

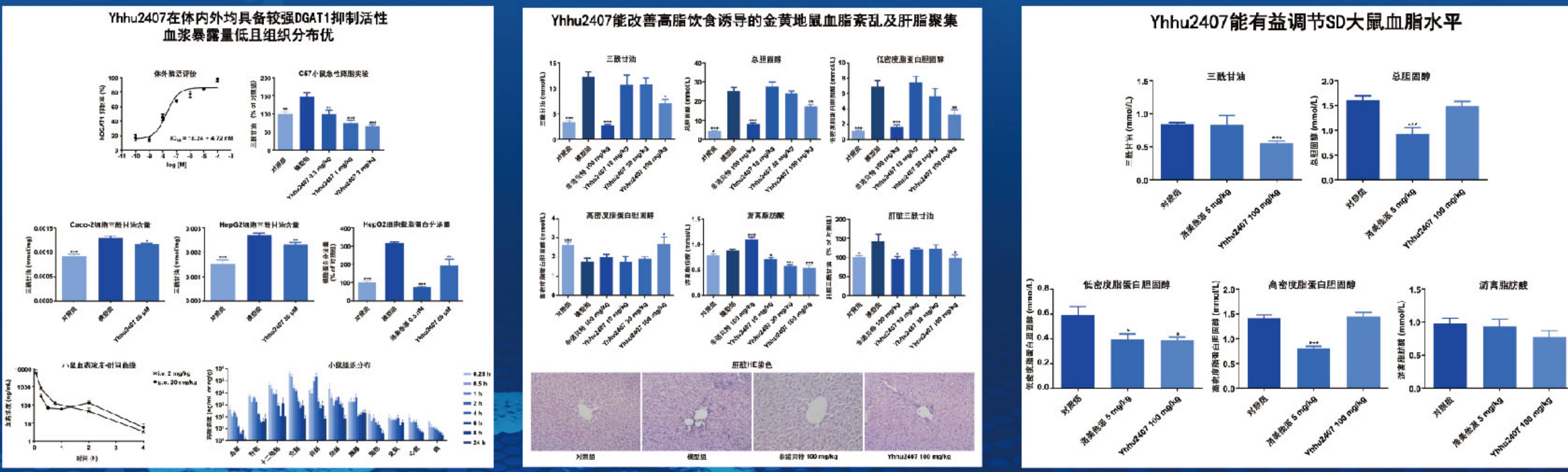
降脂候选化学I类新药 ——新型DGAT1抑制剂Yhu2407

成果完成单位

中国科学院上海药物研究所

成果简介

新型小分子DGAT1抑制剂Yhhu2407具备较强的体外hDGAT1抑制活性和体内急性降脂活性；其血浆暴露量低，组织分布与作用靶标一致，可避免潜在的毒副作用；Yhhu2407在肝细胞代谢中未表现出明显的种属差异。药效评价表明Yhhu2407可显著降低肠、肝细胞内TG堆积，抑制肝细胞的脂蛋白分泌；Yhhu2407能有益调节大鼠血脂水平，改善高脂饮食诱导的金黄地鼠血脂紊乱和肝脂浸润，整体药效优于LCQ908、洛美他派和非诺贝特。小鼠急毒实验 ($LD_{50} > 5\text{g/kg}$) 和大鼠亚急毒评价 ($NOAEL \geq 900\text{mg/kg}$) 均证实Yhhu2407安全性较好。Yhhu2407现已完成实验室百克级合成并获得中国发明专利授权，其具有良好的深入研究价值和广阔的市场应用前景，有望成为我国具有自主知识产权的基于全新靶标的治疗高脂血症等代谢性疾病的一类新药，具有相当的国际竞争力，有望填补国内空白，市场竞争强，市场前景巨大，将带来良好的社会与经济效益。



医用介入式磁导航系统

成果完成单位 中国科学院电工研究所

成果简介

本成果是一种用于消化道疾病诊疗的轻量化高精度磁导航系统。通过快速的实时磁场求解和导航控制算法实现空间合成磁场大小、方向和梯度动态可控，结合定位系统和一次性内窥镜成像系统，实现内窥镜对消化道的检查，技术水平已达到国际先进水平。

我国是消化道疾病大国，消化系统疾病发病率排第三，其中胃肠道疾病发病率占人口总数20%左右，小肠疾病发病率占胃肠道疾病的1%~4%，即全国发病人群约为280万-1100万人。由于缺乏早期大范围肠道检测条件，绝大多数消化道癌症因为发现不及时而最终导致难以治愈。早期的消化道筛查和诊断对于预防癌症和及时获得治疗非常重要。现有的检查方式存在交叉感染、疾病检出率低、损伤大、效率低缺点，这严重制约了临床诊断。因此，发展新型强磁介入磁导航内窥镜技术，克服传统内窥镜检查缺点，可以显著提高我国消化道疾病的筛查率并提高消化道癌症治愈率，有效缓解民生痛点，造福国计民生。



跳蚤草驱蚊止痒产品 (驱蚊喷雾水和驱蚊止痒膏)

成果完成单位

中科院昆明植物研究所、中科院西双版纳热带植物园

成果简介

痒比疼更难过，但被蚊虫叮咬后，痒和疼一起发作，更让人难以忍受，健康安全的植物源驱蚊消包止痒产品成为了人们的渴望。研究团队利用民族植物学、药物学和植物化学的研究方法与手段，通过30余年对哈尼族传统验方的研究，验证了跳蚤草的驱蚊止痒活性及其活性物质基础，为开发安全有效的天然驱蚊产品及外用抗皮肤过敏药物提供数据与支撑。通过人手涂肤蚊笼实验（蚊子喂养和驱蚊活性评价），结果表明跳蚤草精油优于香茅精油的效果。目前已研制出驱蚊喷雾水和驱蚊止痒膏，注册了跳蚤草商标，备案了消字号产品。市场销售额可达5000万元/年。

授权专利：(1) 毛麝香醚及其组合物、制备方法和用途，专利号ZL201811441879.8。 (2) 香芹酚类似物在驱蚊产品中的应用，专利号ZL201811441888.7。



一种肠溶药用辅料 及其制备方法和应用

成果完成单位

中国科学院微生物研究所

成果简介

当前我国肠溶制剂面临这样的现状：一边是肠溶制剂市场广大，一边是肠溶药用辅料种类偏少。国家“十二五”重大科技专项首次把新型药用辅料开发的关键技术列入研究课题。到目前，只有聚丙烯酸树脂等已被批准为肠溶药用辅料。

“需求牵引，突破瓶颈”，肠溶型普鲁兰多糖作为普鲁兰多糖的衍生物，是一种全新的高分子化合物，具有自主知识产权（专利号：CN201610478887.4），对解决目前肠溶制剂市场肠溶辅料偏少的境况做出了一定的努力。也有助于老药新剂型的开发，提高药物的注册等级。

在中国，降“三高”的肠溶制剂、血管溶栓制剂、调节肠道微生态的肠溶制剂具有庞大的适用人群基数。据网络资料统计：2009年，勃林格殷格翰公司的aggrenox（复方阿司匹林）的市场销售额达到5.55亿美元。桉柠蒎肠溶胶囊是北京九和药业上市的国内独家品种，商品名“切诺”，2016年国内重点城市公立医院桉柠蒎市场为1.37亿元，桉柠蒎已进入多省市医保，预测总体市场销售额按零售价超过10亿元。2017年，新华制药大制剂战略传捷报，舒泰得（雷贝拉唑钠肠溶片）销售额突破1亿元。无论大品种还是小品种，肠溶制剂都有可观的市场规模。由此可见，中国的肠溶制剂市场规模庞大，开发新型肠溶辅料具有明确的市场前景。

