用以治療骨關節炎的化合物及方法

本院覽號	公告日期	智財權狀態
28A-1090420	2021-02-07	US、TW、JP

摘要

本發明揭示一種內氧硫酸酯酶1(endo-O-sulfatase 1, Sulf-1)的受質及/或抑制劑。該抑制劑可作為辨認及治療一患有或可能患有骨關節炎之個體的方法。該方法包含步驟(a)將該個體之尿液樣本與4-甲基傘形硫酸酯(4-methylumbelliferyl sulfate, 4-MUS)及通式(I)或(II)的Sulf-1抑制劑混合，以形成一混合物；(b)確定步驟(a)之混合物螢光強度；以及(c)當經步驟(b)確定的螢光強度小於控制組樣本的螢光強度時，以止痛劑、非固醇類抗發炎藥物(NSAID)或皮質類固醇治療該個體，其中該控制組樣本係為該尿液樣本與4-MUS的混合。

技術優勢

- 採非侵入式取得檢驗檢體。
- 針對軟骨基質之早期變化偵測，對於退化性關節炎病程有其高之正相關靈敏度。
- 不需要放射性照射，傳統檢驗方式需要透過X-ray放射性照射才能取得影像。
- 醣分子新配方比“維骨力”成分配方更促進軟骨細胞分泌軟骨特有胞外基質。
- 人類硫酸酯酶之抑制劑具有良好的抑制效果。

應用範圍

- 退化性關節炎程度檢查
- 關節軟骨之保健效果評估
- 退化性關節炎之治療評估
- 退化性關節炎之小動物實驗模型

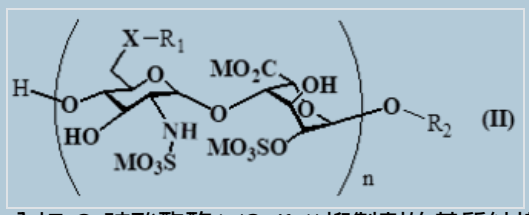

圖1.內切-O-硫酸酯酶1 (Sulf-1)抑製劑的基質結構。

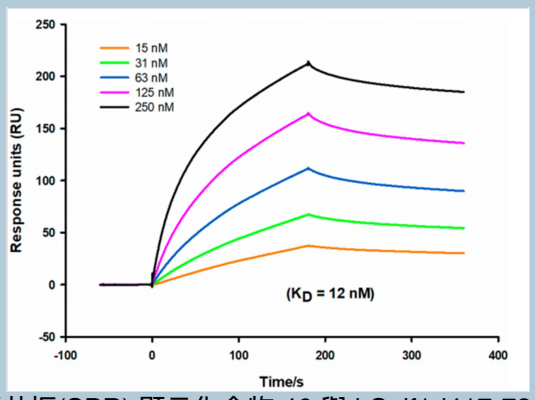

圖2.通過表面電漿共振(SPR) 顯示化合物 46 與 hSulf1d417-726 的結合動力學。

創作人

洪上程、翁啟惠、鄭婷仁

中央研究院 ACADEMIA SINICA 中研®