



## 연구 책임자

성 명 ▶ 이계형 박사

소 속 ▶ 한국화학연구원

주요연구 ▶ 화학융합소재, 고분자소재

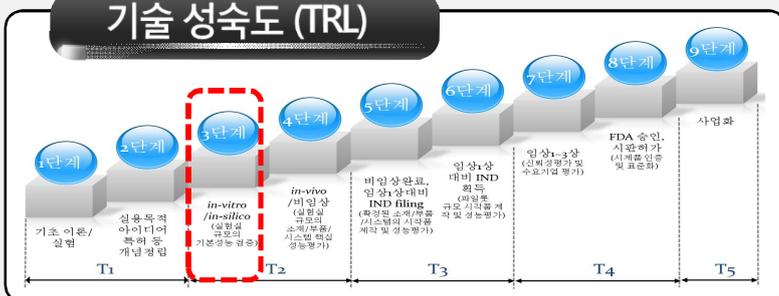
## 기술 정보

■ **기술명** 피리미도 옥사진 유도체 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염, 이의 제조방법 및 이를 유효성분으로 포함하는 PI3 키나아제 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물

■ **출원번호** KR10-2015-0183563(2015.12.22)

■ **등록번호** 10-1767260 (2017.08.04)

## 기술 성숙도 (TRL)



## 기술 내용

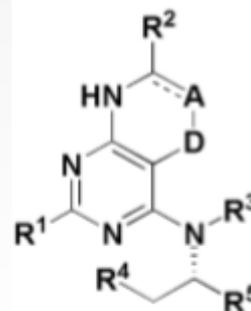
- 포스파티딜이노시톨 3-키나아제 알파, 베타, 감마, 델타에 대한 억제활성을 검증하기 위하여 실험을 수행함
- 모든 화합물은 ATP=10 $\mu$ M, 샘플 농도=100nM에서 효소의 저해를 측정하였으며, 세포내의 PI3K 알파, 베타, 감마, 델타의 세포내 활성을 증가시킬 수 있는 IgM을 처리한 후 활성 정도를 평가함
- → 실시예 1-9 화합물이 PI3K 키나아제 알파, 베타, 감마, 델타에 대해 우수하게 억제 활성을 나타내며 특히, PI3 키나아제 감마 또는 델타에 대해 매우 낮은 값에서 억제 활성을 나타낸 것을 확인하였으며, 이는 PI3 키나아제 관련 질환을 예방 또는 치료하는데 유용하게 사용됨

<포스파티딜이노시톨 3-키나아제 알파, 베타, 감마 및 델타에 대한 억제 활성 검증 결과>

실시예	PI3 Kinase (p110 $\alpha$ /p85 $\alpha$ )(h)	PI3 Kinase (p110 $\beta$ /p85 $\alpha$ )(h)	PI3 Kinase (p120 $\gamma$ )(h)	PI3 Kinase (p110 $\delta$ /p85 $\alpha$ )(h)
1	+	+	+	+
2	+	+	++	++
3	+	+	++	+++
4	+	+	++	++
5	+	+	+	+
6	+	+	+	+
7	+	+	++	+++
8	+	+	+	+
9	+	+	+	++

## 기술 차별성

- 인간세포 및 조직에서의 PI3K 각각의 발현 패턴이 전혀 다르며, PI3K 알파 및 베타는 광범위한 조직 분포를 갖는 반면, PI3K 감마는 주로 백혈구에서 발현되나, 근육, 간, 췌장 및 심장에서도 발견되고, 델타는 이자, 흉선 및 말초혈액백혈구에서만 발현됨
- 최근 PI3K가 폐 및 귀의 감염에 관여하는 것을 밝혔으나 기전이 밝혀지지 않았으며, 과발현된 p110 $\delta$ -AKT-mTOR 경로가 호기성 글리코시스를 향진시키고, 림포사이트의 기능 및 생존을 저하시켜 면역반응을 저하시킴
- 본 발명에서 신규한 구조를 가지면서 PI3 키나아제를 선택적으로 억제하는 것에 우수한 효과를 나타내는 화합물을 개발하기 위한 노력 중, 특정 구조의 피리미도 옥사진 유도체가 PI3K  $\delta$ ,  $\beta$ ,  $\gamma$ ,  $\delta$ 에 대하여 선택적으로 억제하는 효과를 보이며, 그 중 PI3K  $\delta$ ,  $\gamma$ 에 대하여 억제하는 효과가 우수한 것을 확인함

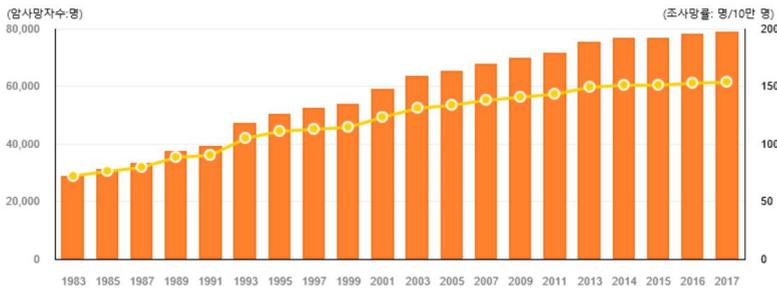


<피리미도 옥사진 유도체>

## 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)

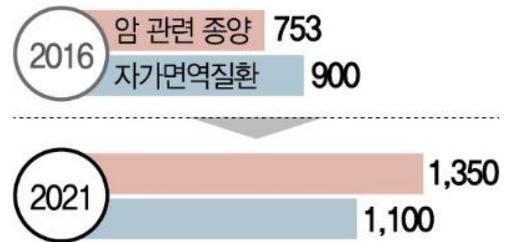
<세계 암 발생률 및 사망률>



[출처] 보건복지부, 2019

- 키타일즈 IMS의 '2021년 글로벌 제약시장 전망'에 따르면, 전세계 제약 규모는 2017년 기준 1조1,046억 달러에 이를 전망이며, 글로벌 제약 시장의 5년간 연평균 성장률은 4~7%대에 이를 것으로 예측됨
- 중앙 치료제 및 자가면역질환 은향후 5년간 연평균 최대 12% 성장해 시장규모가 점차 증가될 전망이다

<주요 의약품 시장전망> (단위 : 억달러)



[출처] 키타일즈 IMS, 2016

## 기술응용분야

- 항암 치료제
- 자가면역질환 치료제



## 지재권 현황

1	특 허 명	허피스바이러스 엑소뉴클리에이즈 활성 억제 물질을 유효성분으로 함유하는 항허피스바이러스용 약학적 조성물		
	특허번호	10-2011-0070146 (10-1399484)	출원일(등록일)	2011.07.14 (2014.05.20)
2	특 허 명	베타-세크리테아제 활성을 억제하는 4-(벤즈이미다졸-2-일아미노)피롤리딘 유도체 및 이를 유효성분으로 함유하는 약제학적 조성물		
	특허번호	10-2012-0045621 (10-1383239)	출원일(등록일)	2012.04.30 (2014.04.02)
3	특 허 명	프로토베르베린 유도체 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염을 유효성분으로 함유하는 NFAT5의 활성 관련 질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물		
	특허번호	10-2013-0168603 / 10-1603279	출원일(등록일)	2013.12.31 (2016.03.08)

## 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