


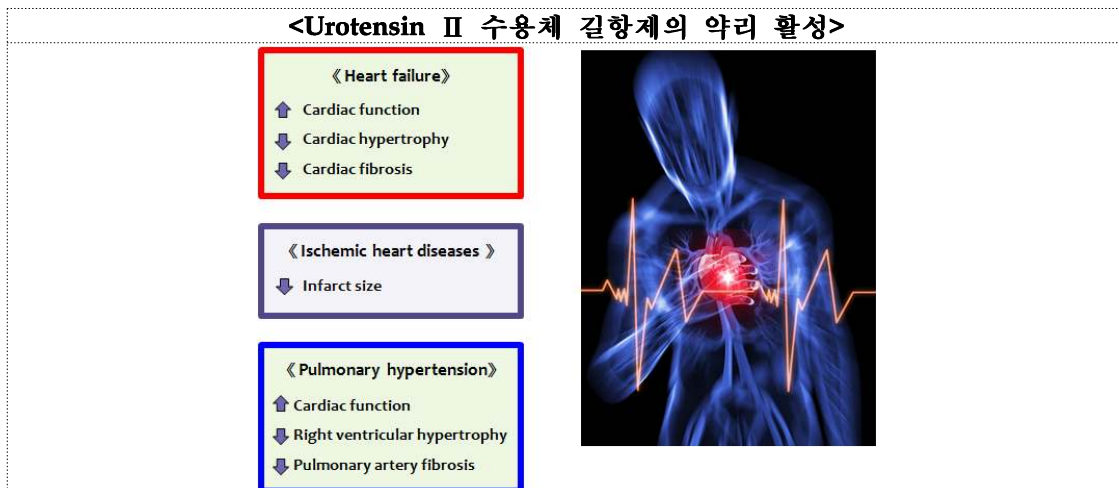
Urotensin II 수용체 길항체를 활용한 심혈관질환치료제 개발기술

출원번호	10-2013-0016025	<p style="text-align: center;">대표이미지</p> <div style="display: flex; align-items: center;"> <div style="flex: 1;"> <div style="border: 2px solid red; padding: 5px; margin-bottom: 5px;"> <p style="text-align: center;">《 Heart failure 》</p> <ul style="list-style-type: none"> ↑ Cardiac function ↓ Cardiac hypertrophy ↓ Cardiac fibrosis </div> <div style="border: 2px solid purple; padding: 5px; margin-bottom: 5px;"> <p style="text-align: center;">《 Ischemic heart diseases 》</p> <ul style="list-style-type: none"> ↓ Infarct size </div> <div style="border: 2px solid blue; padding: 5px;"> <p style="text-align: center;">《 Pulmonary hypertension 》</p> <ul style="list-style-type: none"> ↑ Cardiac function ↓ Right ventricular hypertrophy ↓ Pulmonary artery fibrosis </div> </div>  </div>
상태	출원완료	
발명자	-	
보유기관	한국화학연구원	
거래조건	추후 협상	
TRL단계	사업화단계	

I. 기술 개요

□ 기술 요약

본 기술은 심부전 치료제, 허혈성 질환 치료제 및 각종 심혈관 치료제로서 개발이 가능한 Urotensin II 수용체의 길항제 후보물질에 관한 것으로서 다양한 동물모델에서의 유효성이 입증된 심부전·허혈성 질환·심혈관 질환 치료제 후보물질에 관한 기술임



- 본 기술의 심혈관 치료제 후보물질(KR-36676/-36996)은 심부전 동물 모델에서 심장 기능 증대, 심근 비대 및 섬유화로 인한 추가 병리 작용 발생 저하, 허혈성 동물 모델에서의 병변 감소, 고혈압 동물 모델에서의 심장 기능 개선 및 각종 부작용 완화 등 생체 내 유효성이 입증되었음

- KR-36676/-36996은 용해도 등 물리화학적 성질이 우수하고, 약동학적 분포 성능이 뛰어나서 경구투여형 심장질환 치료제로서의 개발이 가능할 것으로 판단되며, 각종 독성학 평가 및 안정성 평가 등에서도 높은 수준의 안정성이 확보된 우수한 후보물질로 판단됨
- Urotensin II 수용체 길항제는 First-in-Class 신약 개발이 가능한 검증된 타겟으로서, 다수의 제약사 프로젝트를 비롯하여 현재 전세계적으로 266개의 프로젝트가 진행되고 있으나 GSK사의 1개 화합물만이 임상 진행 중이어서 First-in-Class 신약의 개발이 가능한 상황임. KR-36676/-36996은 관련된 leading 프로젝트인 GSK1440115에 비하여 다양한 동물 모델에서 우월한 약리 활성 및 개선된 약동학·안정성 프로파일을 보이는 신약 후보 물질임

□ 기술의 차별성

특징	장점
<ul style="list-style-type: none"> • First-in-Class 신약 개발이 가능한 신약 후보물질 • 용해도, 흡수성능, 인체분포 등 신약 후보물질에 요구되는 물리화학적 특성이 뛰어나 경구투여형 심부전 치료제 개발 가능 • 잠재 안전성 평가 등 글로벌 기준의 critical success factor를 충족시키는 높은 개발 성공 가능성 	<ul style="list-style-type: none"> • 선진 경쟁사의 후보물질에 비하여 in vivo efficacy가 뛰어남 • 심부전 치료제 중 심부전의 주요 원인인 심근 비대증 및 심근 섬유화를 직접적으로 다룰 수 있는 • 관련된 생리학·병리학적 메커니즘이 잘 밝혀져 있음

- 현재 266개의 관련 프로젝트가 진행 중이나, 이 중 선두에 있는 GSK 등 선진 경쟁사의 후보 물질에 비하여 in vivo efficacy가 뛰어나서, First-in-Class 신약으로의 개발 가능성이 있음
- 심부전 치료제 중 심근 비대증·심근 섬유화 등 직접적인 심부전의 원인을 다룰 수 있는 치료 물질이 부재하여, 해당 분야의 높은 **unmet medical needs**가 존재함
- 해당 타겟인 Urotensin II 수용체의 경우 비교적 신규의 타겟에 해당함에도 불구하고, 관련된 생리학·병리학적인 메커니즘이 잘 밝혀져 있어서, 신약 개발 성공 가능성이 높음

□ 응용 분야

- 심부전·고혈압·허혈성 질환 등 심혈관 치료제
- 당뇨병 신장질환·천식·녹내장 등 기타 질환 치료제

II. Business Opportunity

□ 심혈관 치료제 시장 분석

세계 의약품 시장에서 심혈관계 질환 관련 약물은 전세계 의약품 시장의 22%로 가장 큰 부분을 차지하고 있으며, Datamonitor의 2007년 통계를 바탕으로 매년 심부전 발생 약 2,000만명, 말초혈관 질환 2,000만명 이상, 협심증 및 심근경색 200만명 이상 등이 발생할 것으로 추정되어 관련 시장은 2017년까지 지속적으로 성장할 것으로 예상됨.



최근 인구 고령화 및 서구화된 생활 패턴의 확산 등 위험인자의 증가로 인한 해당 환자군의 증가 및 이에 따른 관련 시장의 지속적인 증가세, 높은 재발률 및 사망률, 개발된 간접 치료제들의 부작용(반신마비, 언어장애, 뇌성마비, 간질 등) 및 해당 질환에 대한 직접적인 치료제의 부재로 인한 치료의 어려움 가중 등의 여러 요인으로 인하여 심혈관 질환에 직접적인 작용 기전을 가지는 치료제의 개발이 절실해지고 있으며, 이에 따라 심근 비대 및 섬유화를 타겟으로 하는 새로운 메카니즘의 치료제인 Urotensin II 수용체 길항제의 개발 필요성이 증대됨. 본 기술의 Urotensin II 수용체 길항제는 다음과 같은 특성으로 인하여 잠재적인 블록버스터급 신약으로서의 개발이 기대됨;

- (1) 심혈관 관련 시장은 현재 전세계 의약품 시장의 20% 이상을 차지하는 대형 시장으로서 향후로도 고령화·생활양식의 변화 등에 따라서 관련 질환 환자가 증가할 것으로 판단되며, 특히 심부전 질환 치료제는 그 중요성에도 불구하고, 아직 적합한 직접 치료제가 부재한 상태로 Urotensin II 수용체 길항제의 개발 성공 시 거대 품목으로 성장 가능함 → **대형 시장 확보 가능성**
- (2) Urotensin II 수용체 길항제와 직접적인 관련 시장인 심부전 치료제 시장은 질환의 치명성, 높은 재발률 및 사망률 등의 문제와 더불어 현재 안전하고 질환을 직접 치료할 수 있는 치료제가 존재하지 않아서 효과가 떨어지는 간접 치료제에의 의존 혹은 안전성이 떨어지는 질환

2014 NTB 우수기술설명회



치료제의 활용 등과 같은 문제점이 지속되고 있어서 Urotensin II 수용체 길항제의 성공적 개발을 통한 unmet medical needs의 충족 필요성이 있음 → **유력한 세부 시장에서의 Unmet medical needs 충족의 가능성 확보**

따라서 본 기술의 도입자는 **잠재적 블록버스터 신약**이 기대되는 분야의 **low-risk**를 가지는 **우수한 프로파일의 신약 개발 후보물질**을 활용할 수 있음.

III. Patent Portfolio

출원번호	구분	발명의 명칭	비고
2013-0016025	출원	신규한 싸이에노[3,2-b]피리딜 우레아 유도체 또는 이의 약학적으로허용가능한염, 이의제조방법및이를 유효성분으로포함하는유로텐신-II수용체활성관련 질환의예방 또는치료용약학적조성물	
2013-0024375	출원	신규한 아졸-접합 피리딜 우레아 유도체 또는 이의 약학적으로허용가능한염,이의 제조방법및이를 유효성분으로포함하는유로텐신-II수용체활성관련 질환의예방또는 치료용약학적조성물	
2013-0145437	출원	5 각형 헤테로 아틸기를 포함하는 벤조옥사지는 유도체 또는이의약학적으로허용가능한염,이의제조방법및 이를유효성분으로 함유하는유로텐신-II수용체 과활성에의 한질환의예방또는치료용약학적조성물	
2013-0145476	출원	벤조옥사지는 유도체 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염,이의제조방법및이를유효성분으로함유하는 유로텐신-II수용체 과활성에의한질환의예방또는 치료용약학적조성물	

본 기술의 특허 포트폴리오는 2013년에 특허출원된 4건의 국내 특허출원으로 구성되어 있음(2014년 중 PCT 출원 예정). 본 특허포트폴리오는 Urotensin II 수용체 길항제로서 **높은 효능 및 안정적인 프로파일을 보이는 4종의 서로 다른 골격을 가지는 화합물** 군에 관한 것으로서, 기존 경쟁 Urotensin II 수용체 길항제 후보 화합물들과는 **차별화된 신규 구조의 화합물로 이루어진 경쟁력 있는 특허 space**를 점유하고 있음.