

具抗凝血活性的肝素五醣體及其中間體之新製程研發

本院覽號

28A-1010214

公告日期

智財權狀態

美國臨時案已申請、PCT已申請、台灣(發明)I596106已獲證、美國US 9,822,140 B2已獲證、中國ZL 2013 8 0029680.3已獲證、印度已申請

摘要

Fondaparinux為一抗凝血藥物，近年來已被醫師廣泛使用。洪上程博士實驗室成功開發Fondaparinux及其相關中間體的新製程，以市售便宜的葡萄糖及葡萄胺糖為起始物，只需28項合成步驟就可得到目標產物，且能有效控制所有醣苷鍵形成的立體位向，整個製程遠少於目前發已表於美國專利7,541,445中所描述的方法，此外，這條簡易途徑亦可減少煩瑣的純化、提升總產率及降低成本。

技術優勢

本發明運用本實驗室已發展之「醣一鍋化位向保護方法」，可有效安裝互不干擾之永久保護基和暫時性保護基，縮短單醣建構單元的製備步驟及減少煩瑣的純化過程，不但產率提高且可將量放大。本發明應用本實驗室已開發之L式艾杜醣製程，大幅縮短合成步驟。本發明應用共同中間體的概念，以單一途徑製備三個所需的葡萄胺醣建構單元，合成步驟精簡。本發明可有效控制所有醣苷鍵形成的立體位向，避免異構物的產生，減低純化的困難。本發明採用不同於已往的方法，可快速建立五醣骨架。本發明只需28項合成步驟，是GSK製程的一半，成本降低且總產率提高許多，深具市場競爭力。

應用範圍

醣化學、有機化學、藥物化學

創作人

洪上程



中央研究院
ACADEMIA SINICA