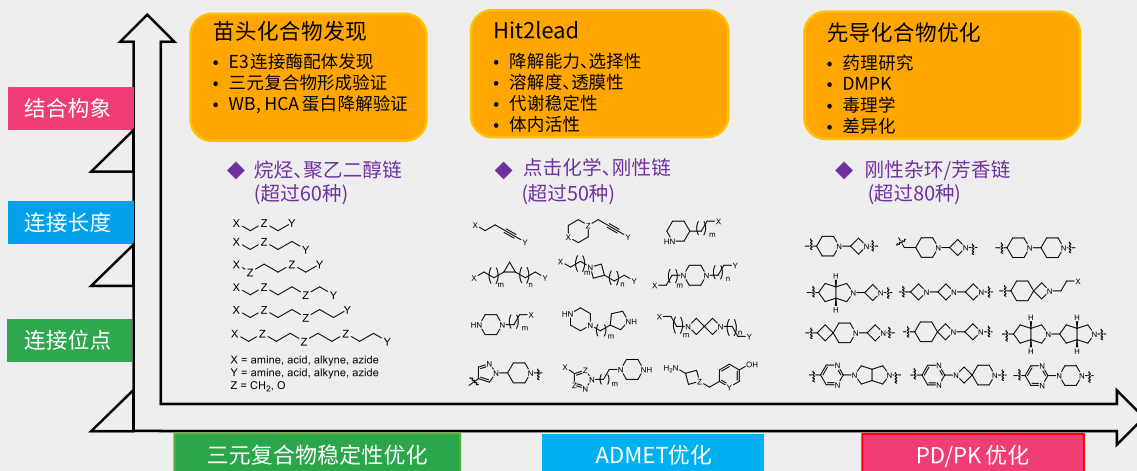
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

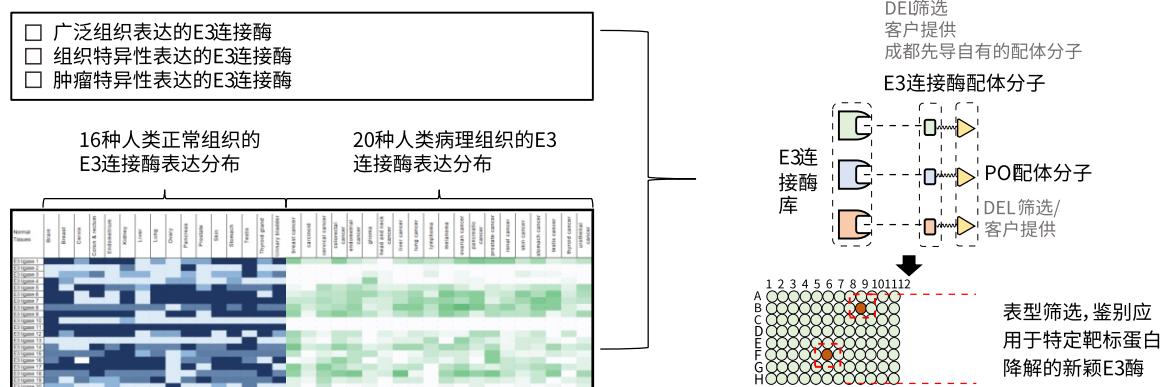
蛋白降解剂发现和优化平台



◆ Linker优化策略



◆ 新颖E3连接酶与配体开发



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

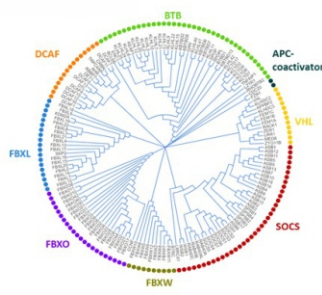
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

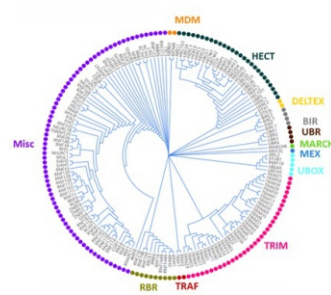
新颖E3连接酶的探索

- 目前广泛使用的E3连接酶和配体数目相当有限(主要聚焦于CRBN、VHL配体);
- 从600多个E3连接酶的空间中识别其配体对于重塑可降解蛋白质谱和扩大可降解蛋白质谱具有很高的价值;
- 基于肿瘤样本和对应的正常组织的基因表达谱,结合文献分析,我们选择了50余个肿瘤富集的E3连接酶进行蛋白质表达和结构研究;
- 将DEL技术应用于成都先导新型E3连接酶配体的发现。

E3复合蛋白



E3 单蛋白



E3 Family	E3 Protein	ACC	BLCA	BRCA	CESC	CHOL	COAD	DLBC	ESCA	GBM	HNSC	KICH	KIRC	KIRP	LAML	LGG	LIHC	LUAD	LUSC	OV	PAAD	PCPG	PRAD	READ	SARC	SKCM	STAD	TGCT	THCA	THYM	UCEC	UCS
CRL1	FBXO2																															
	FBXO7																															
	FBXO32																															
	FBXO41																															
	FBXO44																															
	FBXW1																															
	FBXW7																															
CRL2	SKP2																															
	FBXL5																															
	FBXL16																															
	F****																															
	FEM1B																															
	VHL																															
	KCTD5																															
CRL3	KLHL3																															
	KLHL19																															
	KLHL37																															
	SPOP																															
	AHR																															
	CRBN																															
	DCAF15																															
CRL4	DCAF16																															
	SPSB2																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
CRL5	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															
	SPSB4																															

E3 Family	E3 Protein	ACC	BLCA	BRCA	CESC	CHOL	COAD	DLBC	ESCA	GBM	HNSC	KICH	KIRC	KIRP	LAML	LGG	LIHC	LUAD	LUSC	OV	PAAD	PCPG	PRAD	READ	SARC	SKCM	STAD	TGCT	THCA	THYM	UCEC	UCS
Single Unit	BIRC2(cIAP1)																															
	B****																															
	BIRC4(XIAP)																															
	BIRC7																															
	CDC20																															
	HECW1																															
	H****																															
	MDM2																															
	NEDD4L																															
	RNF4																															
	RNF114																															
	TRIM9																															
	TRIM21																															
	TRIM24																															
	TRIM63																															

成都先导现有的E3连接酶

Protein name (Tag)	Catalog Number	Protein name (Tag)	Catalog Number	Protein name (Tag)	Catalog Number
ABTB1 (His-MBP)	HGE3_ABTB1_AHM	FBXO2 (GST & His)	HGE3_FBXO2_AGH	RNF4 (His)	HGE3_RNF4_BH
BIRC3 (His & Avi-Biotin)	HGE3_BIRC3_AHAB	FBXO2 (His)	HGE3_FBXO2_AH	RNF4 (Strep)	HGE3_RNF4_BS
BIRC3 (His & Avi-Biotin)	HGE3_BIRC3_BHAB	FBXO2/SKP1 Complex	HGE3_FBXO2c_AH	SIAH3 (Strep-SUMO)	HGE3_SIAH3_ASS
BIRC3 (His & Avi-Biotin)	HGE3_BIRC3_CHAB	FBXO41/SKP1 Complex	HGE3_FBXO41c_AHG	SKP1 (His-Strep)	HGE3_SKP1_AHS
BIRC3 (His)	HGE3_BIRC3_DH	FBXO7 (Strep)	HGE3_FBXO7_AS	SKP1 (His)	HGE3_SKP1_BH
BIRC3 (Strep)	HGE3_BIRC3_DS	FBXO7/SKP1 Complex	HGE3_FBXO7c_AS	SKP1 (Strep)	HGE3_SKP1_BS
BIRC7 (no tag)	HGE3_BIRC7_AN	FBXW7/SKP1 Complex	HGE3_FBXW7c_BH	SKP2/SKP1 Complex	HGE3_SKP2c_ANH
BTRC/SKP1 Complex	HGE3_BTRCc_BHSM	FBXW7/SKP1 Complex	HGE3_FBXW7c_BS	SKP2/SKP1 Complex	HGE3_SKP2c_ANS
BTRC/SKP1 Complex	HGE3_BTRCc_BS	FEM1B/ELOB/ELOC Complex	HGE3_FEM1Bc_AGH	SKP2/SKP1 Complex	HGE3_SKP2c_ASH
CDC20 (His)	HGE3_CDC20_AH	FEM1B/ELOB/ELOC Complex	HGE3_FEM1Bc_AGS	SPSB2 (His)	HGE3_SPSB2_BH
CDC20 (Strep)	HGE3_CDC20_AS	HECW1 (Strep)	HGE3_HECW1_AS	SPSB2 (Strep)	HGE3_SPSB2_BS
ciAP1 (Strep)	HGE3_ciAP1_BS	HECW1 (His-GST)	HGE3_HECW1_BHG	SPSB2/ELOB/ELOC Complex	HGE3_SPSB2c_AS
ciAP1 (His & Avi-Biotin)	HGE3_ciAP1_CHAB	HUWE1 (His)	HGE3_HUWE1_AH	SPSB4/ELOB/ELOC Complex	HGE3_SPSB4c_AH
ciAP1 (Strep)	HGE3_ciAP1_CS	HUWE1 (Strep)	HGE3_HUWE1_AS	SPSB4/ELOB/ELOC Complex	HGE3_SPSB4c_AS
CRBN/DBB1 Complex	HGE3_CRBNc_AH	HUWE1 (His-GST)	HGE3_HUWE1_BHG	SV5V/DBB1 Complex	HGE3_SV5Vc_AN
CRBN/DBB1 Complex	HGE3_CRBNc_AHA	HUWE1 (His-GST)	HGE3_HUWE1_CHG	TRIM21 (His)	HGE3_TRIM21_AH
CRBN/DBB1 Complex	HGE3_CRBNc_AF	KCTD5 (Strep)	HGE3_KCTD5_AS	TRIM21 (Strep)	HGE3_TRIM21_AS
CRBN/DBB1 (dBPB) Complex	HGE3_CRBNc_BH	KCTD8 (Strep)	HGE3_KCTD8_AS	TRIM21 (His)	HGE3_TRIM21_CH
CUL3 (His)	HGE3_CUL3_AH	KEAP1 (His)	HGE3_KEAP1_AH	TRIM21 (Strep)	HGE3_TRIM21_CS
CUL3 (Strep)	HGE3_CUL3_AS	KEAP1 (His)	HGE3_KEAP1_AH01	TRIM24 (His)	HGE3_TRIM24_AH
DCAF2/DBB1 (dBPB) Complex	HGE3_DCAF2c_BHG	KEAP1 (His-GST)	HGE3_KEAP1_AHG	TRIM24 (Strep-SUMO)	HGE3_TRIM24_ASSM
DCAF11/DBB1 Complex	HGE3_DCAF11c_AHG	KEAP1 (no tag)	HGE3_KEAP1_AN	Trim67 (His-GST)	HGE3_TRIM67_AHG
DCAF15/DBB1/DDA Complex	HGE3_DCAF15c_AH	KLHL3 (His)	HGE3_KLHL3_BH	TRIM9 (His)	HGE3_TRIM9_BH
DCAF16/DBB1 Complex	HGE3_DCAF16c_AHG	KLHL3 (Strep)	HGE3_KLHL3_BS	TRIM9 (Strep)	HGE3_TRIM9_BS
DBB1(Strep)	HGE3_DBB1_BS	KLHL3/CUL3 Complex	HGE3_KLHL3c_AS	TRIM9 (His)	HGE3_TRIM9_CH
DBB1/DDA Complex	HGE3_DBB1c_BS	KLHL40 (His)	HGE3_KLHL40_BH	TRIM9 (Strep)	HGE3_TRIM9_CS
ELOB/ELOC Complex	HGE3_ELOBc_AH	MDM2 (Strep)	HGE3_MDM2_AS	VHL/ELOB/ELOC Complex	HGE3_VHLc_AF
ELOB/ELOC Complex	HGE3_ELOBc_AS	MDM2 (His)	HGE3_MDM2_BH	VHL/ELOB/ELOC Complex	HGE3_VHLc_AGS
ENC1 (His)	HGE3_ENC1_AH	MDM2 (Strep)	HGE3_MDM2_BS	VHL/ELOB/ELOC Complex	HGE3_VHLc_AH
FBXL16/SKP1 Complex	HGE3_FBL16c_AHG	NEDD4L (His)	HGE3_NEDD4L_AH	VHL/ELOB/ELOC Complex	HGE3_VHLc_AHA
FBXL17/SKP1 Complex	HGE3_FBL17c_CHMS	RNF114 (His-SUMO)	HGE3_RNF114_AHSM	VHL/ELOB/ELOC Complex	HGE3_VHLc_AS
FBXL5 (Strep)	HGE3_FBL5_AS	RNF114 (Strep-SUMO)	HGE3_RNF114_ASSM	VHL/ELOB/ELOC Complex	HGE3_VHLc_BN
FBXL5/SKP1 Complex	HGE3_FBL5c_BH	RNF4 (Strep-SUMO)	HGE3_RNF4_ASSM	XIAP (His & Avi-Biotin)	HGE3_XIAP_AHAB
FBXL5/SKP1 Complex	HGE3_FBL5c_BS				

Delivery time: 1 week for domestic shipping, ~3 weeks for international shipping.



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

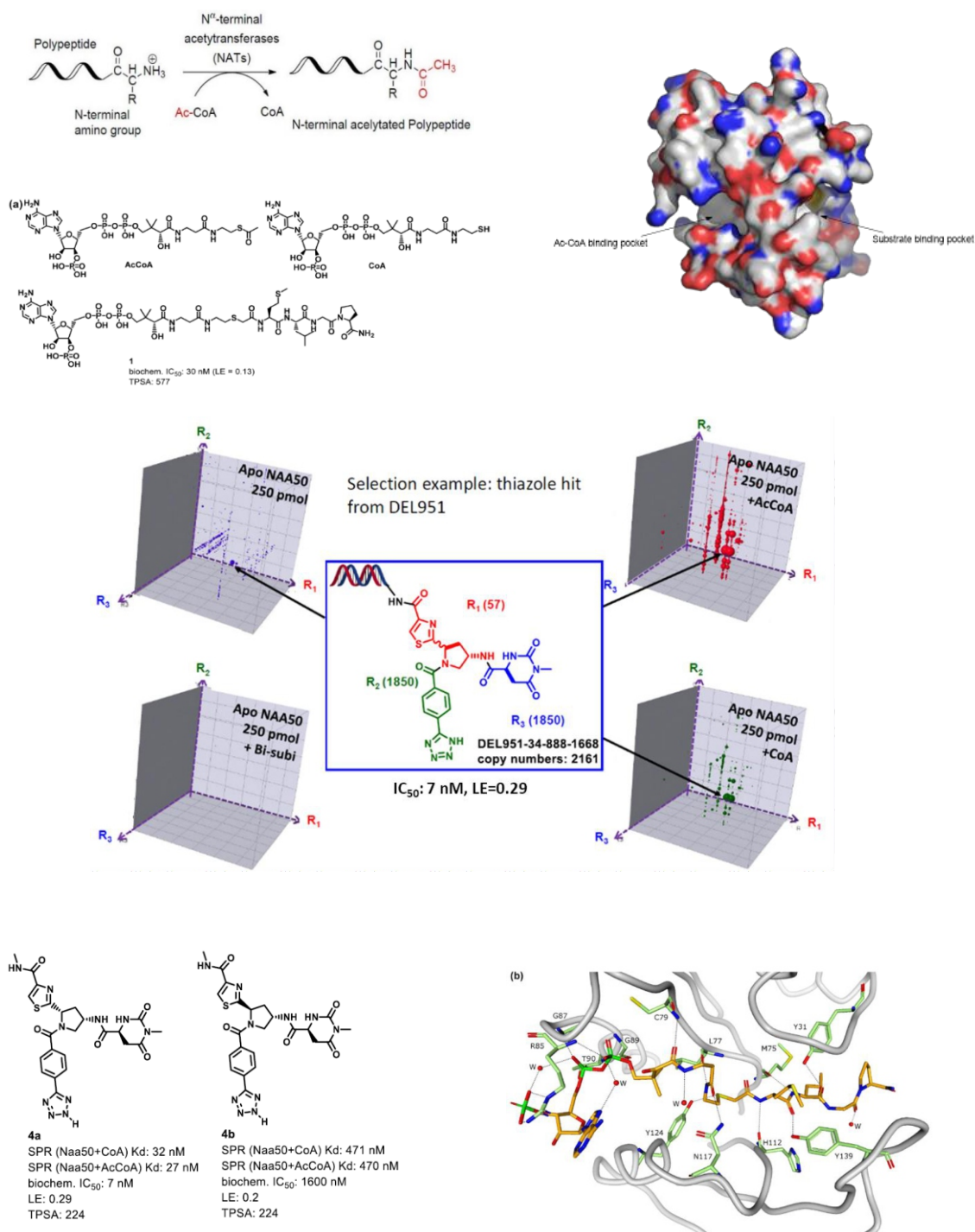
商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

案例分析:通过DEL筛选获得新颖NAA50小分子抑制剂*

(*与辉瑞制药合作项目, ACS Med. Chem. Lett. 2020, 11, 1175–1184)



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

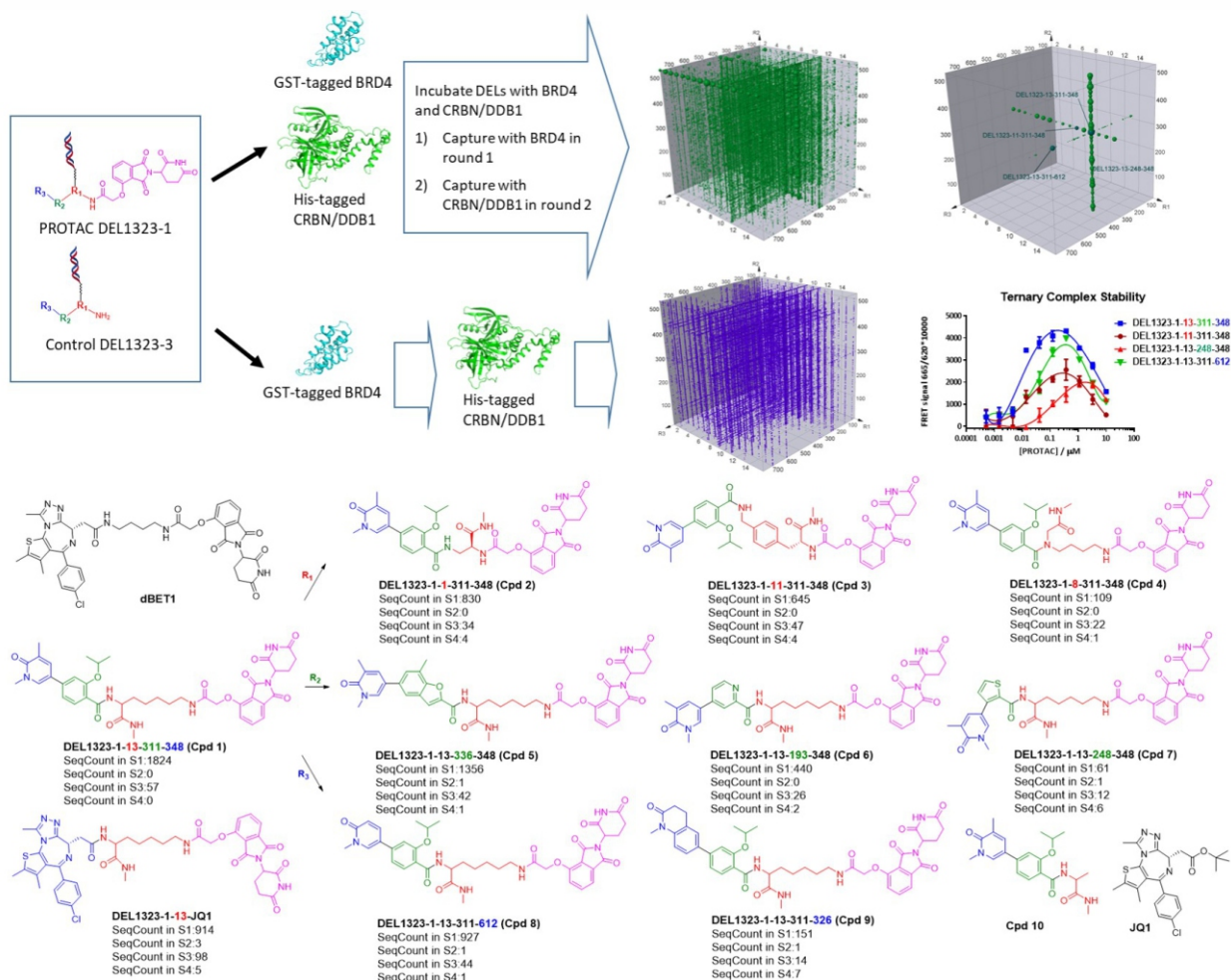
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

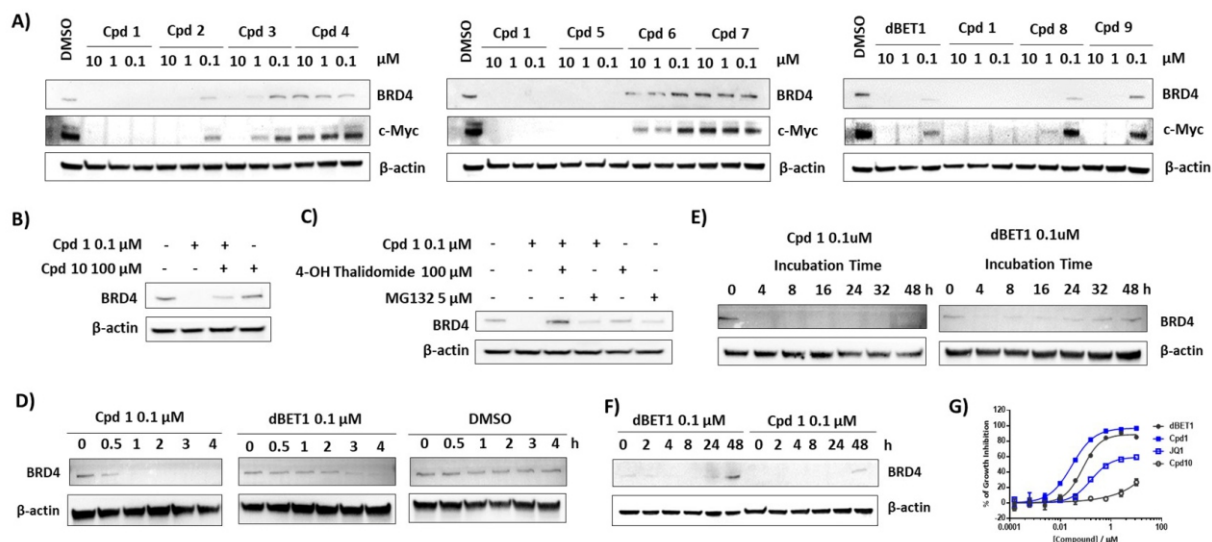
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

案例分析:通过DEL筛选的新颖BRD4降解剂发现



* S1: GST-BRD4 & His-CRBN/DDB1; S2: GST & DDB1; S3: GST-BRD4 then His-CRBN/DDB1; S4: GST then DDB1.



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

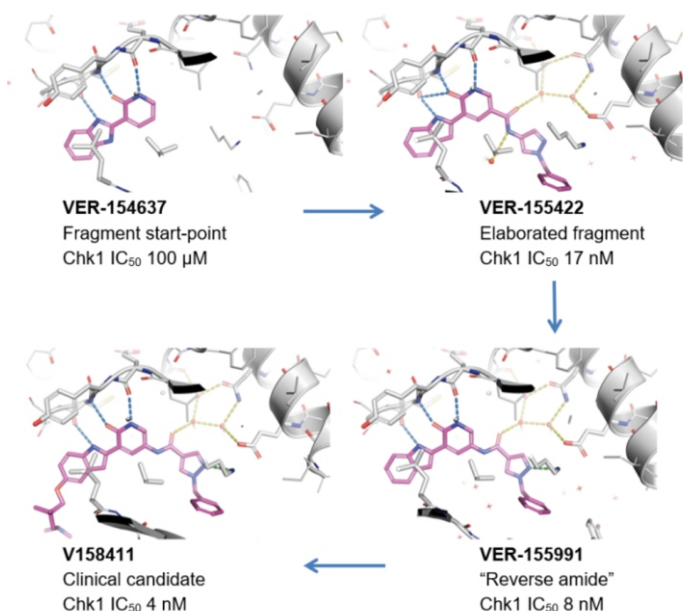
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

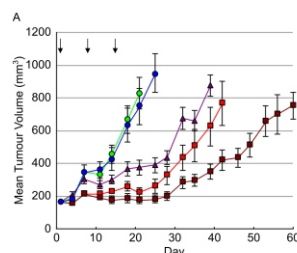
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

基于分子片段及结构设计的药物发现平台 (FBDD and SBDD)



X-ray crystal structures of compounds bound to the ATP binding site of Chk1 (PDB code V158411/ Chk1: 5DLS)



B

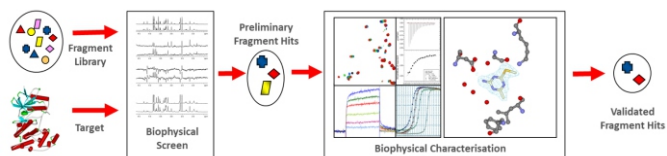
	V158411 (mg/kg)	Median TTE	T-C	%TGD	P
Colo205 (75 mg/kg irinotecan)	0	35.4	15.5	78	
	30	45.4	25.6	129	<0.01
	60	60.0	40.2	203	<0.001
SW620 (100 mg/kg irinotecan)	0	24.1	10.8	81	
	30	28.8	15.5	117	<0.01
	60	35.1	21.3	154	<0.01

TTE=(log₁₀endpoint volume)^b/m where b is the intercept and m the slope of the line obtained by linear regression of a log-transformed tumour growth data set; T-C, TTE_{treated}-TTE_{control}; %TGD, % tumour growth delay

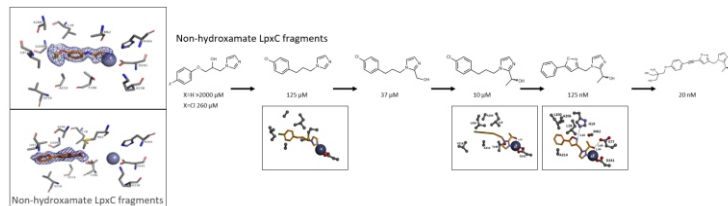
V158411 potentiates irinotecan cytotoxicity in human tumour xenografts. (A) nu/nu mice bearing established colon xenograft tumours were treated once weekly with either vehicle, irinotecan, V158411 or the combination of irinotecan followed by V158411 2 hours later. Tumour size and body weight were measured every 3 days. (B) Summary of in vivo responses to irinotecan plus V158411 combination therapy.

基于分子片段的药物发现 (FBDD)

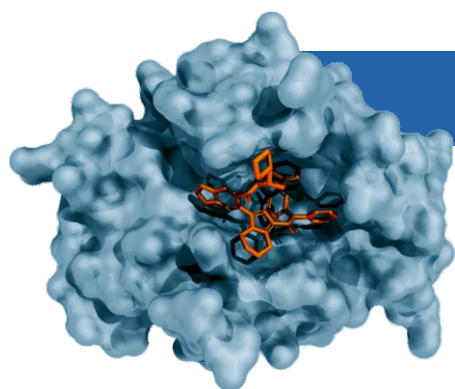
FBDD Screening



FBDD Structure-guided evolution



基于结构设计的药物发现 (SBDD)



3D structure guides our approach

Parallel approaches



Protein engineering



Chimeras & Surrogate proteins



Protein NMR



Data-guided modelling

6000+ crystal structures determined for more than 60 targets



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

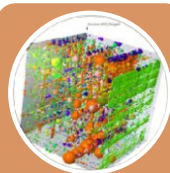
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

药物化学一体化研发



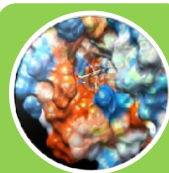
结构-亲和力关系 (SSR)

- DEL筛选过程中会产生大量有价值的SAR信息
- 对化合物结构的聚类分析可以用于确定药效团
- 片段的构效关系可以减少不必要分子的合成



蛋白质-小分子共晶

- 专业的蛋白表达及纯化团队
- 先进的蛋白质-小分子共晶结构生物学实验室
- 确认筛选得到的新颖化合物结合模式及作用机制



基于结构的药物设计 (SBDD)

- 基于SAR及共晶结构的分子模拟
- 药效团验证
- 验证关键相互作用模式并为化合物设计提供思路



大规模分子砌块库加速合成

- 3万种以上的试剂库
- 随时可取用的分子骨架
- 实现Hit-to-lead阶段试剂零延迟



合成化学

- 有经验的管理及研发人员
- 先进的实验仪器
- DEL技术帮助发现新分子实体



体内/体外生物学评价

- 极具竞争力的靶点生化测试能力及项目经验
- 内部细胞库涵盖100+细胞系
- 体内PK/PD平台
- 早期毒理研究平台



蛋白质结晶平台

专业的蛋白质科学团队致力于蛋白质表达与纯化;结构生物学实验室可产生蛋白晶体,确认化合物MOA及结合模式。

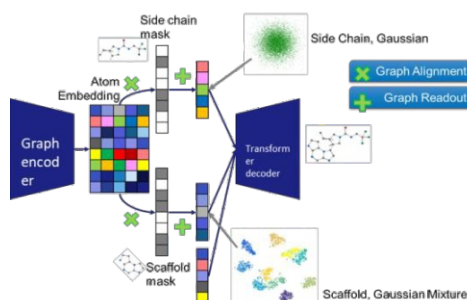
AI分子生成平台

通过大规模的化合物数据库学习并生成类药化合物,针对已有分子的骨架跃迁和定点优化。

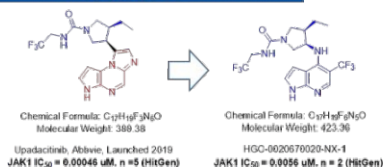
ADME预测平台

可进行常见ADME性质的预测:CYP抑制、hERG抑制、水溶性、渗透性以及代谢稳定性。

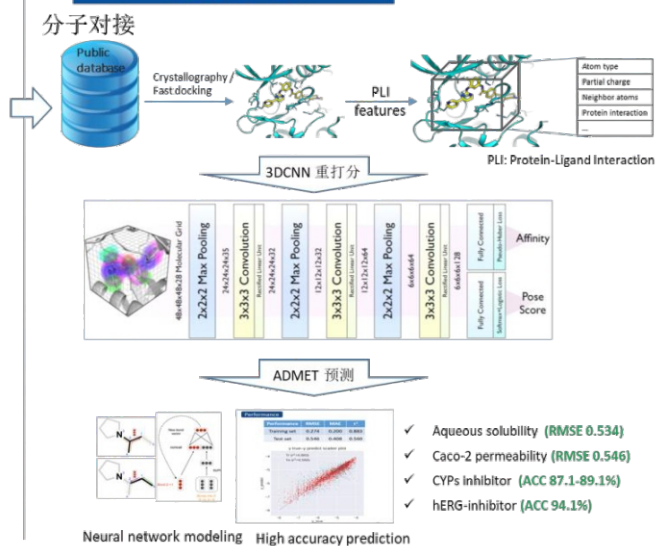
分子生成



案例分享



分子评价



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

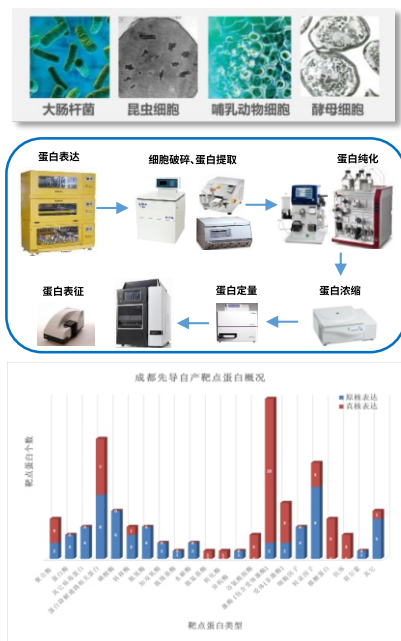
商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

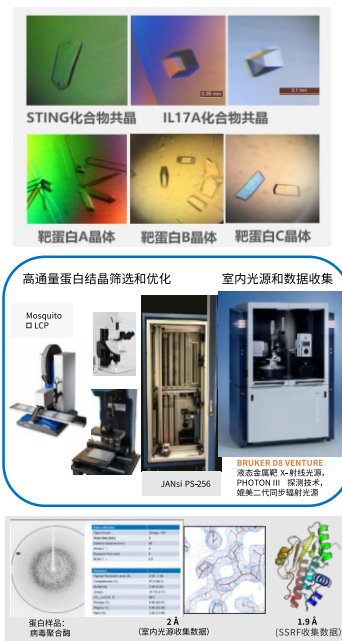
蛋白表达与结晶

蛋白表达与纯化



• 自主表达百余个新药靶蛋白, 涵盖20多种不同的靶点类型

蛋白结晶/蛋白-配体共晶



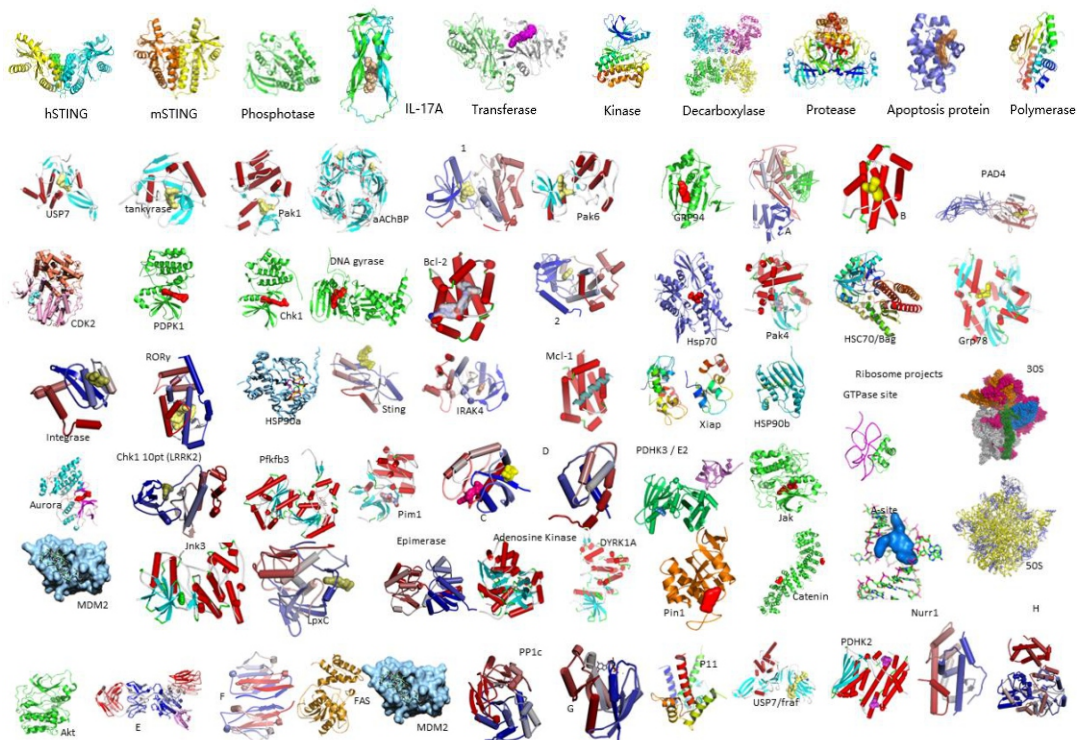
• 室内光源收集的衍射数据可达到接近同步辐射光源的质量

晶体衍射与结构解析



• 当前蛋白晶体学项目能力可达30-50个/年

解析过超过6,000个蛋白、蛋白-配体共晶结构



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

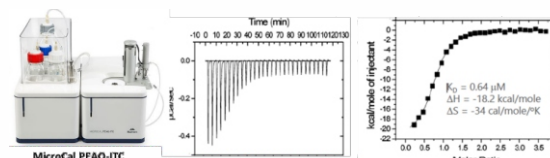
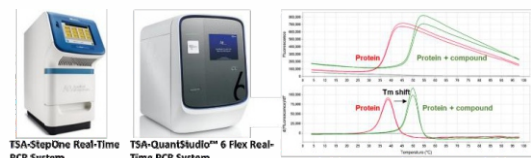
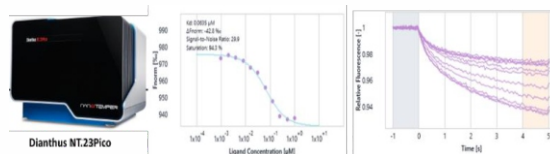
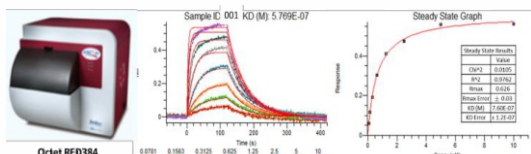
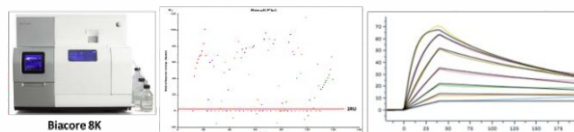
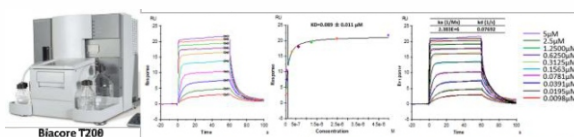
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

体外生物物理、生物化学检测方法与高通量筛选

生物物理检测

- 表面等离子体共振分析 (SPR/Biacore)
- 生物层干涉法分析 (BLI)
- 微量热泳动分析 (TRIC)
- 热位移分析 (TSA)
- 差示扫描荧光分析 (DSF)
- 等温滴定量热法分析 (ITC)



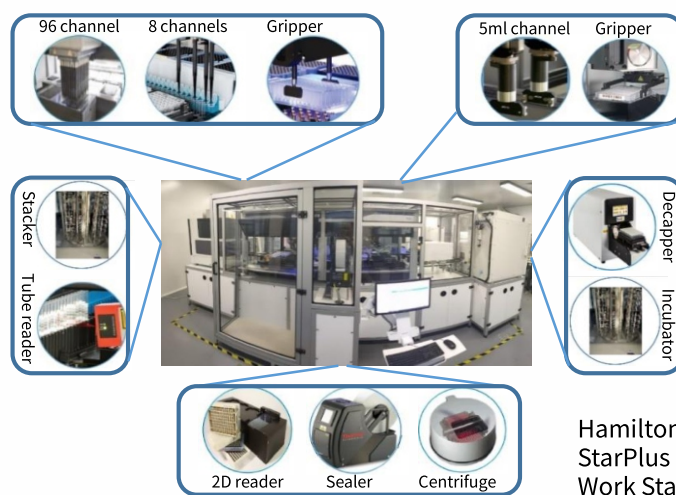
生物化学检测

- 比色分析 (基于吸收光等)
- 荧光分析 (FP, FRET, FI, calcium flux, etc.)
- 化学发光分析 (ELISA, Alpha-tech, BRET, Glo assay, etc.)
- 基于凝胶的反洗 (pulldown, WB, etc.)



中等通量筛选

- 宽范围试剂转移 (1-1000 μ L)
- 多个模块集成/实现多种功能
- 灵活的移液、分样与稀释
- 兼容96, 384和1536孔板



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

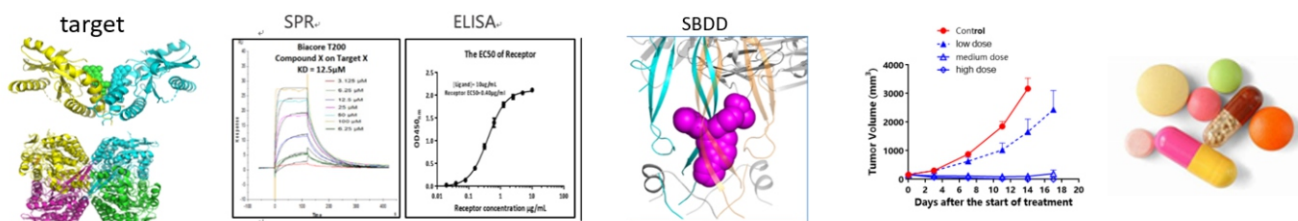
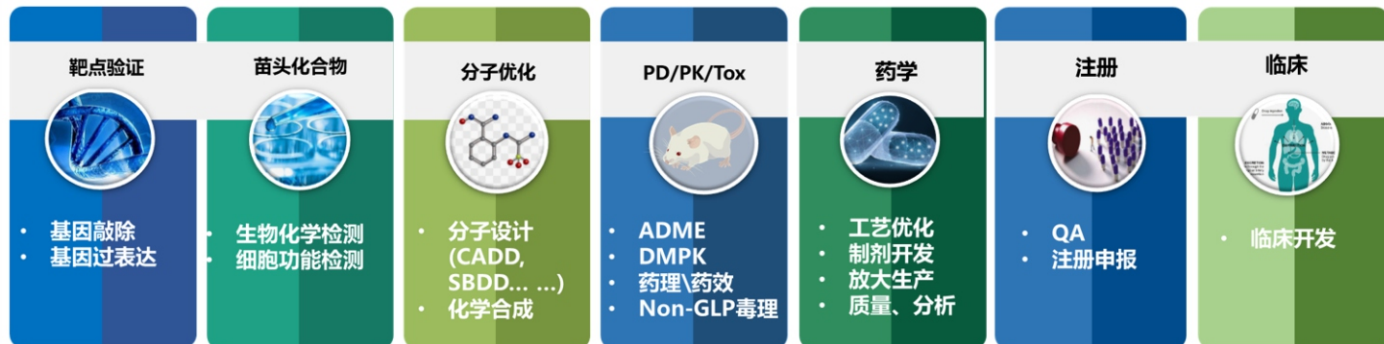
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

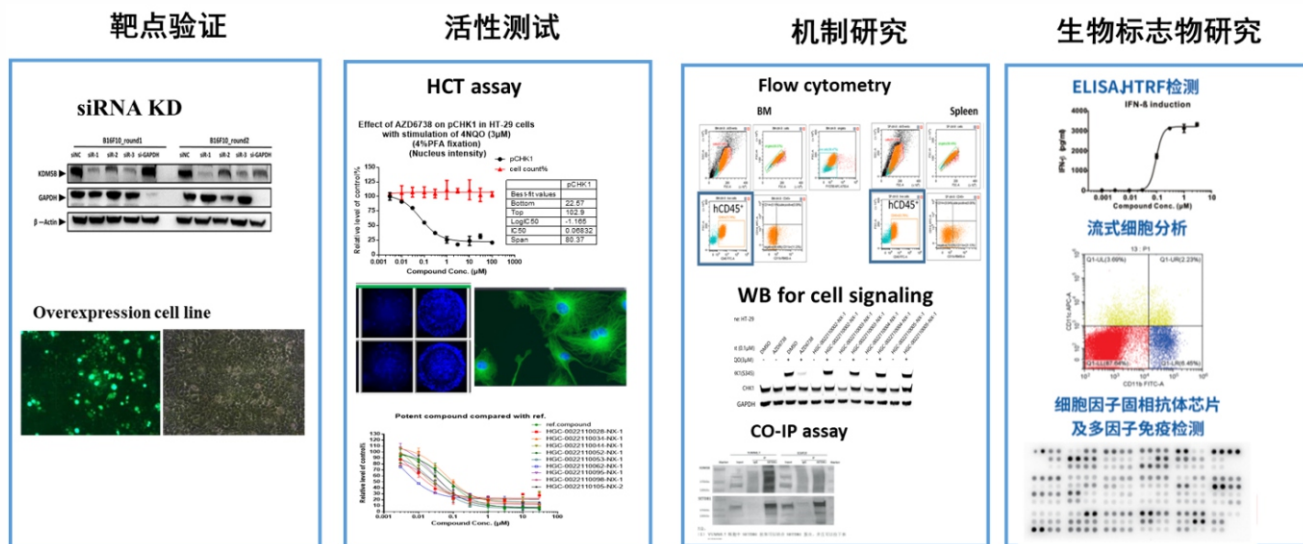
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

靶点验证至临床开发的一站式创新药研发体系



细胞生物学平台



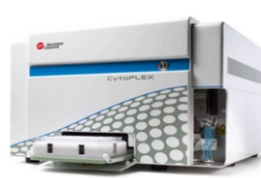
BSL-2级生物安全细胞房



共聚焦显微镜



流式细胞仪



高内涵细胞成像分析系统



成都先导药物开发股份有限公司

地址：中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话：+86 (28) 85197385

传真：+86 (28) 83310298

网址：www.hitgen.com

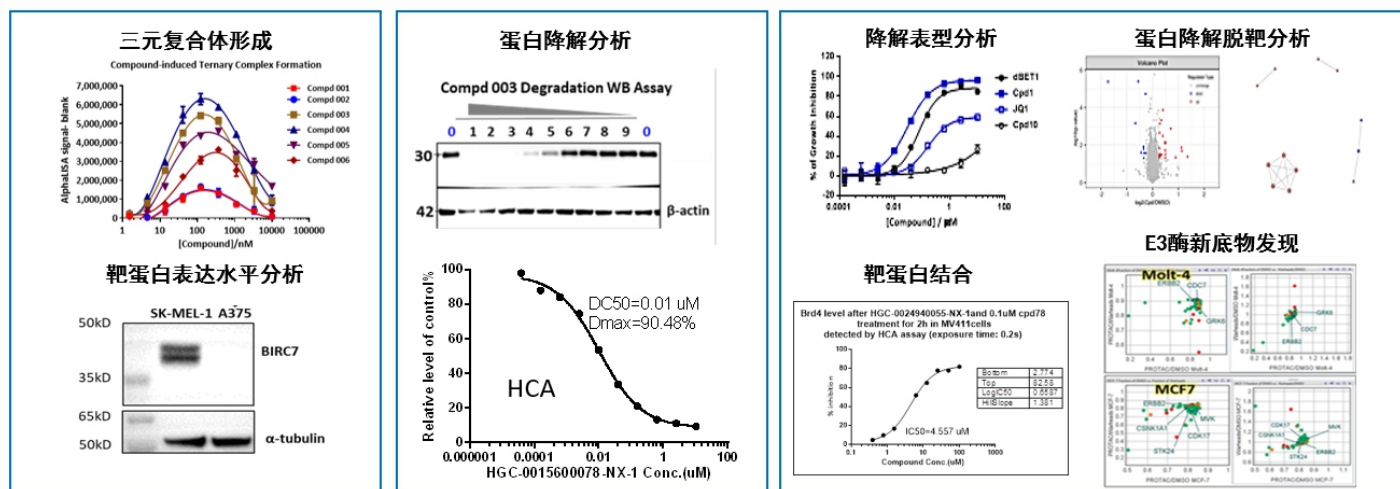
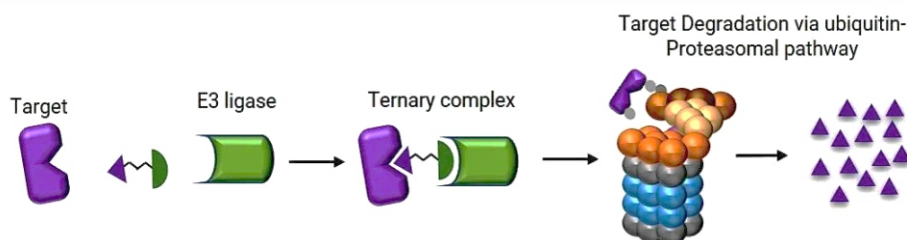
邮编：610200

商务合作：bd@hitgen.com

投资者关系：investors@hitgen.com

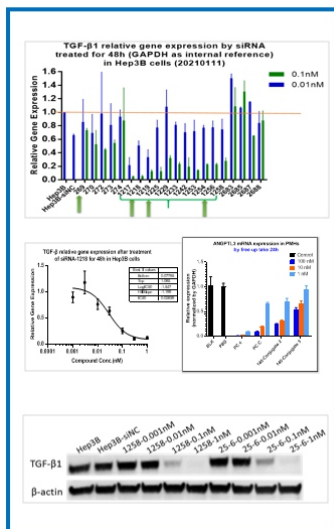
新分子 找先导

PROTAC细胞评价体系

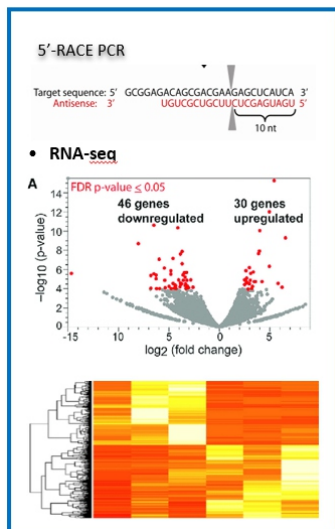


小核酸药物评价体系

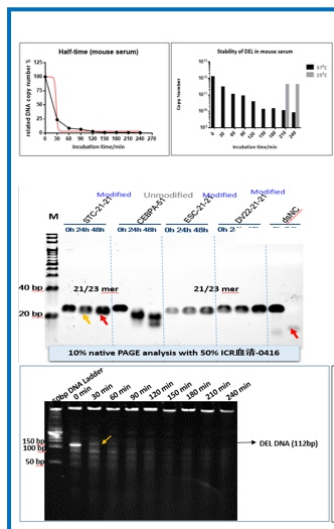
基因敲低检测



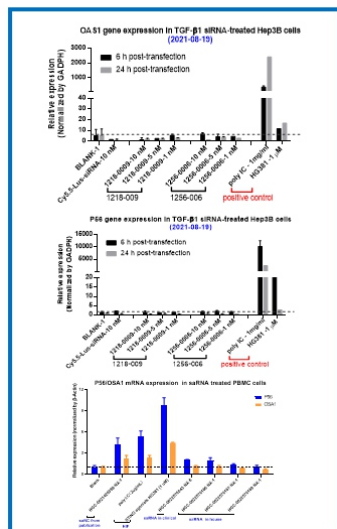
脱靶分析



稳定性/ADME



免疫原性分析



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城)慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

ADMET/DMPK/non-GLP毒理平台

体内DMPK

- 药代动力学分析
- 体内药物代谢产物分析
- 药物排泄途径分析
- 小鼠体内CYPs诱导分析
- 药物组织分布
- 药物排泄物分析(粪便、尿液)

Non-GLP安全性和毒代

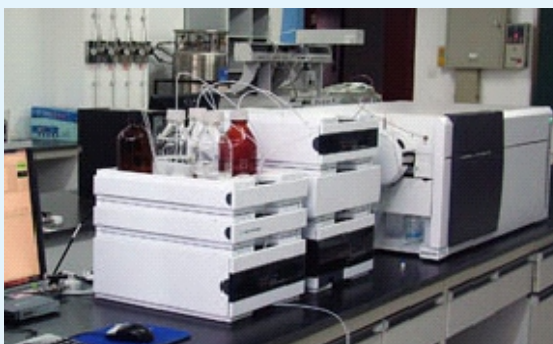
- Ames 试验
- hERG 抑制检测 (FP)
- 单次、多次给药毒性研究
- 药物毒代分析
- 药物蓄积研究

PK/PD研究

- PK-PD相关性分析
- 动物组织生物标志物检测 (WB, qPCR, FACS, ELISA, IHC, etc.)

体外ADME

- 微粒体稳定性
- 全血稳定性
- 微粒体蛋白结合
- 组织蛋白结合
- MDCK细胞渗透性
- Caco-2细胞渗透性
- PAMPA 血脑屏障渗透性
- CPYs 抑制
- 时间依赖CPYs 抑制
- CPYs 诱导 (PXR 诱导测定)
- 微粒体药物代谢谱 (MetID 检测)
- CPYs 表现检测 (重组酶法)
- CPYs 表现分析 (微粒体法)



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

分析与分离能力

Anal-SFC



Prep-SFC



GC-MS&LCMS



ICP-MS



UPLC-MS



Karl Fischer Titrator



Prep-HPLC



Prep-HPLC



LC-MS/MS (TQS)



HPLC



LC-MS



UPLC-MS



UPLC-MS (Q-TOF)



NMR



- 小分子化合物纯度分析与结构表征: HPLC、GCMS、LCMS、NMR
- 毫克级至克级分离纯化: Prep-HPLC
- 手性化合物分析与分离: Anal-SFC、Prep-SFC
- 核酸化合物分析表征: UPLC-MS

- 亲和筛选质谱: UPLC-MS (Q-TOF)
- 化合物定量分析: LC-MS/MS (TQS)
- 其他分析如元素分析 (ICP-MS)、水分含量测定 (Karl Fischer Titrator)



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

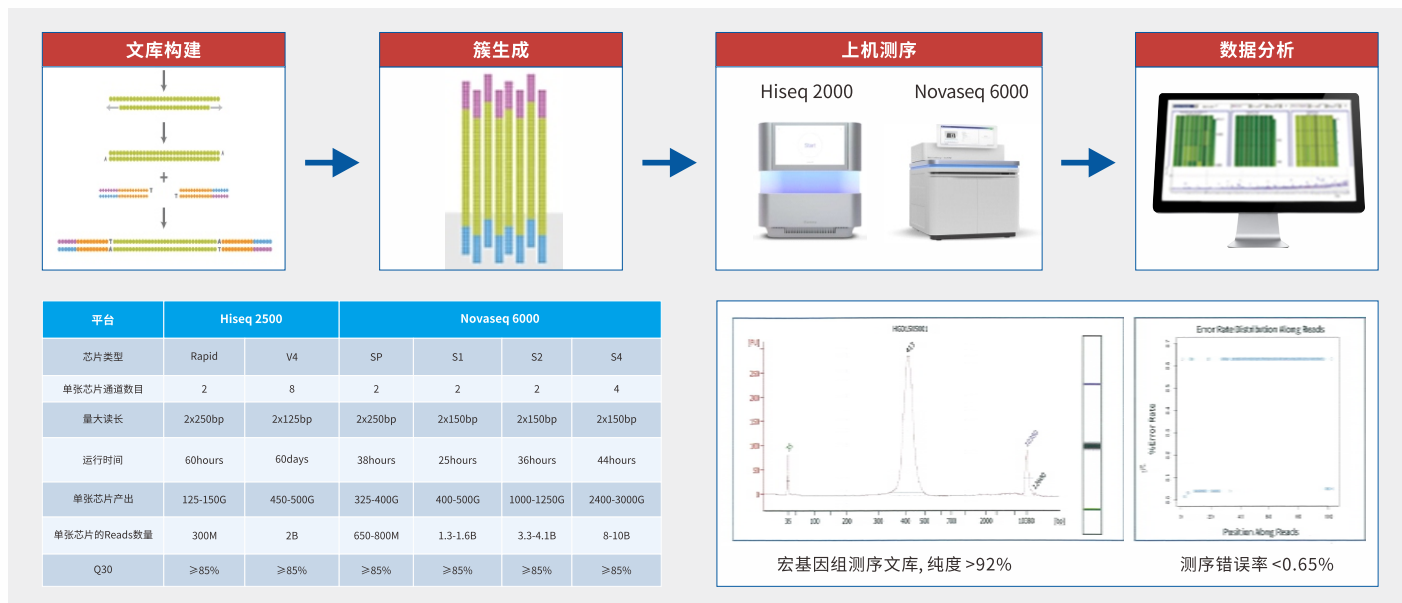
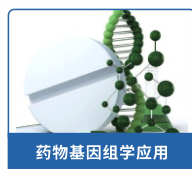
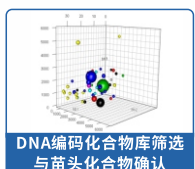
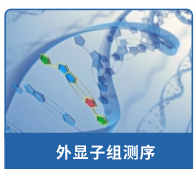
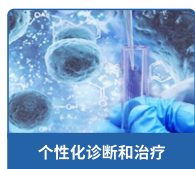
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

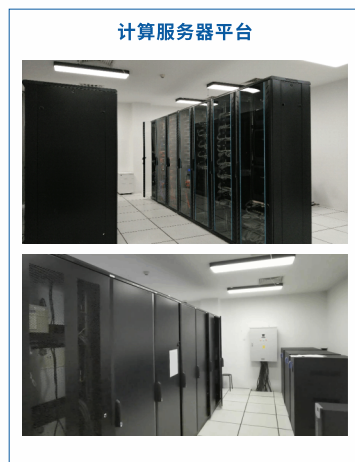
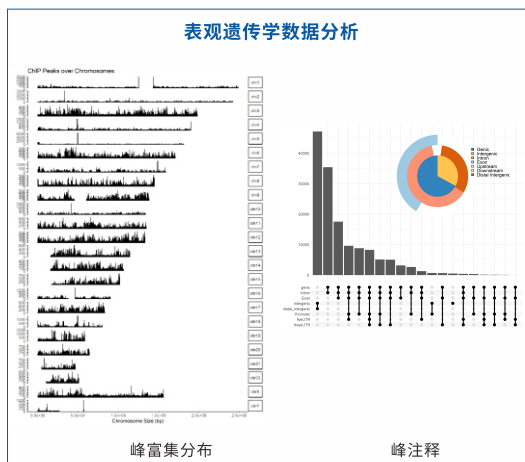
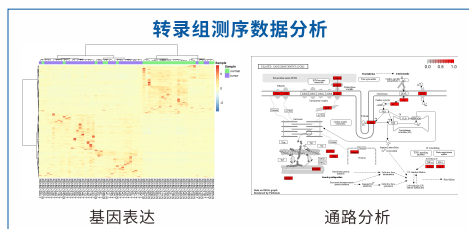
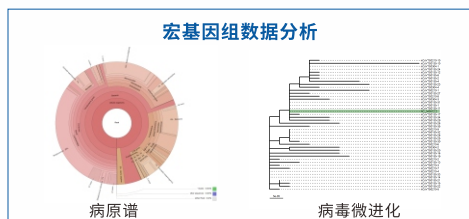
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

高通量测序的应用及服务



生物信息分析



注：以上各模块只展示了具有相当代表性的分析能力，另有更多的相关分析能力未披露。



成都先导药物开发股份有限公司

地址：中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话：+86 (28) 85197385

传真：+86 (28) 83310298

网址：www.hitgen.com

邮编：610200

商务合作：bd@hitgen.com

投资者关系：investors@hitgen.com

新分子 找先导

小核酸新药临床前研发平台

生物信息学
RNA设计

核酸药物化学

核酸递送及
制剂开发

分子及细胞生
物学

药效/药代/毒理

API和制剂
CMC

项目管理及申报

临床开发

生物信息学

- siRNA设计及化学修饰, 包括:
传统21/21, 21/23-mer siRNA
高活性25/27-mer Dicer substrate siRNA (DsiRNA)
- saRNA设计及化学修饰
- 靶点分析:mRNA transcript; abnormal gene (fused or mutated transcript)
- RNA药物on/off-target效应分析
- 核酸专利调研、FTO分析

配体偶联共聚递送化学

- GalNAc-RNA (Liver)
- lipid-RNA (CNS)
- 小分子配体-RNA (tumor)

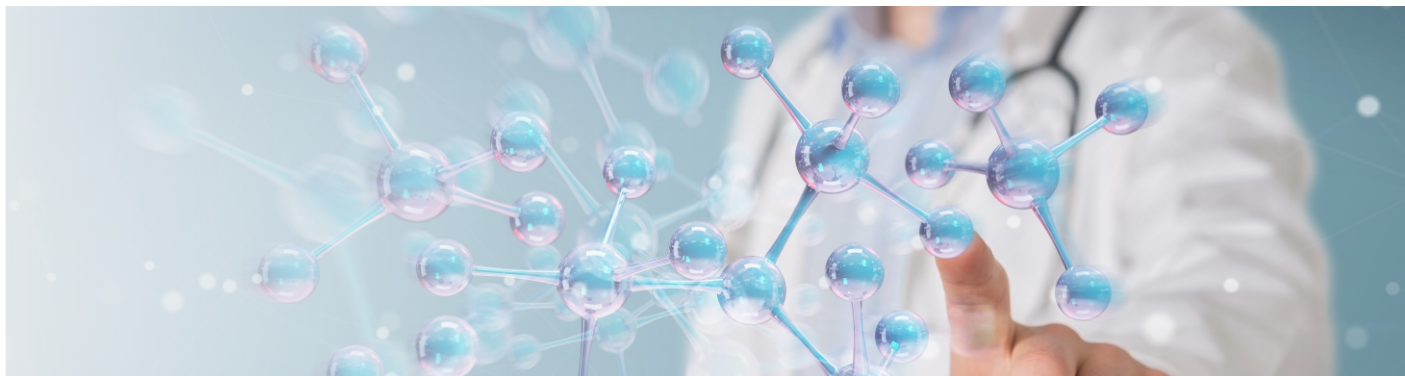
核酸药物化学

- 特殊单体合成
- 寡聚核苷酸合成(DNA, RNA, RNase-free HPLC purified, > 95%)
- 寡聚核苷酸化学修饰及共价偶联, 荧光标记
- CMC

分子/细胞/动物生物学

- 高通量细胞活性筛选及评价(含原代细胞)
- RNA药物on/off-target效应分析
- 免疫原性与毒性
- RNAi机制及选择性
- 血清稳定性及RNAi持续性
- ADME; 动物急毒、药效、药代评估

Note: CMC to be fully functional in 2023



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

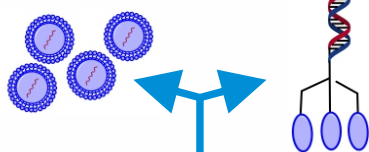
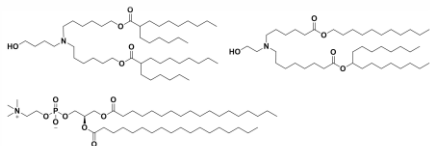
商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

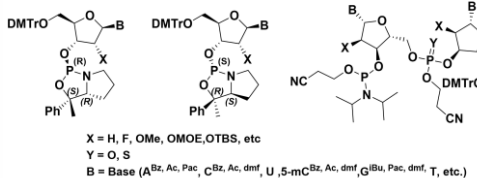
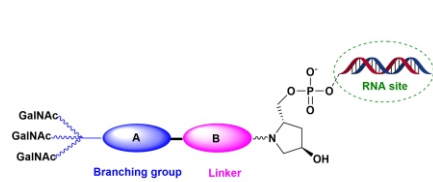
新分子 找先导

核酸药研发

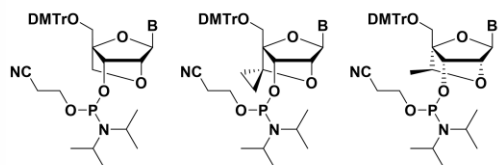
脂质体



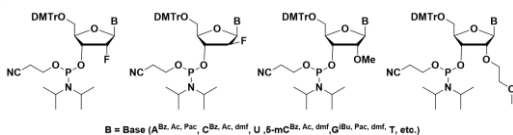
GalNAc偶联物



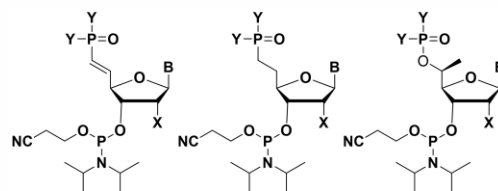
连接键修饰(手性单体)



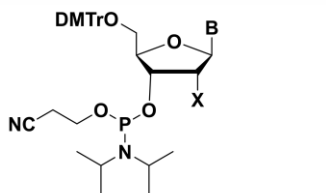
2',4'-锁核苷单体



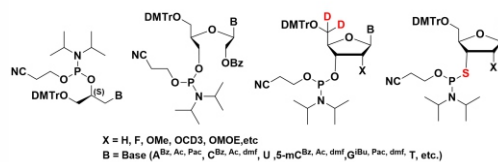
2'-修饰核苷单体



5'-磷酸化单体



碱基修饰单体



其他修饰单体(UNA, GNA)



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

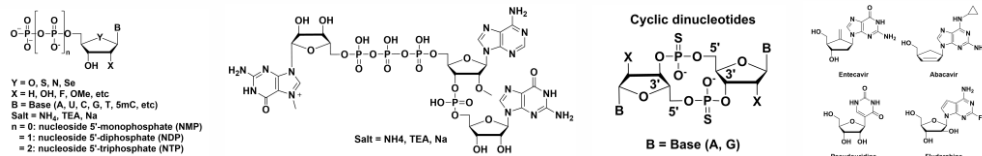
商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

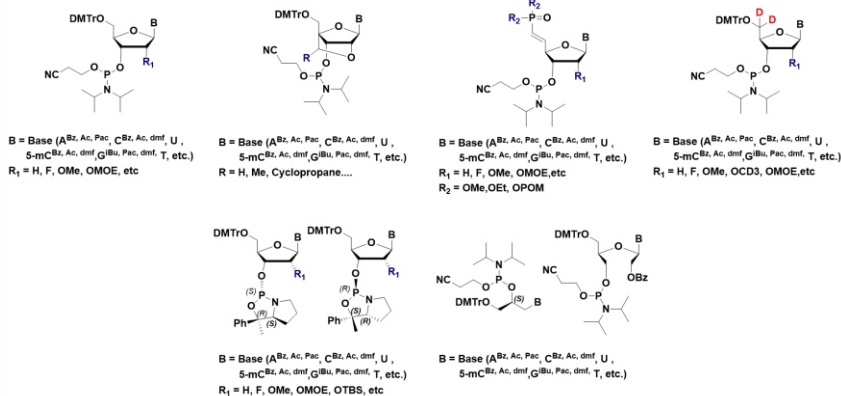
新分子 找先导

核酸药研发

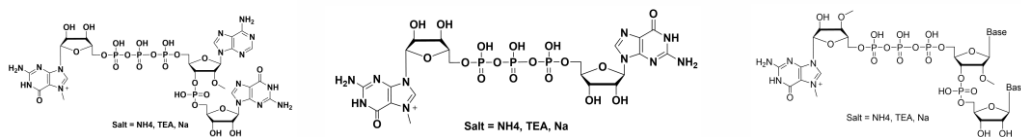
核苷及核苷酸



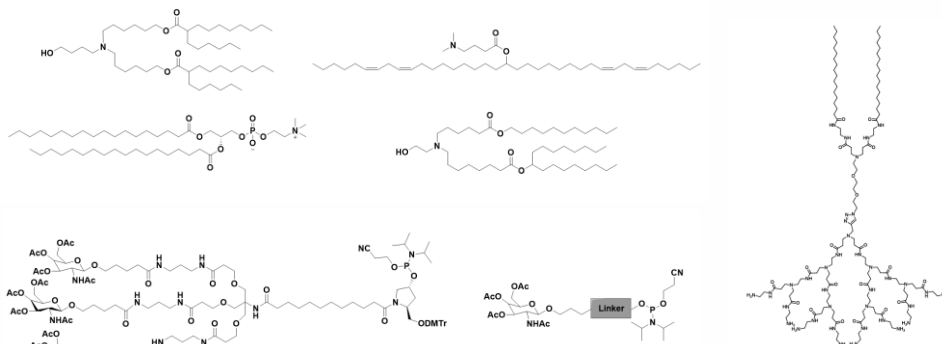
亚磷酸胺



mRNA盖帽剂



递送相关



注:以上所列化合物仅用于与知识产权相关的科学研究和实验, 以及为行政审批提供必要信息。未经知识产权所有方授权不得进行商业销售。



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

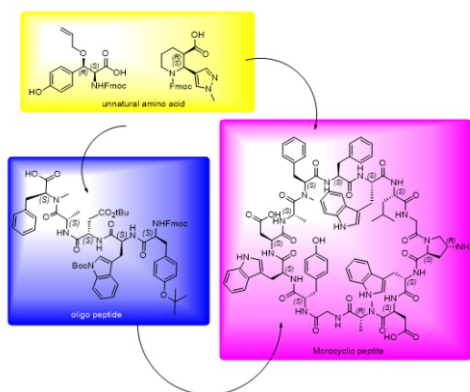
合成化学服务

- ▶ **分子砌块：**
 - 库存超过4万种类药分子砌块
- ▶ **合成化学家团队：**
 - 超过两百名合成化学家专注于分子合成服务
- ▶ **合成项目：**
 - 每年交付超过2000个类药分子
 - 成功交付率超过85%
- ▶ **高于行业水平的交付周期：**
 - 平均9-22个工作日 (包含海外邮寄)
- ▶ **供应链管理：**
 - 与全球100家试剂供应商长期合作

- ▶ **分子类型**
 - 非天然氨基酸
 - 多肽 (大环多肽)
 - 大环分子
 - 杂环分子
 - PROTAC
 - 核苷 (酸)
 - 寡聚核苷酸
 - ADC/AOC
- ▶ **合成规模：**
 - 毫克~公斤

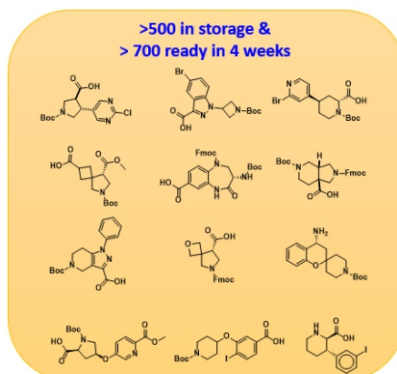
多种类型分子合成

• 非天然氨基酸、多肽、大环



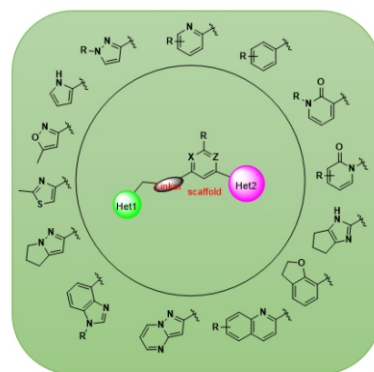
- ▶ HitGen设计和合成了500多种独特的非天然氨基酸, 作为药物分子设计的砌块资源, 已应用于诸多内部和外部项目中。
- ▶ 跨越氨基酸单体, 多肽和环肽, 成都先导拥有丰富的合成与项目经验。

• 类药优势骨架



- ▶ **类药优势:** 超过80%的骨架结构由1~3个优势环系构成。
- ▶ **新颖:** 超过80%的结构未见报道记录 (SciFinder & Raxys数据库)。
- ▶ **快捷:** 超过500个库存骨架和700个目录产品。

• 杂环分子



- ▶ 平均每年为内部和外部项目合成2000种杂环分子。
- ▶ 在之前的项目中通过全新合成构建了100多种环系。
- ▶ 在合成杂环分子方面具有丰富经验, 涵盖从毫克级到千克级的规模, 以及超过15步的长合成路线。



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

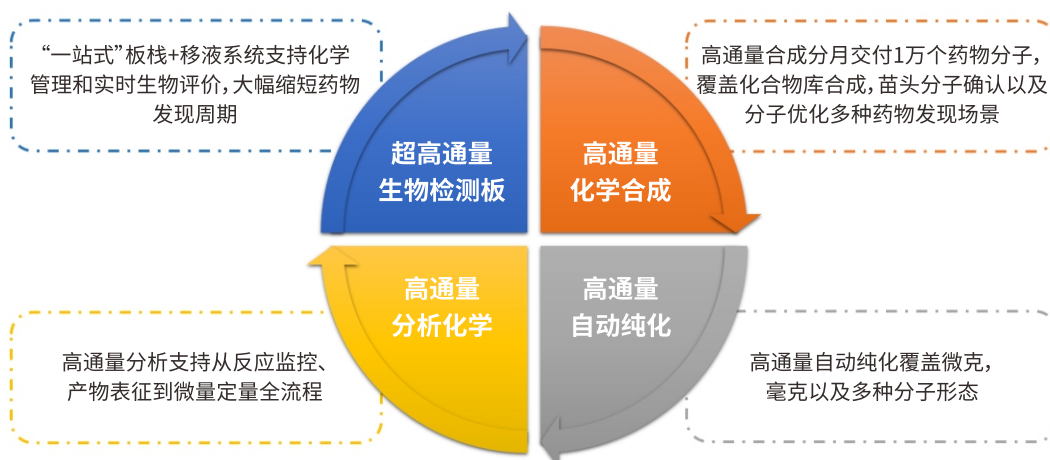
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

高通量合成平台

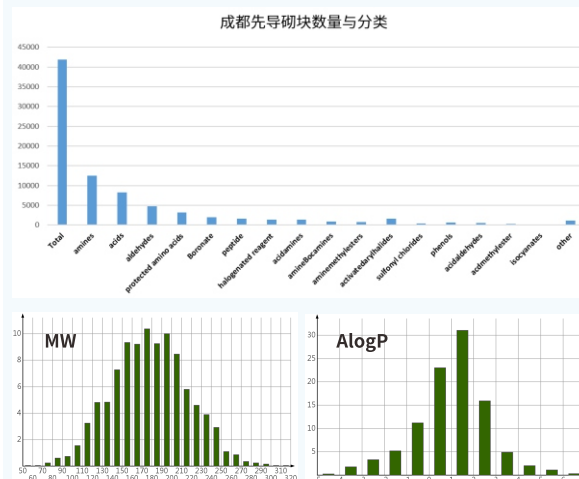


· 通量能力

场景	合成步骤	交付量	纯度 (LC-MS)	通量
A	1-5 步	0.1 mg	>=85%	10,000 化合物/月
B	1-5 步	0.5 mg	>=85%	6,000化合物/月
C	1-5 步	2 mg	>=85%	3,000化合物/月
D	1-5 步	20 mg	>=85%	800化合物/月

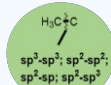


·砌块能力



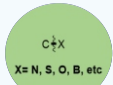
·化学能力(>150种常用药物化学反应)

Carbon-Carbon Bond Formation



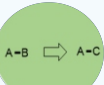
- Metal catalyzed
 - Suzuki
 - Heck
 - Sonogashira Cross Coupling
 - Henry Condensation
 - Ring Closing Metathesis (RCM)
 - boronate addition
- Wittig olefination/HWE Olefination
- Aldol Condensation
- Mannich Reaction
- Diels Alder Cycloaddition
- Indole C-3 Alkylation
- Photoredox (recently developed)
 - C-H Activation
 - Decarboxylation coupling
 - [2+2] Cyclobutane generation

Carbon-Hetero Bond Formation



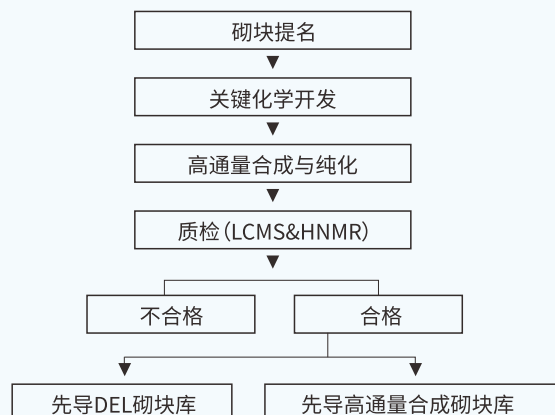
- Acylation
- Reductive Amination
- Urea/thiourea Formation
- Carbomoylation
- Cyanamide Formation
- Guanidine formation
- Buchwald-Hartwig Cross Coupling
- Ullmann Coupling
- Cushman Reaction
- SN2 Replacement
- SNAr
- Michael Addition
- Petasis Mannich Reaction
- SNAr
- Sulfonylation Formation
- Cross Coupling(C-S)

Functional Group Transformation



- NO₂ to Amine
- Azide to amine
- Amine to azide
- Halide to azide
- Halide to amine
- Halide to alkyne
- Halide to hydrogen
- Halide to acid
- Halide to cyanide
- Halide to alkene
- Halide to boronates
- Aldehyde to alkene
- Aldehyde to alkyne
- Alkene to aldehyde
- Thioether to Sulfoxide or Sulfone

成都先导——专有砌块合成流程



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城)慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

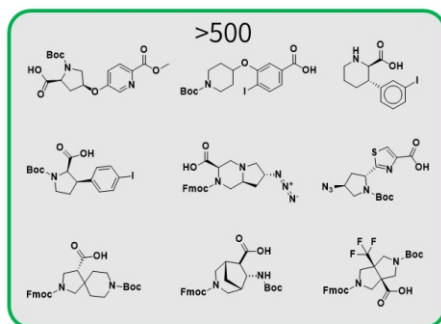
投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导

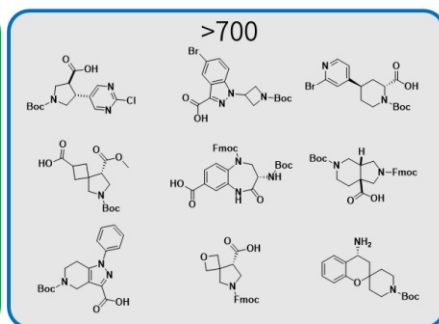
高通量合成平台

· 骨架能力

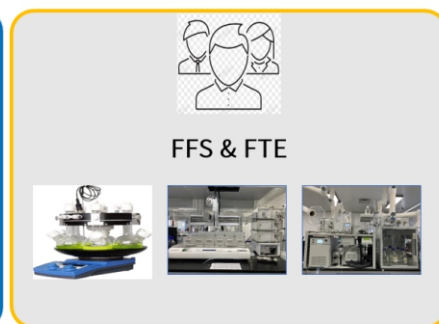
- ▶ 骨架富含双官能团或三官能团(羧酸、胺、卤素、醛等), 适配多种化学合成方法;
- ▶ 超过80%的骨架包含1至3个优势环系(统计数据来自ChEMBL数据库);
- ▶ 结构新颖: 经过Reaxys和SciFinder数据库双重检索, 超过80%的骨架未被报道;
- ▶ 化学可行性: 所有骨架的反应性均通过常用药物化学反应验证;
- ▶ 快速交付: 除了库存试剂外, 更过骨架试剂可在4周内就绪。



库存产品

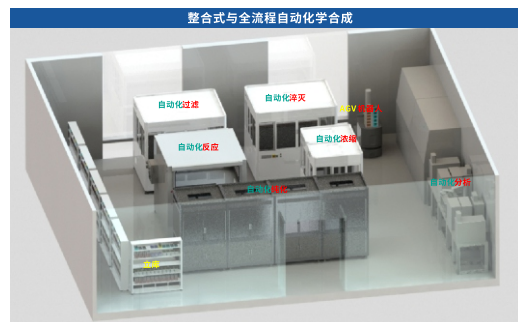


快速获得产品 (4周)



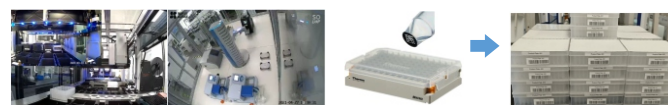
定制合成 (4~8周)

· 自动化合成



- 立库
- 自动化反应
- 自动化分析
- 自动化淬灭
- 自动化过滤
- 自动化纯化
- 自动化浓缩
- AGV 机器人

· 超高通量生物检测板制备系统



Product Plate	Product Well	Concentration (mM)	Volume (uL)	Purity (254 nm)	Product Smiles
Product-Plate--391	A7	1.0	50	97%	<chem>C(=O)CC3=CC=C(CNC(C(C)C)C(C)C)C3</chem>
Product-Plate--391	A8	1.0	50	99%	<chem>C(C=C(OCC(N(CCC4N(CCC5C)C(C)C)C4)C)C)C</chem>
Product-Plate--391	A9	1.0	50	90%	<chem>C=C(CNC(N(C[C@@H](S(=O)(=O)C)C)C)C</chem>
Product-Plate--391	A10	1.0	50	85%	<chem>C=C(C(C(C(C(C4C(=NC5CCC)C(C)C)C4)C)C)C)C</chem>
Product-Plate--391	A11	1.0	50	96%	<chem>C3=C(C=C(OCC(NCCN4CC(COC(C)C)C)C)C)C3</chem>
Product-Plate--391	A12	1.0	50	98%	<chem>C=C(C(C(C(C(C(F)F)C)C)C)C)C</chem>
Product-Plate--391	B1	1.0	50	99%	<chem>C=C(OCC(NC4=CC5=C(N(C(C)C)C)C)C)C</chem>
Product-Plate--391	B2	1.0	50	97%	<chem>NC[C@@H]4[C@@H](C5N(C)C)C</chem>

· 正在建设的能力: “AI+自动化” 高效化合物优化平台

AI+研发数据反馈的高效化合物设计能力

高通量自动化化合物合成能力



AI+药化专家的构效关系分析能力

高通量化合物检测能力



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

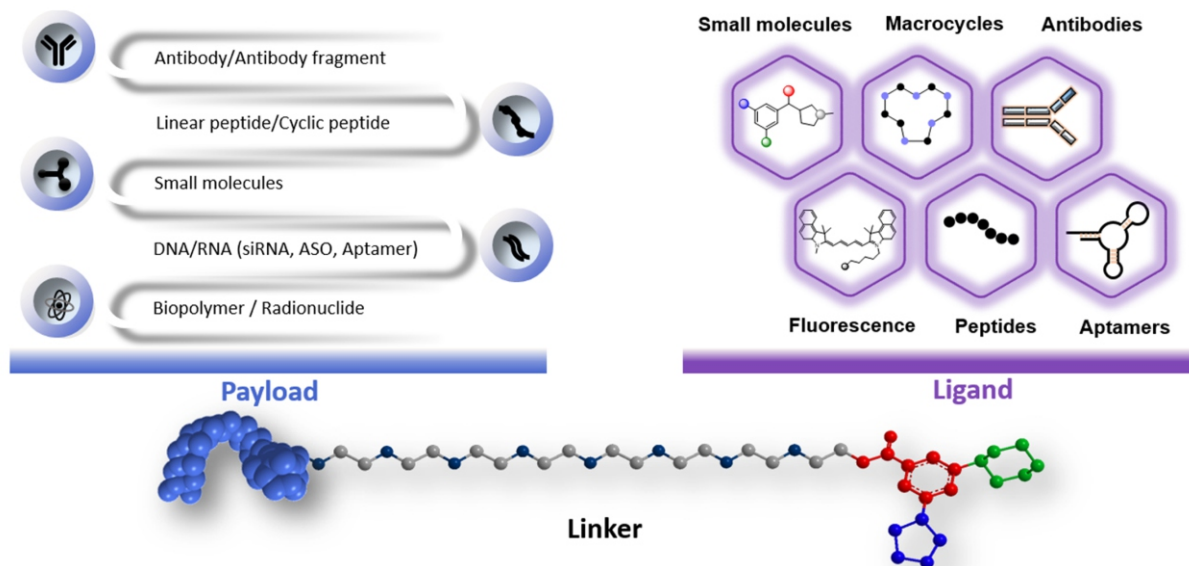
邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

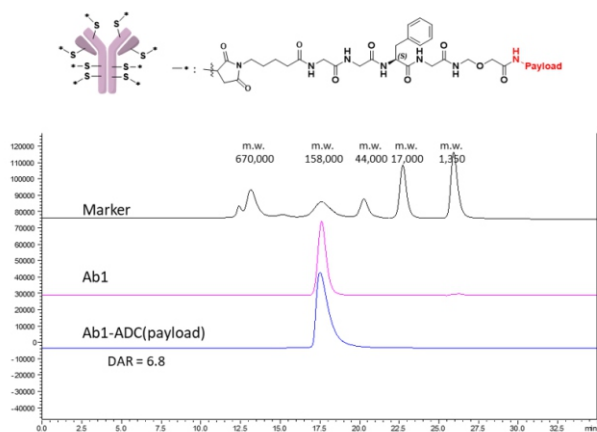
新分子 找先导

生物偶联技术平台

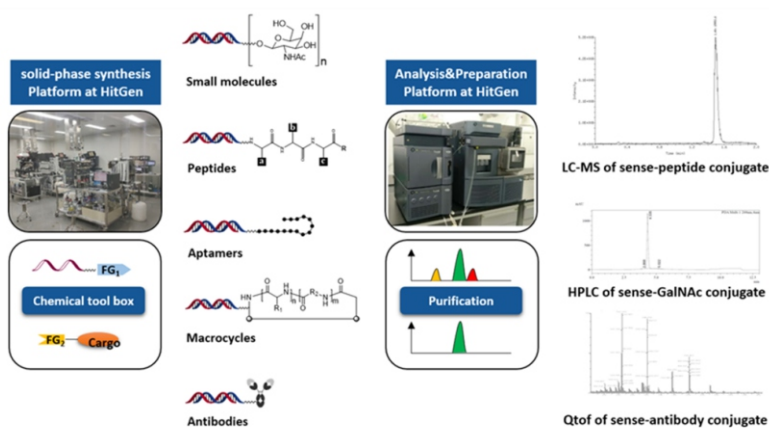


案例分析：生物偶联技术合成

Antibody Conjugation



Oligo Conjugation



成都先导药物开发股份有限公司

地址：中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话：+86 (28) 85197385

传真：+86 (28) 83310298

网址：www.hitgen.com

邮编：610200

商务合作：bd@hitgen.com

投资者关系：investors@hitgen.com

新分子 找先导

新药 管线

小分子药物管线

领域	项目	适应症	苗头化合物优化	先导化合物优化	PCC确认	IND申报	临床试验
癌症	HG146: Class I/IIb HDAC抑制剂, 胶囊	多发性骨髓瘤					
		实体瘤					
	HG030: 二代 NTRK/ROS1抑制剂, 片剂	实体瘤	(已获美国FDA IND 中国大陆权益已转让)				
	HG381: 2nd STING激动剂, 冻干粉	实体瘤					
	HG153: 靶向融合蛋白	急性白血病					
	HG248: 蛋白降解	癌症					
炎症	HGP0508: 口服 IL-17A 小分子抑制剂	炎症					
其他	HGP1069: ROCK2抑制剂, 滴眼液	青光眼					

注: 数个早期项目未展示于表中。FIC, first-in-class; BIC, Best-in-class



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城) 慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385

传真: +86 (28) 83310298

网址: www.hitgen.com

邮编: 610200

商务合作: bd@hitgen.com

投资者关系: investors@hitgen.com

新分子 找先导



成都先导药物开发股份有限公司

地址: 中国四川省成都市双流区(天府国际生物城)慧谷东一路8号C2栋

电话: +86 (28) 85197385 传真: +86 (28) 83310298 邮编: 610200

邮箱: BD@hitgen.com

网站: www.hitgen.com

—— 新 分 子 找 先 导 ——

HITGEN