

대사항암제로서 글루타미네즈 억제제 발굴

연구책임자

이 광 호 책임연구원 · kwangho@krikt.re.kr
한국화학연구원 의약바이오연구본부 신약정보기술연구센터

요소기술별 분류

대분류	중분류	소분류
의료기반기술	암 치료제	폐암, 자궁암 치료제

기술개요 및 개발배경

- 신규한 골격의 글루타미네이즈 저해제 후보물질 TRG-192 발굴 및 작용기전 확인
- 동물실험 약효 확인
- 특허 출원

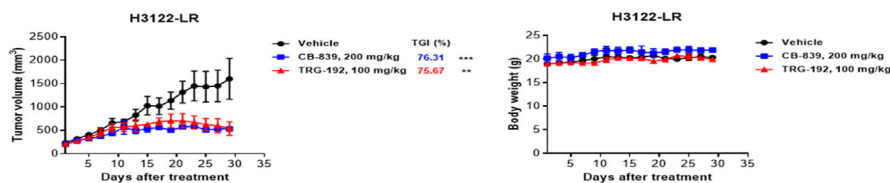
Core key word

#글루타미네이즈 #대사항암제
#비소세포폐암 #저분자 항암제

기술내용 및 대표이미지

선택성이 뛰어난 알로스테릭 저해 기전의 글루타미네이즈 저해제 신물질 TRG-192 발굴

- For H3122-LR: CB-839 (대조물질) IC₅₀ = 0.016 μ M, TRG-192 IC₅₀ = 0.028 μ M
- CB-839 (po, 200 mg/kg, BID), TRG-192 (po, 100 mg/kg, BID) for 29 days
- No noticeable body weight change observed.
- 신규 골격 선도물질 TRG-192 도출 및 동물실험 약효 확인



[그림] H3122-LR 유래 이종이식 마우스 모델에서 TRG-192의 in vivo 항종양 효능

기술 한계점 vs 개선점

[기존기술한계점]

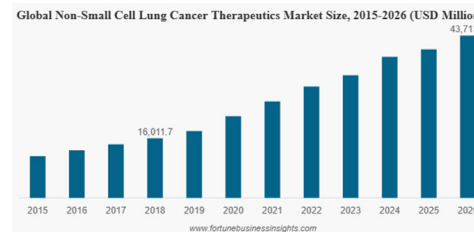
- 비소세포폐암의 주요 발암원인인 KRAS 돌연변이와 STK11 & KEAP1을 동반돌연변이로 가지는 하위분류는 미충족 의료수요임
- KRAS, STK11 & KEAP1돌연변이는 글루타미네이즈에 대한 의존성 보고됨
- 또한 표적항암제 약물 내성기전으로 글루타미네이즈 과활성화 확인됨
- CB-839가 임상연구로 진입하였으나 열등한 약물성으로 중단됨
- IACS-6274는 현재 임상1상 병용연구 진행

[개발기술개선점]

- 신규 골격의 화합물 TRG-192의 개선된 물성, 안정성, 용해도, 약동력 확인
- 면역결핍 생쥐에서 진행한 H3122-LR 이종 이식 마우스 모델에서 CB-839 (po 200 mg/kg, BID), TRG-192 (po 100 mg/kg, BID)를 29일간 투여한 결과, 중앙 성장 억제(Tumor Growth Inhibition, TGI) 비율이 각각 76.3%, 75.7%로 중앙 성장억제 확인. 또한 투여 기간 동안 특이한 체중의 변화는 없었음.

관련시장동향

- 폐암 치료제 시장 규모는 2018년 기준 16,011백만 달러 규모에서 2026년 43,713백만 달러 규모로 성장할 것으로 전망됨
- 비소세포 폐암은 전 세계 폐암의 총 사례의 80% -85%를 차지함



Business Idea / 응용·적용분야

- 비소세포폐암 치료제에 적합한 항암 소재 활용 의약품제
- 응용분야: 항암제
- 적용제품: 개인 맞춤형 항암 의약품



기술성숙도



Lab-scale 성능 평가 단계 : 실용화를 위한 핵심기술요소 확보

IP Portfolio

No	발명의 명칭	국가	출원번호	출원일자	등록번호	등록일자
1	신규한 다-아미드 화합물, 이의 제조방법, 이를 유효성분으로 포함하는 암 또는 자가면역질환의 예방 또는 치료용 약학적 조성물	KR	10-2023-0135251	2023-10-11		
2		KR	10-2024-0136688	2024-10-08		
3		PCT	PCT/KR2024/096315	2024-10-11		

기술이전 문의처 한국화학연구원 기술사업화센터

이난영 책임연구원 ☎ 042-860-7940 ✉ nylee@krikt.re.kr 심형훈 선임연구원 ☎ 042-860-7078 ✉ hhsim@krikt.re.kr
권민수 선임연구원 ☎ 042-860-7337 ✉ mskwon@krikt.re.kr