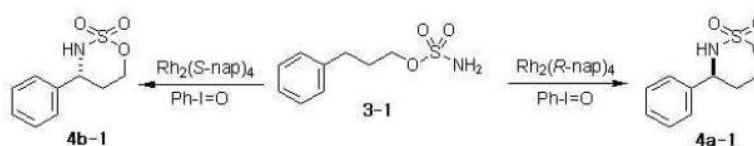


고입체순도 (S)-다포세틴의 고효율 합성 방법

출원번호	10-2010-0058586	
상태	등록완료	
발명자	이현규	
보유기관	한국화학연구원	
거래조건	추후 협상	
TRL단계	사업화 단계	

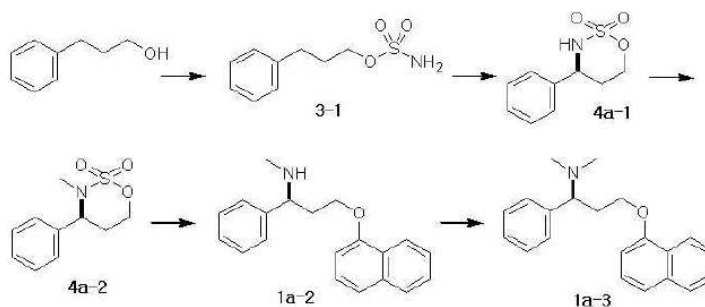
기술 요약

- 본 기술은 술포마이드 화합물의 입체선택적 C-H insertion 반응을 활용하여 (S)-다포세틴을 합성하기 위한 중간체를 고효율, 고입체순도로 합성하는 방법에 관한 것임



본 기술의 입체선택적 C-H insertion 반응

- 본 기술의 적용을 통하여 다음과 같이 매우 저렴한 하이드로신나밀알코올 화합물로부터 5단계만에 (S)-다포세틴을 실용적인 수율과 입체선택성으로 제조할 수 있음



본 기술을 적용한 다포세틴의 입체 선택적 합성

- 본 기술의 실제 상업 공정에서의 적용을 위해서는 재결정 공정의 추가, scale-up 검증 등이 추가로 필요함
 - 다만, 본 기술의 활용으로 얻어지는 고입체순도 중간체의 경우 (S)-다포세틴의 합성 이외에도 다양한 키랄 화합물의 합성에 적용될 수 있을 것으로 기대됨

시장분류	신규시장	기존제품 대체	기존제품 개선	공정원가절감	기타
------	------	---------	---------	--------	----

기존 기술 동향 및 경쟁 기술과의 대비

- 신약 구조가 복잡해짐에 따라서 많은 수의 신약 화합물들이 입체 중심을 1개 이상 가지고 있는 경우가 증가하고 있고 이에 따라서 키랄 의약품 시장은 점진적으로 성장하고 있으며, (S)-다포세틴은 키랄 구조를 가지는 대표적인 화합물임
- 기존에 공지된 (S)-다포세틴의 합성 방법은 (1) 라세믹 다포세틴의 합성 후 입체이성질체를 분리하는 방법; (2) 중간체인 3-히드록시-1-페닐-프로필아민 라세믹 혼합물을 효소 등을 사용하여 분리한 뒤 후속 공정을 진행하는 방법; (3) 키랄 출발물질로부터 다포세틴을 합성하는 방법; 및 (4) 입체 중심을 가지고 있지 않은 출발물질로부터 키랄 시약 및 키랄 촉매를 활용하여 (S)-다포세틴을 입체 선택적으로 합성하는 방법 등이 알려져 있으나 (1) 및 (2)의 방법은 분리 전 라세믹 혼합물 중 (R)-형의 다포세틴을 폐기해야 하고, 분리에 소요되는 시간 및 비용이 과다한 단점을 가지고 있고, (3)의 방법은 출발 물질이 지나치게 고가라는 문제를 가지고 있으며, 기존에 알려진 (4)의 방법은 효율이 저하되고 반응 단계가 지나치게 복잡하다는 문제를 가지고 있음
- 본 기술은 고효율 촉매 반응을 활용하여 저가의 하이드로신나밀알코올 화합물로부터 5단계만에 (S)-다포세틴을 제조할 수 있는 방법으로서 기존 알려진 제조 방법에 비하여 원가를 크게 절감할 수 있다는 장점을 가짐
- 경쟁 우위의 종류? (1) 원가 절감

보유 특허 리스트(국내)

	출원번호	출원일	등록번호	현재상태	Family 有/無	공동 출원
1	10-2009-0108484	2009.11.11	10-1122558	등록	-	-

IP 포트폴리오의 특징

- 본 기술의 IP 포트폴리오는 국내 등록 특허 1건으로 구성되어 있으며, 전이금속 촉매를 활용하여 다포세틴 화합물의 양쪽 이성질체를 효율적으로 합성하는 방법을 보호하고 있음
- 본 기술은 (S)-다포세틴 제조 이외의 다른 용도로도 활용될 수 있으나 사업화를 위해서는 본 기술의 기반 IP를 바탕으로 새로운 구체적인 특정 중간체의 합성방법을 개발해서 새로운 IP의 창출 필요성이 있음

협력 모델

- 라이선싱을 통한 기술이전
- 공동연구를 통한 추가 기술개발 이후 기술이전

Contact Point 기술마케팅팀 정두영 선임연구원
Tel: 042-860-7081 / e-mail: jady4120@kRICT.re.kr