

말단 아민기에 아릴 또는 헤테로아릴기가 치환된 신규한 히드라존 유도체 및 이의 용도

기술보유 기관	한국과학기술연구원	기술 판매 형식	양도, 통상실시권
연구 책임자	배 애 님 교수	기술완성 단계 (TRL)	3 단계_실험단계

기/술/개/요

- 말단 아민기에 아릴 또는 헤테로아릴기가 치환된 신규한 히드라존 유도체(hydrazone derivatives)들이 타우 단백질의 응집은 효율적으로 저해하면서도 활성 농도에서 세포 독성을 나타내지 않음

기존 기술의 문제점

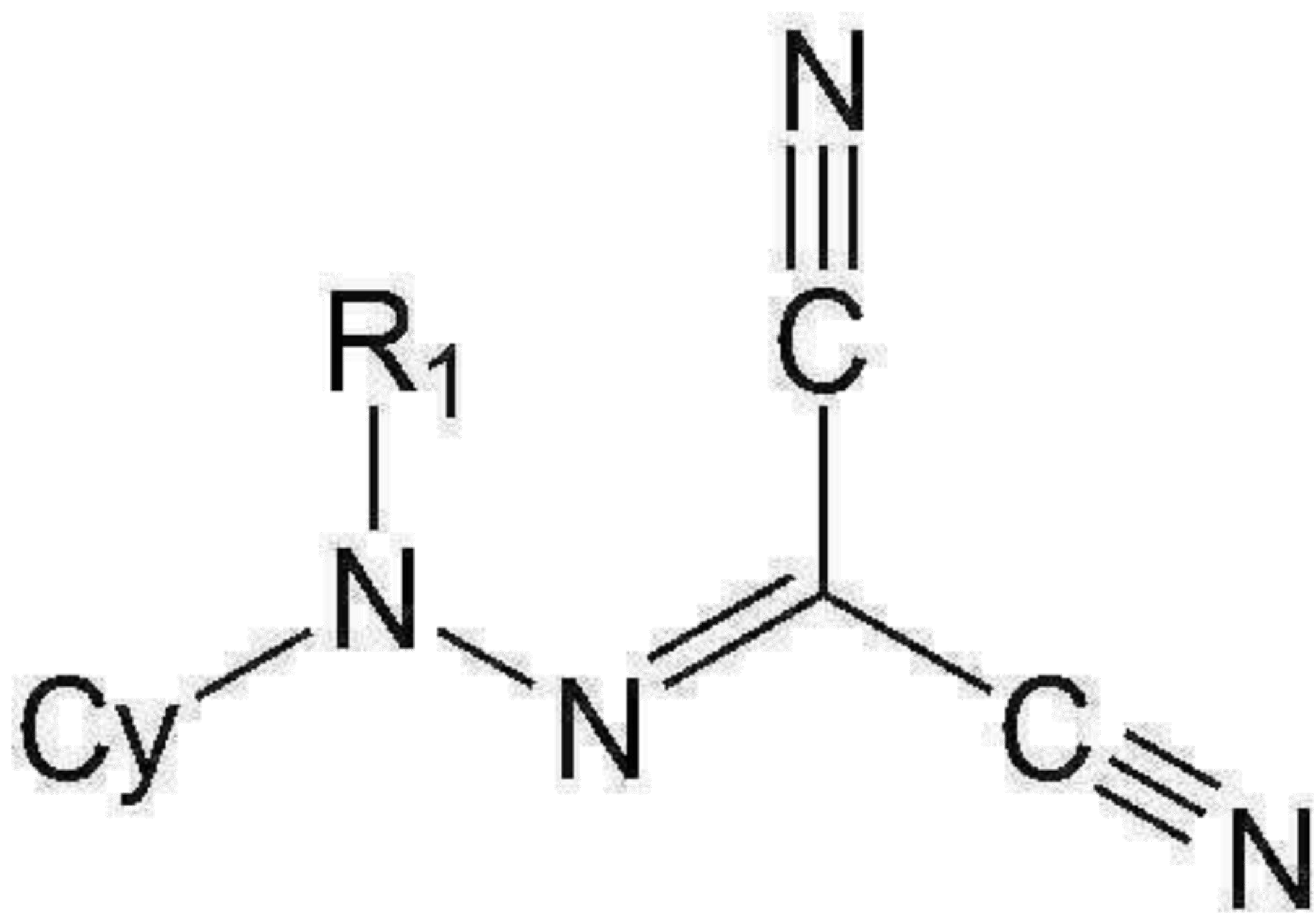
1

타우 단백질의 과인산화 또는 응집이 유발하는 질환의 치료법과 치료제가 부재함

타우 단백질의 과인산화 또는 응집이 알츠하이머 질환 및 타우병증을 포함한 다양한 퇴행성 뇌질환을 유발함
타우 단백질이 매개하는 질환이 어떠한 기전을 통해 신호를 전달하고 독성을 나타내는지 아직 규명되지 않았음

기술특징 및 대표도면

- 화학식 3의 화합물은 산 존재하에 아질산나트륨, 아민기를 포함하는 5-14원 헤테로아릴 또는 5-14원 헤테로사이클릴 유도체 및 말로노니트릴을 반응시켜 이민 결합을 형성하여 제조함
- 또한, 골격에 포함된 다른 반응성 작용기 및/또는 헤테로원소의 존재 여부를 고려하여, 5-14원 헤테로아릴 또는 5-14원 헤테로사이클릴은 동일한 골격에 아민기 대신에 니트로기를 포함하는 니트로페닐 유도체를 환원시킴으로써 제조할 수 있음
- 화합물의 농도 의존적 타우 응집 저해 효과, CYP 동효소 활성 억제 효과, 간 마이크로솜 안정성 등을 확인하였음



『화학식 3』

- R1은 수소 또는 C₁₋₆ 알킬임
- Cy는 비치환 또는 치환된 9-14원 헤테로아릴 또는 9-14원 헤테로사이클릴임
- 치환된 9-14원 헤테로아릴 또는 9-14원 헤테로사이클릴은 비치환 또는 C₁₋₆ 알킬, C₁₋₆ 알콕시, 할로겐, C₁₋₆ 퍼플루오로알킬, C₁₋₆ 퍼플루오로알콕시, C₁₋₆ 할로알킬, (C₁₋₆ 알킬) 아미노, 디(C₁₋₆ 알킬) 아미노, 비치환 또는 C₁₋₆ 알킬로 치환된 카바모일, 또는 비치환 또는 C₁₋₆ 알킬, 할로겐, 및 디(C₁₋₆ 알킬)아미노로 구성된 군으로부터 선택되는 하나 이상으로 치환된 C₆₋₁₄ 아릴, 5-14원 헤테로아릴 또는 5-14원 헤테로사이클릴로 치환됨
- Cy가 벤조티아졸-2-일, 카바졸릴, 및 비치환된 인다졸릴인 경우는 제외함

효과

- 화합물은 단백질 키나아제의 활성을 저해하는 능력이 우수하여 비정상적인 세포 성장으로 유발되는 암 질환의 치료, 예방·경감 목적으로 사용이 가능함
- 낮은 세포독성을 보이면서 암 세포에 대해 선택적으로 높은 억제 활동 및 항증식 효과를 나타내어 암 예방 또는 치료에 유용하게 사용될 수 있음

시장 동향 및 기술적 유용성

- 세계 타우병증 치료 시장은 2019년 7억 1,270만 달러에서 연평균 10.07%의 성장률로 2027년 15억 3600만 달러에 이를 것으로 전망됨
- 이는 타우병증 치료를 위한 새로운 치료법 및 약물의 지속적 연구·개발, 치매·PSP·퇴행성 질환의 유병률 증가 등에 기인한 것으로 분석됨
- 타우병증과 관련된 가장 흔한 질병인 알츠하이머 세계 시장은 2021년 37.6억 달러에서 연평균 12%로 2025년 59.1억 달러에 이를 것으로 전망됨

[세계 타우병증 치료 시장 현황 및 전망]



* 출처 : coherentmarketinsights, (2020)

[세계 알츠하이머 치료 시장 현황 및 전망]



* 출처 : researchandmarkets, (2021)

기술 활용 분야



[알츠하이머 치료제]



[파킨슨 치료제]



[뇌졸중 치료제]

권리 현황

국가	발명의 명칭	출원번호	출원일	상태
KR	말단 아민기에 아릴 또는 헤테로아릴기가 치환된 신규한 히드라존 유도체 및 이의 용도	2020-0039398	2020.03.31	등록
KR	말단 아민기에 아릴 또는 헤테로아릴기가 치환된 신규한 히드라존 유도체 및 이의 용도	2018-0165400	2018.12.19	등록
PCT	Novel hydrazone derivative with aryl or heteroaryl group substituted at terminal amine group thereof and use thereof	PCT/KR2018/016679	2018.12.26	공개
JP	말단 아민 기본으로 아릴 또는 헤테로아릴기가 치환된 신규 히드라존 유도체 및 그 용도	2021-536264	2018.12.26	공개
EP	Novel hydrazone derivative with aryl or heteroaryl group substituted at terminal amine group thereof and use thereof	2018-944116	2018.12.26	공개
CN	Novel hydrazone derivative with aryl or heteroaryl group substituted at terminal amine group thereof and use thereof	2018-80100695	2018.12.26	공개
BR	Composto ou sal farmaceuticamente aceitável do mesmo, método de preparação do composto e composições	112021012004	2018.12.26	공개

문의처



유광철 변리사

- Tel : 02-6453-9121
- Email : kcyou@sigong-ip.com

김성은 책임연구원

- Tel : 02-6453-8873
- Email : sekim@sigong-ip.com