

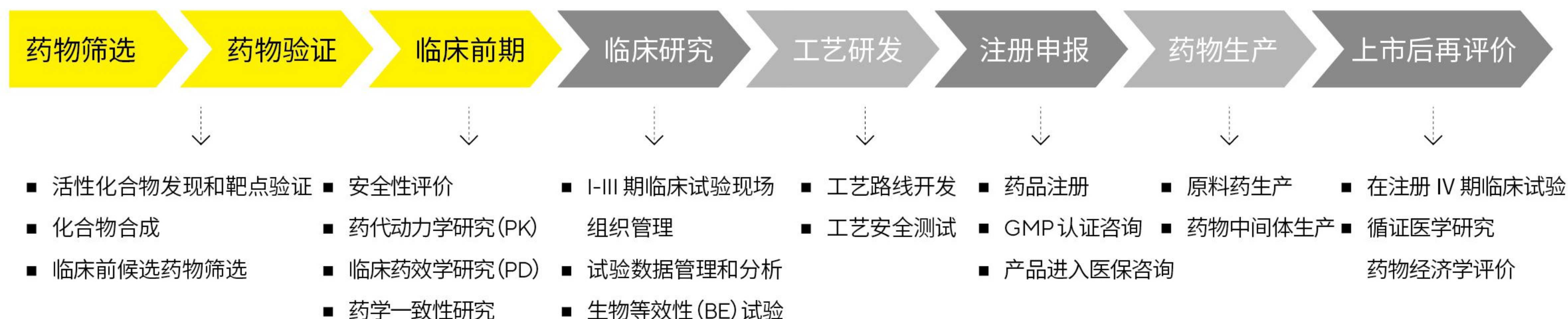


小分子化药  
从研发到生产质控  
的解决方案

Simplifying Progress

SARTORIUS

从1899年阿司匹林为代表的小分子化药的问世,到20世纪末的靶向化药的蓬勃发展,小分子化合物药物经久未衰且呈现创新转型之势。赛多利斯实验室产品和服务部门,为化药客户提供从早期研发药物筛选到生产监控,分析质检等多方面的解决方案,为您的化药研究和上市保驾护航。



## Octet® 在小分子药物筛选的案例

### 案例一 高通量化合物筛选

基于生物传感器的片段化合物筛选是药物研发过程中一个非常具有价值的工具。BLI 技术通过实时监测生物分子结合导致的光的干涉图谱的变化实现分子间的相互作用的检测。

中国医学科学院的研究人员首先通过基于 AI 筛选,筛选了 15220 个化合物,选择结合最强的 50 个 hits,通过 Octet® 高通量的分析了这些化合物与靶点 SARS-CoV-2 RdRp 的结合活性。结果发现 Corilagin (RAI-S-37)作为 SARS-CoV-2 RdRp 的非核苷抑制剂,具有良好的安全性和药代动力学的参数,使其成为新冠肺炎潜在的治疗药物。

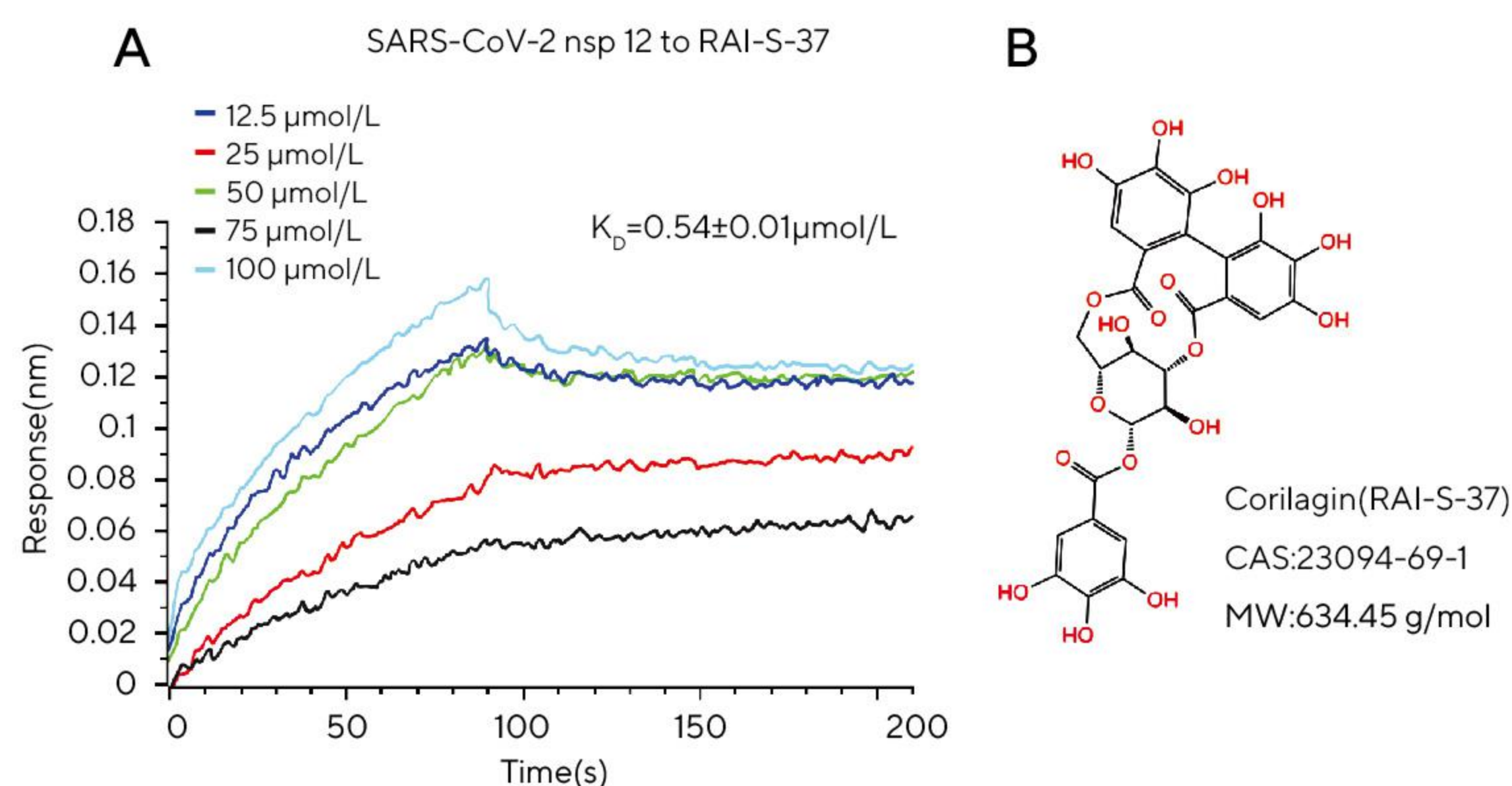


图1 根据其与靶点蛋白的结合活性来筛选苗头化合物

### 案例二 动力学参数表征

化合物药物与靶点的动力学参数是非常重要的表征参数,直接影响到了化合物在体内的半衰期以及所需的药物剂量。

BLI 技术可以实时监测分子间的相互作用的整个过程, GSK2801 与 BAZ2B 的结合呈现快结合与快解离的结合模式。

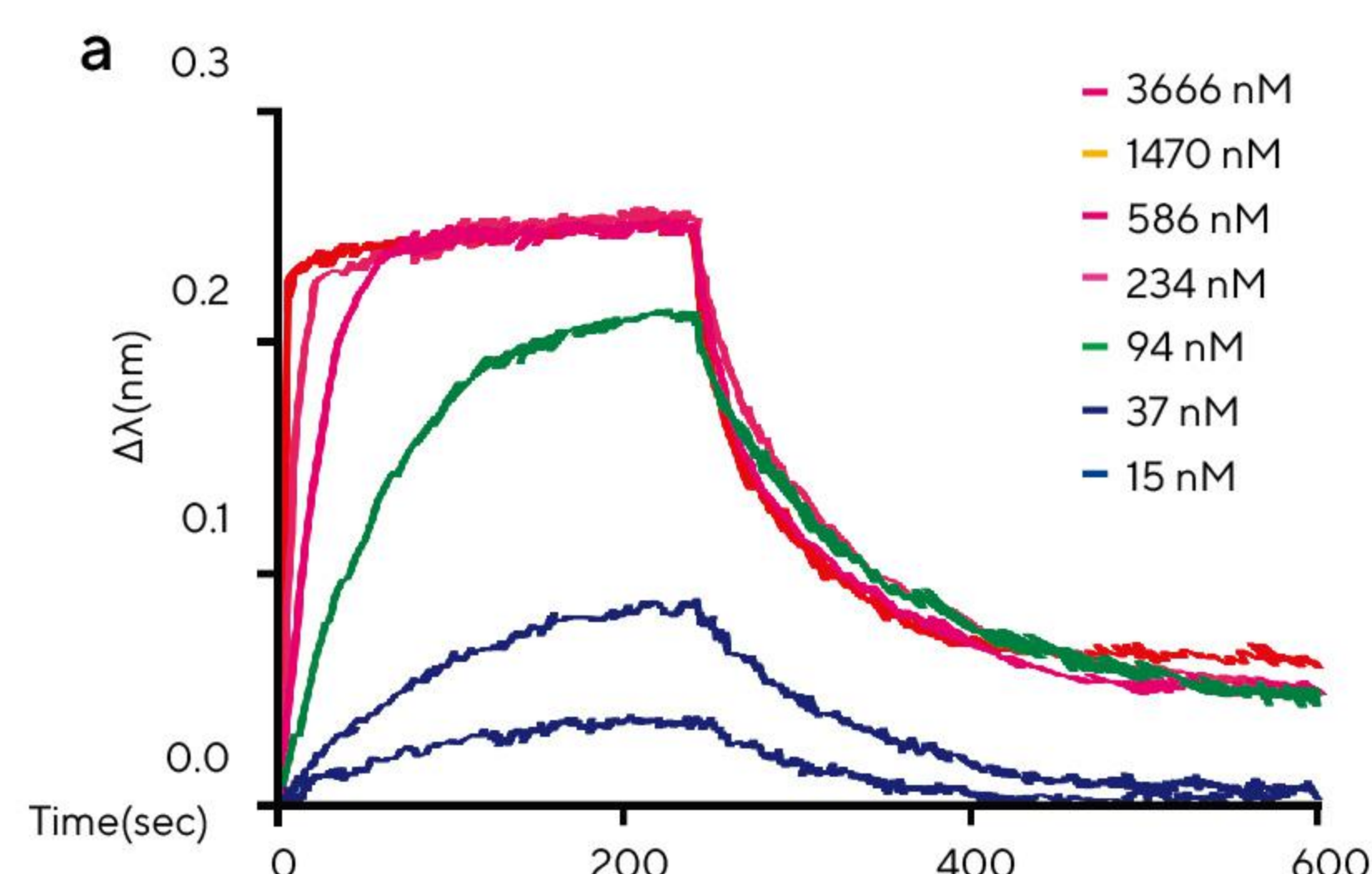


图2 GSK2801与BAZ2B的结合解离原始图

### 案例三 阻断与竞争分析

已知某化合物与蛋白结合,需要观察另一个化合物是否阻断这种结合,将化合物进行固化,然后检测另一个化合物与蛋白的混合物。

通过竞争实验可见, Masitinib 与 Imatinib 几乎完全竞争,这证明了他们的结合位点一致。但是与核苷类化疗药物(吉西他滨,阿糖胞苷,地西他滨)竞争关系不明显。

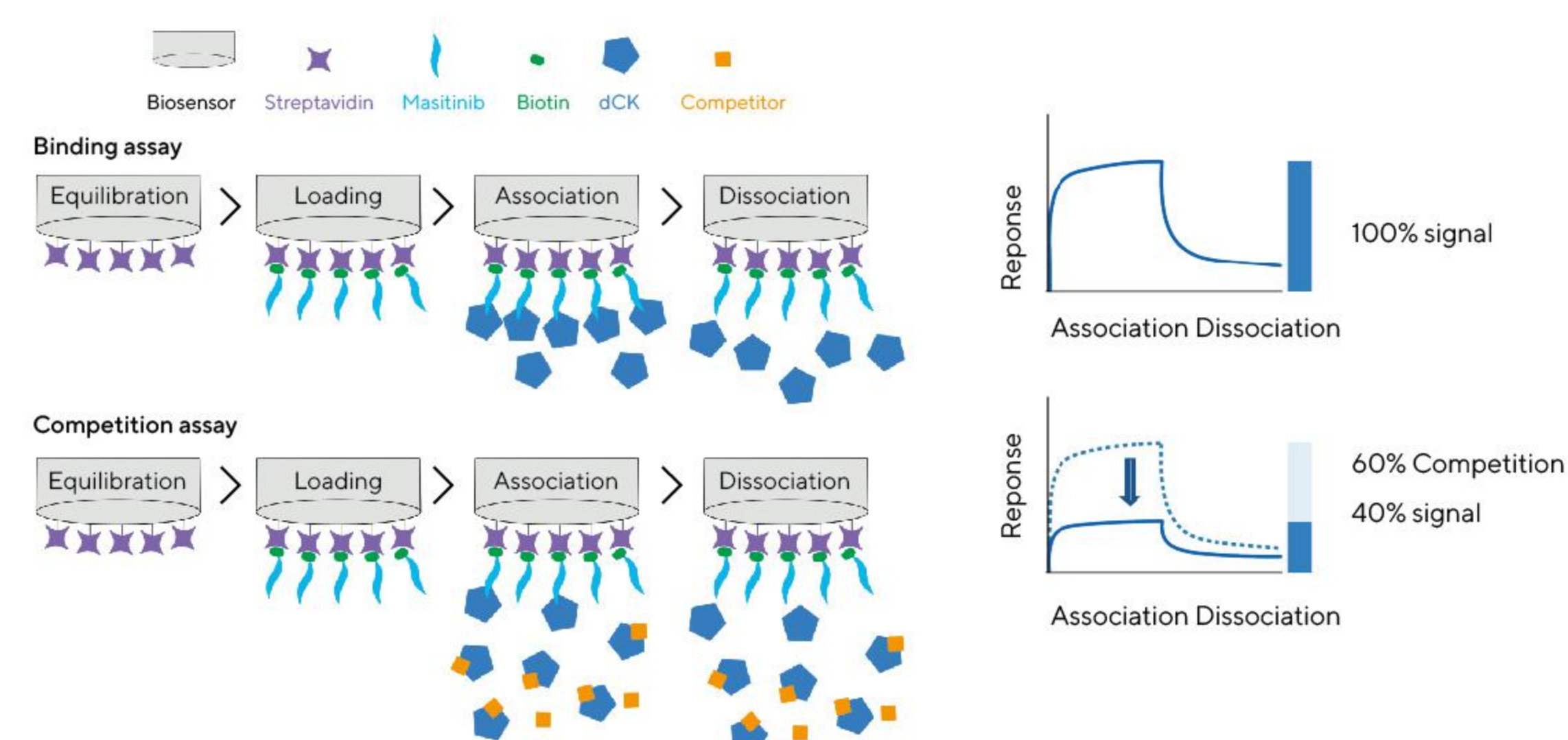
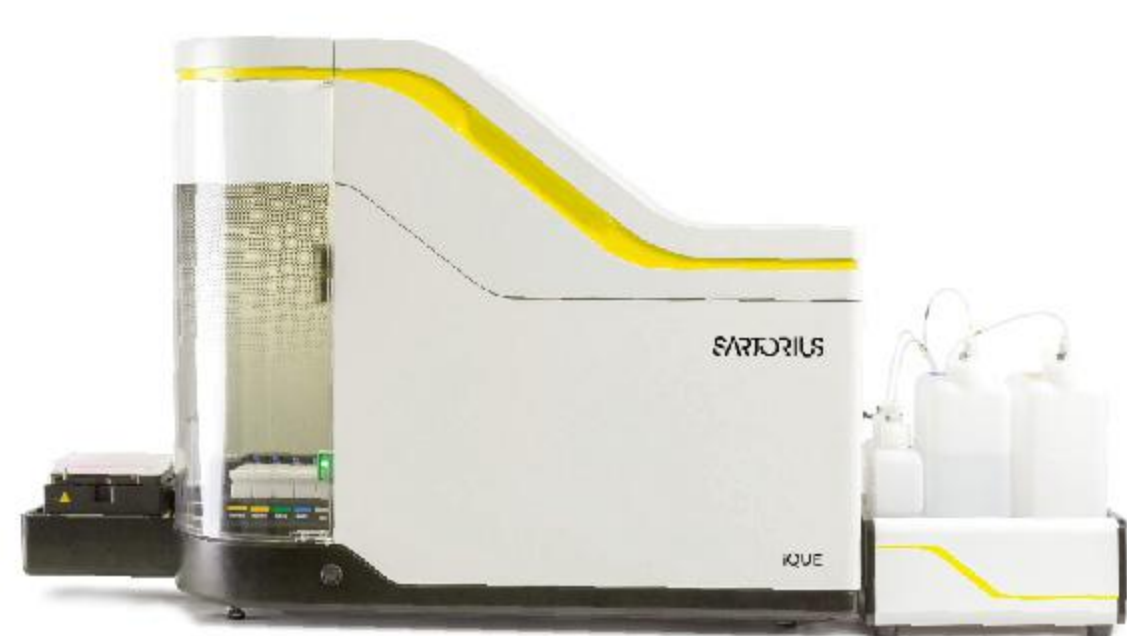


图3 竞争法实验示意图

# 化药研发、高通量筛选“三剑客”



## iQue® 高通量流式细胞仪

更快、更智能化的流式细胞术

集仪器、软件和试剂于一体,可对悬浮细胞和微球进行快速、高内涵、多重性分析。兼具快速、小体积、强大的数据分析和可视化功能,凭借独特的气泡分隔进样技术,仅需几微升样本,即可在 5min 内获取 96 孔样本的多参数数据。



## Incucyte® 活细胞分析系统

培养箱内的实时活细胞分析

灵活、便捷的实时定量活细胞成像和分析平台,通过在标准实验室培养箱中全天候自动采集和分析图像,实时自动化监测细胞的健康状态、细胞运动和细胞功能。



## Octet® 生物分子相互作用分析系统

美国药典收录的分子互作检测标准方法之一

- 高灵敏:快速准确的定量、动力学筛选及亲和力表征
- 无流路:浸入即读的检测模式,节约时间及成本
- 自动化:直观的自动化工作流程,提升效率
- 无损检测:实验样品可完全回收
- 样品宽泛:小分子至细胞等各种类型的样品均可检测
- 灵活升级:灵活通量选择,可根据需要现场升级至更高版本

# 化药关键质量属性 (CQA) 常规检测项目和方法

检测项	方法	涉及到的工具/设备
性状	理化方法	滤膜、天平、移液、纯水
鉴别	主峰保留时间 HPLC / 最大吸收波长 UV / TLC	分析样本前处理滤器、移液器/吸头、超纯水
pH 值	pH 值测定法	pH 计, 移液器/吸头, 纯水
澄清度与颜色	比浊用玻璃管 (目视)、浊度仪	移液器/吸头, 纯水
晶型	熔点	天平 (待测样品及熔点标准品称量)
含量/含量均匀度	UHPLC / HPLC	天平 (药物标准品称量)、超纯水 (配置溶液)、移液器/吸头/电子滴定管/电动助吸器、滤器 (单个或 8 联排)
限量物质	UHPLC / HPLC、LC-MS	天平 (限量物质标准品称量)、超纯水 (配置溶液)、移液器/吸头/电子滴定管/电动助吸器、滤器 (单个或 8 联排)
残留溶剂	GC	天平 (残留溶剂标准品称量)、超纯水 (配置溶液)、移液器/吸头/电子滴定管/电动助吸器、滤器 (单个或 8 联排)
水分	干燥失重、水分测定仪	水分仪
元素杂质 (USP233)	ICP、ICP-MS	天平 (元素标准品称量)、超纯水 (配置溶液)、移液器/吸头/电子滴定管/电动助吸器、滤器 (单个或 8 联排)
细菌内毒素/热原	鲎试剂 (或家兔) 测定	超纯水 (配置溶液)、移液器/吸头
不溶性微粒	灯检法或光散射检测	灯检法或光散射检测
微生物	无菌检查法	无菌放行、微生物限度、空气微生物检测
包材相容性	LC-MS / GC-MS / ICP	天平 (元素标准品称量)、超纯水 (配置溶液)、移液器/吸头/电子滴定管/电动助吸器、滤器 (单个或 8 联排)、水分仪 (水分)、pH 计

# 赛多利斯提供贯穿研发、检测、验证的产品解决方案

## 样本准备和移液解决方案



称重

- 应用:原辅料、配方过程及成品的检验,色、质、光谱工作曲线标准品的制备
- 常见需求:符合法规、再现性、可靠性
- 常见的痛点:容量选择有限;偏离目标浓度

### 产品系列

Cubis® II 高端天平  
Secura® 制药级天平

### 产品特点

- 合规(有审计追踪,符合 21 CFR Part 11、USP 39 第 41 章和 PhEur 2.1.7 等制药相关法规要求)
- 通过直接称重得到准确的结果
- 内置全自动调平,快捷简便
- 利用先进的网络通讯与 LIMS、ELN 等连接



配液

- 应用:制备 HPLC 级水,用于制备 HPLC 试剂
- 常见需求:符合法规、再现性、可靠性
- 常见的痛点:有杂质,造成鬼峰和基线不一致

Arium® Pro UV  
Arium® Mini Plus UV

- 将 TOC 水平降至痕量级别,以避免鬼峰
- 提供 ASTM I 级水,以提高分析结果的灵敏度
- 提供 IQ/OQ 服务,确保符合法规要求
- 生产高品质超纯水,以尽量减少化学离子干扰



过滤

- 应用:样品|溶剂过滤
- 常见需求:再现性、兼容性、纯度符合规定
- 常见的痛点:重复性差、时间和人力成本

Minisart® 针头滤器  
Claristep® 过滤系统

- 与 PP 和 RC 材质最大化学相容性
- 最低可浸出物和可提取物
- 低吸附分析、HPLC 批次认证
- Claristep® 可同时过滤 8 个样本,节省时间和精力,减少塑胶废物



移液

- 应用:标准样品配制和转移
- 常见需求:准确度、再现性、纯度
- 常见的痛点:再现性差、转移和采样量大

手动 Tacta®  
电动 Picus® 移液器  
Optifit/低吸附吸头

- Tacta® -手动移液,准确舒适,对难吸样本友好
- Picus® -电动移液,准确快速,人为误差小
- Safetyspace® 滤芯 吸头-延长移液器使用寿命
- Optifit 吸头-无溶出、品质如一
- 低吸附吸头-最大限度地提高样品回收率

## 微生物质量控制解决方案



空气监测

- 应用:洁净室环境空气监测
- 常见需求:准确性、再现性、法规遵从性
- 常见的痛点:培养基板在长时间的空气监测过程中会收缩,每次采样后需要消毒

MD8 Airscan® 采样仪  
Gelatin 凝胶膜

- 远距离采样、8 小时连续不间断监控
- 操作方便、延迟采样及数据存储
- GMF 凝胶膜过滤微生物截留率高



微生物限度

- 应用:微生物计数用于生物负荷和水测试
- 常见需求:准确性、再现性、法规遵从性
- 常见的痛点:不同样品之间的二次污染

Microsart® @media  
Microsart® @filter

- 无接触式膜转移降低了二次污染的风险
- 无菌换气的不锈钢支架,易于清洁和灭菌,集成模块设计
- 滤膜材质多,选择多,流速快回收率高
- NPS 培养基即取即用,保质期长



无菌检测

- 应用:无菌产品的无菌检测
- 常见需求:准确性、再现性、法规遵从性
- 常见的痛点:假阳性结果的风险、繁琐的程序

Sterisart® Universal  
泵系统和无菌套筒

- 全封闭装置,不干扰 A 级环境
- 表面光滑易清洁,耐 VHP 蒸汽灭菌
- 方便的解决方案,减少包装,易于操作
- 集成取样隔膜,在培养期间进行可靠的无菌取样

# 更多赛多利实验室通用产品

## PB-30 全自动 pH / mV 计

性价比之王, 严谨的合规性功能, 符合 GXP 实验室的使用要求。

升级的全新优雅黑外观, 流畅的机身线条, 小巧而不失大气。小身材大能量, 除测量常规类液体样品, 还有其他多种电极满足不同场景下的 PH 测量, 如极微量样品、冻状样品、肉制品等。总有一款适合你。



### 独特卖点:

- 彩色触摸屏, 易于操作
- 测量数据储存
- 校准数据自动储存
- 日志数据储存
- 电极信息存储, 确保 100% 溯源
- 多层次用户管理和密码保护, 确保数据安全性
- USB、RS232 多接口
- GLP / GMP 打印输出
- 可直接电子 Excel 数据输入
- 可连接扫描枪、U 盘

## 赛多利斯快速水分测定仪

型号齐全, 应用广泛

水分测定仪用于实验室检测和生产现场的离线检测。测量水分含量无需化学试剂定期校准。因此, 赛多利斯水分测定仪是国标烘箱法的快速替代法。



### 独特卖点:

- AURI 合金加热源, 600 瓦的高功率, 比传统红外快速水分仪的测量时间缩短一半以上
- 多任务应用, 允许用户存储 100 个不同测试方法
- “方法开发助手”可根据参考方法(国际烘箱法)快速开发测试参数
- 可靠的性能测试垫 (ReproEasy) 保证仪器结果可靠



Vivaspin<sup>®</sup> 离心过滤设备范围为 100 $\mu$ L 到 20mL, Endotest 超滤管用于去除小分子药物内毒素检测中的干扰物。



Vivaflow<sup>®</sup> 切向流膜包为实验室提供出色的超滤性能、灵活性和经济性, 最高样品处理量可达到 5L。既可用于浓缩抗体、蛋白、病毒和细胞培养上清液, 也可用于缓冲液的置换及小分子样品中内毒素的去除。



Sartolab<sup>®</sup> RF 真空过滤装置是一次性设备, 可过滤容量高达 1000mL 的样品。这种过滤装置可作为独立的系统使用, 也可以 Sartolab<sup>®</sup> Multistation 一起使用, 并行过滤多达 6 个样品。



此外还有多种膜过滤器可用于过滤高流率的水溶液。有多种直径和孔径可供选择, 用于截留颗粒物。



Sartolab<sup>®</sup> P20 压力过滤装置配有 PES 膜, 便于过滤 100ml 至 5L 具有高颗粒物负载的样品。

# 赛多利斯实验室通用产品售后服务

## 售后服务范围

- 安装和培训操作
- IQ / OQ 验证
- 仪器维修
- 校准服务
- 天平和移液器 CNAS 校准
- 易损等配件
- 预防性维护保养
- 技术和应用支持



**安装和  
操作培训**  
严格受训的  
操作人员



**延长保修**  
护航整个  
产品周期



**系统验证**  
ISO, GLP | GMP  
和 FDA 认证



**预防性维护  
和保养**  
最优化设备性能  
防止试验中断或故障



**校准服务**  
提供日常校准服务和  
ISO 校准证书



**用户培训学院**  
提供客户端、应用  
中心体验培训

## 售后服务联系方式

关注“赛多利斯售后服务”微信公众号或扫描右方二维码

邮箱 [service.cn@sartorius.com](mailto:service.cn@sartorius.com)



关注赛多利斯售后服务

## 更多信息请访问

[www.sartorius.com](http://www.sartorius.com)

赛多利斯(上海)贸易有限公司

邮箱 [lab.cn@sartorius.com](mailto:lab.cn@sartorius.com)

服务热线 400 920 9889 | 800 820 9889



关注赛多利斯实验室