

연구 책임자



성 명 ▶ 이광호 교수

소 속 ▶ 한국화학연구원

주요연구 ▶ 의약화학 및 유기합성

Sales Material Kit



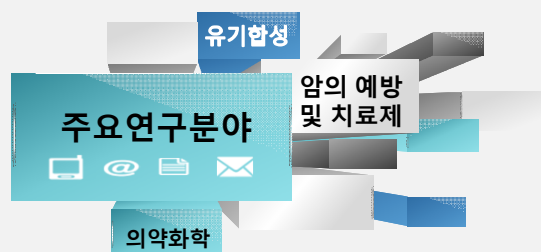
기술 정보

■ 기술명 4-(1-퍼롤-3,4-디카르복시아미드)피리미딘 유도체, 이의 제조방법 및 이를 유효성분으로 함유하는 암의 예방 또는 치료용 약학적 조성물

■ 출원번호 KR10-2014-0135844(2014.10.08)

■ 등록번호 10-1633722(2016.06.21)

기술 성숙도 (TRL)



기술 내용

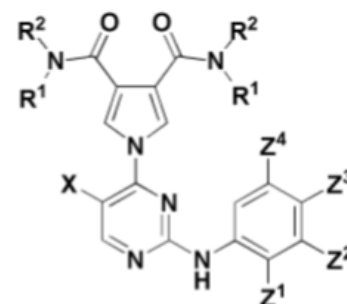
- 역형성 림프종 키나아제(ALK)에 대한 저해활성을 측정하기 위하여 96 well plate에 제조된 화합물(2μl)을 가하고 역형성 림프종 키나아제(ALK) 효소(1μl) 및 역형성 림프종 키나아제(ALK) 효소를 포함하고 있는 비소페암세포 H3122 CP를 각각 바이오틴이 붙은 펩타이드 기질(2μl)을 15분 동안 혼합하여 배양함
 - 에틸렌다이아민 테트라아세트산 용액에 녹은 스트렙트아비딘이 붙은 엑스엘(XL 665) (5μl)와 Eu³⁺가 붙은 항-포스포타이로신 항체(5μl)를 반응액에 첨가하여 반응을 중지시키고 1시간 동안 배양 후 시간분해형광도(HTRF)로 분석
- 본 발명에 따라 제조된 화합물은 낮은농도에서도 역형성 림프종 키나아제(ALK) 효소활성을 74% 억제하며, 비소페암세포인 H3122 CP의 세포활성을 50%감소(IC₅₀)시킴

<4-(1-퍼롤-3,4-디카르복시아미드)피리미딘 유도체의 역형성 림프종 키나아제(ALK) 억제 활성 결과>

실시예	ALK wt. %inh @ 10 μM	실시예	H3122 CP IC ₅₀ (μM)
1	8.1	1	>10
2	29	2	3.2
3	0	3	>10
4	29	4	4.4
5	14	5	>10
6	32	6	5.2
7	0	7	>10
8	74	8	>10
9	4.4	9	>10
10	17	10	>10
11	10	11	2.3
12	47	12	>10

기술 차별성

- 기존 암 치료를 위한 화학요법제의 가장 큰 문제는 세포 독성으로 인한 부작용과 약제 내성으로써, 항암제에 의한 초기의 성공적인 반응에도 불구하고 결국에는 치료가 실패하게 되는 주요 요인임
- 최근에는 역형성 림프종 키나아제(ALK)가 인체 여러 종양에서 발견되어 표적치료의 목표물로 연구되고 있는데 이때, 비정상적으로 역형성 림프종 키나아제(ALK)는 세포의 증식을 유도하고 Apoptosis를 방해해 세포가 사멸되지 않게 하며 세포 뼈대를 재배열 시키며 세포 형태를 변형시킴
- 본 발명에서 역형성 림프종 키나아제(ALK) 활성억제 효과를 나타내는 화합물을 개발하기 위해, 4-(1-퍼롤-3,4-디카르복시아미드)피리미딘 유도체, 이의 광학이성질체, 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염이 역형성 림프종 키나아제(ALK)의 활성 억제제로 작용하여 암 예방 및 치료제로 사용될 수 있음

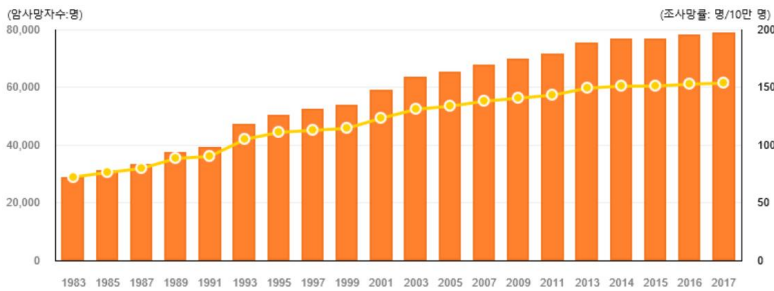


<4-(1-퍼롤-3,4-디카르복시아미드)피리미딘 유도체>

시장 현황

- 국내 암 발생률 추이는 암의 종류의 구분하지 않고 지속적으로 증가추세를 보이고 있는 반면, 암으로 인한 사망률도 인구 10만명당 사망자수로 점차 증가하고 있는 추세임 ('07년 : 137.5명 → '17년 : 153.9명)

<세계 암 발생률 및 사망률>



[출처] 보건복지부, 2019

- 글로벌 항암시장은 2013년 기준 약770억 달러에서 2021년 약 1,270억 달러 규모로 연평균 약 6.4% 성장할 것으로 예상되는 가운데, 동반진단 시장은 2013년 약 20억 달러에서 2021년 110억 달러 규모로 약 23.8% 성장할 것으로 예상됨

<글로벌 항암 시장 및 동반 진단 전망>
글로벌 항암시장 및 동반진단 시장 규모 (단위: 십억달러)



[출처] IMS Health MIDA 2016

기술응용분야

- 항암 치료제 분야



지재권 현황

1	특 허 명	피롤리딘 카복스아미도 유도체 및 이의 제조 방법 및 용도		
	출원번호	10-2017-7028207 / 10-1963559	출원일	2016.07.08 / 2019.03.23
2	특 허 명	[1,2,4]트리아졸로[4,3-a]퀴놀리딘아미노페닐 유도체 또는 이의 약학적으로 허용 가능한 염 이의 제조 방법 및 이를 유효성분으로 포함하는 BET 단백질 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물		
	특허번호	10-2017-0035176	출원일(등록일)	2017.03.21
3	특 허 명	신규한 [1,2,4]트리아졸로[4,3-a]퀴놀리딘 유도체, 이의 제조 방법 및 이를 유효성분으로 함유하는 BET 단백질 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물		
	특허번호	10-2018-0009190	출원일(등록일)	2018.01.25.

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