



연구 책임자



성 명 ▶ 이병호 교수

소 속 ▶ 한국화학연구원 신약기반기술연구센터

주요연구 ▶ 신약개발/약리학

기술 정보

■ 기술명 N-(피페리딘-4-일)벤조[b]사이오펜카복시아마이드 유도체, 이의 제조방법 및 이를 유효성분으로 포함하는 유로텐신-II 수용체 활성 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물

■ 출원번호 KR10-2014-0042228(2014.04.09)

■ 등록번호 10-1571522(2015.11.18)

기술 성숙도 (TRL)



기술 내용

• N-(피페리딘-4-일)벤조[b]사이오펜카복시아마이드 유도체의 유로텐신-II 수용체에 대한 결합 억제 활성을 확인하기 위하여 자동여과법 기반 시차성형광 분석법으로 실험을 수행함

• 시차성 형광(TRF)값을 다기능 형광 측정기를 이용하여 측정하였으며(방출파장 : 615nm, 여기파장 : 340nm), 시차성 형광 억제율을 계산함

$$\text{시차성형광억제율} = \frac{\text{전체결합평균값} - \text{시험물질의시차성형광값}}{\text{전체결합평균값} - \text{비특이적결합평균값}} \times 100$$

• → 본 발명에 따라 시차성 형광 억제율을 측정 후 50% 이상 억제된 시험물질에 한하여 IC₅₀ 값을 계산한 결과, 본 발명의 모든 화합물이 낮은 농도에서 유로텐신-II 수용체에 대해 길항작용 하는 것을 확인하였고 이는 유로텐신-II 수용체 활성 관련 질환을 예방 또는 치료하는데 사용할 수 있음

<시차성 형광 억제율이 50% 억제된 시험물질에 대한 IC₅₀값 결과>

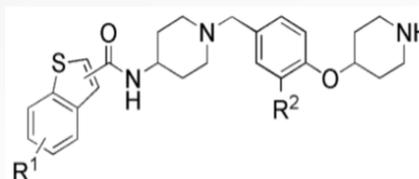
실시예	IC ₅₀ (nM)	실시예	IC ₅₀ (nM)
1	63	24	56
2	55	25	220
3	66	26	90
4	130	27	79
5	90	28	560
6	65	29	77
7	80	30	61
8	53	31	87
9	51	32	79
10	86	33	140
11	74	34	49
12	180	35	30 % (a)
13	100	36	74
14	25	37	140
15	100	38	310
16	49	39	330
17	100	40	160
18	49	41	110
19	63	42	190
20	59	43	69
21	230	44	140
22	92	45	330
23	120		

기술 차별성

• 유로텐신-II는 시스테인 결합된 사이클릭 펩타이드로서, 엔도테린-1보다 10배 이상 강한 현재까지 알려진 가장 강력한 혈관수축제로 알려져 있으며, 사람에서의 11개의 아미노산으로부터 14개의 아미노산으로 구성되어 있음

• 유로텐신-II의 생리학적 활성은 유로텐신-II 수용체의 활성화를 통해 매개되며 7개 도메인 막통과 수용체로서 G-단백질 커플링 수용체(GPCR)인 고아 수용체 GPR14가 유로텐신-II 수용체로 확인되었음

• 본 발명에서 유로텐신-II 수용체에 길항효과를 나타내는 화합물을 개발하기 위해 노력하던 중 특정 구조의 N-(피페리딘-4-일) 벤조[b] 사이오펜카복시아마이드 유도체가 유로텐신-II 수용체의 길항제로 작용함으로써 수용체 과활성에 의한 질환의 예방 및 치료제로 사용될 수 있음



<N-(피페리딘-4-일)벤조[b] 사이오펜카복시아마이드 유도체>

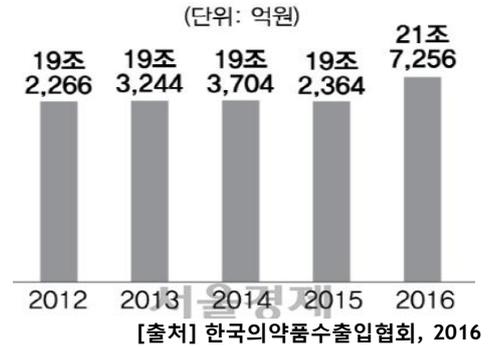
시장 현황

- 세계 의약품 시장은 2016년 8120억 달러에서 2022년 1조 1640억달러까지 성장할 것으로 전망하였으며 일상적인 질환이나 표준치료에 효과를 보이는 합성 의약품도 바이오 의약품에 비해 급격한 성장세는 보이지 않지만, 꾸준한 성장세를 보이고 있는 추세임
- 2016년 의약품 시장 규모가 21조 7,256억원으로 1년전 19조 2,364억원에 비해 12.9%나 증가하였고, 국내 기업의 의약품 수출은 지난 5년간 50% 넘게 성장하였으며, 지속적으로 증가할 추세이며 특히, 원료 의약품 생산이 2조4,932억원으로 지난해 보다 18% 증가하였음

<글로벌 의약품 시장 현황 및 전망>



<연도별 국내 의약품 시장 규모 현황>



기술응용분야

- 합성 의약품 분야



지재권 현황

1	특허명	아릴피페리딘가-함유이미다졸유도체의 제조방법 및 이를 유효성분으로 포함하는 약학적 조성물		
	출원번호	10-2007-0046077 / 10-0871077	출원일	2007.05.11 / 2008.11.24
2	특허명	신규한 피롤로피리디논 유도체 및 그의 MCH 수용체-1 관련 질환에 대한 치료학적 용도		
	특허번호	10-2011-0021396 / 10-1236188	출원일	2011.03.10 / 2013.02.18
3	특허명	1,3,4-싸이아다디아졸-2-아민 유도체, 이의 제조방법 및 이를 유효성분으로 포함하는 유로텐신-2 수용체 활성화 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물		
	특허번호	10-2015-0047057 / 10-1667563	출원일(등록일)	2015.04.02 / 2016.10.13

문의처



한국화학연구원 담당자

소 속: 한국화학연구원 연구전략본부
 성 명: 최경선 선임연구원
 연락처: 042) 860-7076
 이메일: chanian@kRICT.re.kr



기술이전 컨설팅 담당자

소 속: 위노베이션(주)
 성 명: 임한홍 변리사
 연락처: 02) 599-3420
 이메일: info@wennovation.co.kr