

# 以可受引信控制的智能多肽微脂體

## 本院覽號

03A-1060922

## 公告日期

## 智財權狀態

美國臨時案已申請、台灣(發明)I 770396已獲證、中國已申請、美國US 11,266,603 B2已獲證、美國US 11,771,651 B2已獲證

## 摘要

此發明摒棄有潛在毒性的非天然脂肪，採智能多肽交聯於微脂體表面，使微脂體可在特定訊號中，被啟動及加速釋放藥物。之前此類多肽微脂體設計概念一直無法成功，在於合適的智能破膜多肽序列並未被發現。此發明徹底解決此項問題，使得多肽交聯產生功能性微脂體變得可行。

## 技術優勢

現有的引信響應微脂體，僅文獻有報導而無轉譯醫療案例，多因使用非天然脂肪而有毒性疑慮，而極少數利用多肽的引信響應微脂體，也需要劇烈的酸鹼值變化，以改變多肽構型進而破膜，較無臨床應用可能。至於其他的報導都是多肽一但交聯微脂體即會使微脂體不穩定。本技術包含可控制的破膜多肽序列，使得微脂體可供各類引信訊號控制，解決多肽微脂體不穩定的問題，並且可暫時完全壓抑破膜活性，並可以客製化將各類引信訊號轉化成微脂體破膜訊號。

## 應用範圍

目前微脂體藥物面臨的問題為其藥物釋放速度及生物分布位置控制。導向微脂體也只是增加細胞微脂體親合度，以增加內吞促進藥物釋放，根本問題還是需要微脂體在對的地點大量釋放藥物。本技術之智能破膜多肽為可受控制的破膜多肽序列，透過疾病相關的酵素催化而釋放，提供在空間與時間上的精確度。觸發釋放的微脂體可用於(1)核磁造影的顯影劑釋放，在疾病所分泌之特異酵素的區域才會釋放，進而提供疾病在身體中的位置資訊，可應用於疾病診斷的全身影像檢驗工具可降低藥物於全身的毒性，(2)可用於釋放化療藥物，增加療效並降低毒性。

## 創作人

李賢明



中央研究院  
ACADEMIA SINICA