

瑞德西韋及其中間體之高立體選擇性合成方法

本院覽號

28A-1090814

公告日期

2020-02-09

智財權狀態

美國臨時案已申請、台灣(發明)I830071已獲證、PCT已申請、美國已申請、歐盟已申請

摘要

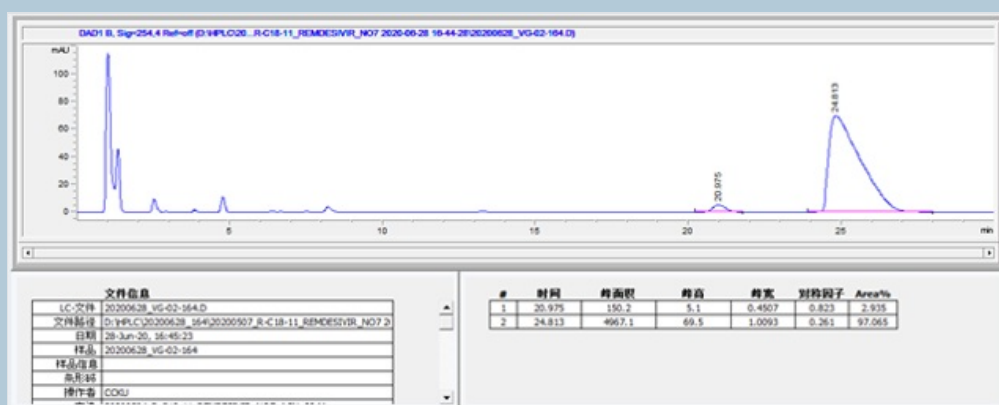
瑞德西韋是一種具有高度細胞通透性的廣效核苷酸抗病毒藥物，其對於SARS、MERS以及SARS-CoV-2的治療方面表現出極高的潛力。瑞德西韋最初由Gilead Sciences公司研發，其合成策略存在選擇性及產率不佳等問題，增加了瑞德西韋在量化生產及純化分離上的困難，成本也相對提高很多。本發明以催化方式進行高立體選擇性和高產率的磷醯胺化反應，搭配產率改良的去保護條件，適合量化生產瑞德西韋及其中間體。

技術優勢

- 高選擇性且高產率的磷醯化反應。
- 為一種有機催化劑，無金屬殘留問題。
- 適合工業大量生產使用。

應用範圍

- 瑞德西韋及其中間體的量化生產。
- 其它磷醯化藥物的合成。



利用HPLC方法檢測出合成的立體異構物的比例。

創作人

洪上程、翁啟惠、Veeranjaneyulu Gannedi、Bharath Kumar Villuri、Nimmakayala Sivakumar Reddy、顧巧珠



中央研究院
ACADEMIA SINICA