

# 肝素/硫酸乙醯肝素八醣體分子庫，結構與製備方法及用途

## 本院覽號

28A-1051202

## 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)I689309已獲證、美國US 11,141,428 B2已獲證、歐盟已申請、中國已申請

## 摘要

本發明描述肝素/硫酸乙醯肝素八醣體分子庫以及與其相關之新開發的中間體的結構、製備方式及用途。於本發明中，由市售的、便宜的起始物能快速、有效的合成需要的八醣體骨架，再經由保護基與官能基的轉換、調控，可以高效率的生成多樣性之肝素/硫酸乙醯肝素八醣體分子用以進行生物活性測試或醣晶片之製備。

## 技術優勢

1. 本發明運用一鍋化製程以及選擇互不干擾之永久保護基與暫時性保護基，進而縮短合成步驟亦提高產率並且使其適於大量製備之用。
2. 本發明應用本實驗室自行開發之製備L式艾杜醣衍伸物之製程，大幅縮短合成步驟並能得到高產率的L式艾杜醣建構單元。
3. 於本發明中，暫時性的保護基在進行醣鏈結反應之前能獨立的被移除而不影響其餘的保護基，此外其它各類的保護基也能在特定的時間點選擇性的移除而進行官能基的轉換，而其餘的保護基則能在最後利用氫化反應全部移除，藉由保護基轉換的順序調控，同一骨架能製備出數個不同的八醣體分子，此種合成策略使整個分子庫的建立更為快速、有效。

## 應用範圍

本發明所開發之製程能有效的減少合成肝素/硫酸乙醯肝素八醣體分子所需之步驟，且開發之方法亦適合於大量生產製造之使用，對日後其他多醣體的研發提供相當之參考價值，而目前經由分子庫的建立也已經發現數個八醣體分子在神經再生以及阿茲海默症方面有良好的表現，後續發展可期。

## 創作人

洪上程、柯彥均、蔡政芳



中央研究院  
ACADEMIA SINICA