



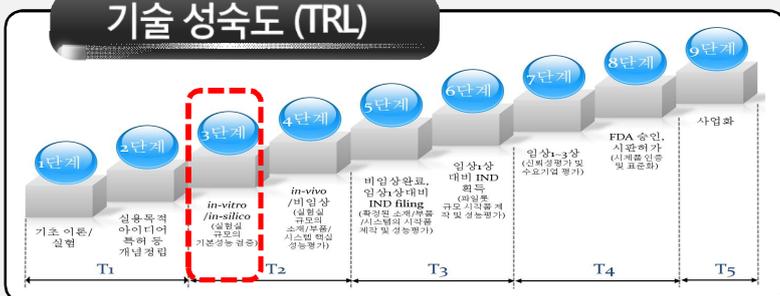
연구 책임자

- 성 명 ▶ 임희종 교수
 소 속 ▶ 한국화학연구원 친환경신물질연구센터
 주요연구 ▶ 신경퇴행성 질환의 예방 및 치료

기술 정보

- 기술명** 베타-세크리테아제활성을억제하는4(아릴유레이도)피롤리딘유도체및이를유효성분으로함유하는억제학적 조성물
- 기술개요** 억제하는 4-(아릴유레이도)피롤리딘 유도체는 베타-세크리테아제(BACE)의 활성을 억제하여 신경세포를 손상시키는 베타-아밀로이드 단백질의 생성을 억제함
- 출원번호** KR10-2013-0165453(2013.12.27) **등록번호** 10-1569341(2015.11.10)

기술 성숙도 (TRL)



기술 내용

- 4-(아릴유레이도)피롤리딘 유도체에 의한 베타-세크리테아제 활성 억제 효과 확인
- BACE1 기질 용액에 원하는 농도의 시험 약물 10 μ l를 가하고 가 법계 혼합한 다음, 정제된 바클로비루스에서 발현된 BACE1 효소 용액 10 μ l를 첨가하여 반응을 유도한 후 실온에서 60분간 배양 하였음
- 배양완료 후 즉시 반응액에 10 μ l의 종결용액을 가하여 반응을 정지시킨 후 FlexStation을 이용하여 545nm 및 585nm에서 그 형광을 측정하여 효소 활성도를 측정함

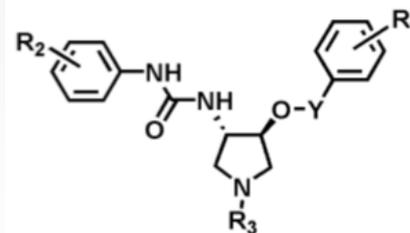
→ 본 발명에 따라 4-(아릴유레이도)피롤리딘 유도체는 BACE 활성을 저해하는 효능이 뛰어난 것으로 판단됨

<4-(아릴유레이도) 피롤리딘 유도체에 의한 베타-세크리테아제 활성억제 효과>

화합물 번호	BACE Inhibition Assay (IC ₅₀ = μ M)	화합물 번호	BACE Inhibition Assay (IC ₅₀ = μ M)
화합물 101	0.91	화합물 129	1.20
화합물 102	1.52	화합물 130	0.85
화합물 103	0.68	화합물 132	3.00
화합물 104	0.40	화합물 133	1.25
화합물 110	3.01	화합물 136	9.00
화합물 113	3.78	화합물 137	3.30
화합물 116	1.83	화합물 138	1.50
화합물 119	1.11	화합물 140	1.29
화합물 120	4.98	화합물 141	1.32
화합물 123	9.00	화합물 142	1.01
화합물 125	10.00	화합물 143	1.12
화합물 126	2.14	화합물 144	4.70

기술 차별성

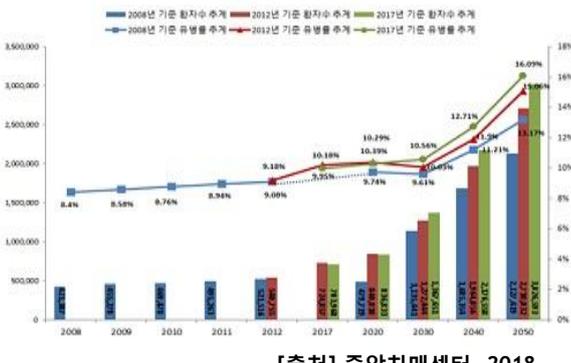
- BACE, ASP 또는 메맘신(Memapsin)으로도 명명되고 있는 베타-세크리테아제 효소의 활성을 억제하는 저해제는 알츠하이머 질환의 예방 및 근본적인 발병원인이나 증상을 치료할 수 있는 약물로 사용 가능함
- 그러나, 현재까지 피롤리딘 골격을 가지면서 베타-세크리테아제의 활성을 저해하는 능력이 뛰어난 베타-세크리테아제 저해제를 개발하였다는 보고는 없음
- 본 발명에서 4-(아릴유레이도)피롤리딘 유도체 또는 이의 억제학적으로 허용 가능한 염, 이를 유효성분으로 함유하는 신경퇴행성 질환의 예방 및 치료용 억제학적 조성물 및 이를 유효성분으로 함유하는 베타-세크리테아제(BACE)의 활성 억제제 조성물을 개발함



<4-(아릴유레이도)피롤리딘 유도체>

시장 현황

<전국 알츠하이머 환자 수 통계>



[출처] 중앙치매센터, 2018

- 전국 치매역학조사의 유병률 결과에 따르면, 2018년 기준 60세 이상 노인의 치매유병률은 7.2%(환자수 77만명), 65세 이상 노인의 치매 유병률은 10.2%(환자수 75만명)으로 추정되며 알츠하이머의 비율이 점차 증가하고 있는 추세임

- 전 세계 알츠하이머 치료제 시장규모는 2018년 2,830백만불에 달할 것으로 예상되며, 고령화 사회로 인한 매년 치료제 시장규모는 점차 증가하여 2018년 기준으로 5년 후 2023년에는 8,873백만불에 달할 것으로 예상됨

<알츠하이머 치료제 글로벌 시장규모 및 전망>



구분	2015	2016	2017	2018	2019	2020	2021	2022	2023	2024
시장규모(백만불)	3,111	2,655	2,623	2,683	2,830	2,903	3,791	5,819	8,873	12,612

[출처] Datamonior Healthcare, 2016

기술응용분야

- 알츠하이머 치료제 분야



지재권 현황

1	특허명	프로토베르베린 유도체 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염을 유효성분으로 함유하는 NFAT5의 활성 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물		
	출원번호	10-2013-0168603 / 10-1603279	출원일	2013.12.31 / 2016.03.08
2	특허명	피리미도 옥사진 유도체 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염, 이의 제조방법 및 이를 유효성분으로 포함하는 P13 키나아제 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물		
	특허번호	10-2015-0183563 / 10-1767260	출원일(등록일)	2015.12.22 / 2017.08.04
3	특허명	코로나 바이러스 감염으로 인한 질환 치료용 화합물		
	특허번호	10-2017-0035178 / 10-1913789	출원일(등록일)	2017.03.21 / 2018.10.25

문의처



한국화학연구원 담당자

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



기술이전 컨설팅 담당자

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