

# 종근당, 면역억제제 ‘타크로벨’ 캡슐 신기술 특허취득 및 0.25mg 신제형 추가 발매로 수출 활로 개척 박차



- ▶ 타크로벨은 최근 Tacrolimus (tacrolimus) 제제인 ‘타크로벨’ 캡슐 추가 발매
- ▶ 신개념 Solid Dispersion (고체 분산체) 기술로 고순도 원료 생산 및 용출율을 크게 개선한 독자 신기술 개발에 성공함에 따라 타크로벨의 균주, 캡슐 조성물의 특허 및 등록을 마치고 본격적인 국내 판매에 들어갔다.
- ▶ 타크로벨은 최근 원료제조에 관한 집중적인 연구개발을 통하여 고순도의 타크로리무스 (CKD 1119) 원료 생산 방법에 대한 기술개발을 완료하고 특허 (출원번호: 2003-0100557호)도 완료했다. 이 기술로 장기 이식(골수 이식 포함)시 타크로리무스 제제의 치료 효과 확보에 가장 중요한 요소인 약물의 용출율을 신개념의 Solid Dispersion (고체 분산체) 기술을 사용하여 고순도 원료 생산 및 용출율을 크게 개선한 신기술 공법으로 제품에 대한 신뢰도를 더욱 향상시켰다.
- ▶ 기존 타크로리무스는 일본 북부지방 쓰쿠바 지역에서 채취된 흙 시료로부터 얻은 미생물인 스트렙토마이세스 쓰쿠바엔시스(*Streptomyces tsukubaensis*)의 발효액에서 발견되었으며 생산 수율이 낮아 비경제적이었다.
- ▶ 종근당 제제연구소장 신희중 박사는 이와 같은 단점을 보완하기 위해 충남 보령시 토양에서 채취한 *Streptomyces clavuligerus*(스트렙토마이세스 클라블리저러스) 균주(특허 제 0485877호 : 특허 출원 2003년 12월)를 이용하여 고순도의 타크로리무스를 대량 생산하는데 성공하였고, 신개념의 Solid Dispersion(고체분산체) 기술 특허를 발명하여 용출율이 개선된 타크로리무스 제제인 ‘타크로벨’을 순수 국내기술로서 종근당 연구소에서 개발하였다.
- ▶ 기존 타크로리무스 약물은 물에 난용성이기 때문에 경구 투여시에 용출율이 낮아 신속한 약물방출이 이루어지지 못해 혈액내로 흡수되는 비율이 불충분하며, 경구 투여시에 생체이용율이 낮다는 문제점이 있다.
- ▶ 2009년 12월 타크로벨 0.25mg 신제형 발매



종근당은 장기이식 면역억제제 ‘타크로벨’ 캡슐(성분: 타크로리무스)을 출시하면서, 신개념의 Solid Dispersion (고체 분산체) 기술로 고순도 원료 생산 및 용출율을 크게 개선한 독자 신기술 개발에 성공함에 따라 타크로벨의 균주, 캡슐 조성물의 특허 및 등록을 마치고 본격적인 국내 판매에 들어갔다.

종근당은 최근 원료제조에 관한 집중적인 연구개발을 통하여 고순도의 타크로리무스 (CKD 1119) 원료 생산 방법에 대한 기술개발을 완료하고 특허 (출원번호: 2003-0100557호)도 완료했다. 이 기술로 장기 이식(골수 이식 포함)시 타크로리무스 제제의 치료 효과 확보에 가장 중요한 요소인 약물의 용출율을 신개념의 Solid Dispersion (고체 분산체) 기술을 사용하여 고순도 원료 생산 및 용출율을 크게 개선한 신기술 공법으로 제품에 대한 신뢰도를 더욱 향상시켰다.

기존의 타크로리무스는 일본 북부지방 쓰쿠바 지역에서 채취된 흙 시료로부터 얻은 미생물인 스트렙토마이세스 쓰쿠바엔시스(*Streptomyces tsukubaensis*)의 발효액에서 발견되었으며 생산 수율이 낮아 비경제적이었다.

종근당 제제연구소장 신희중 박사는 이와 같은 단점을 보완하기 위해 충남 보령시 토양에서 채취한 *Streptomyces clavuligerus*(스트렙토마이세스 클라블리저러스) 균주(특허 제 0485877호 : 특허 출원 2003년 12월)를 이용하여 고순도의 타크로리무스를 대량 생산하는데 성공하였고, 신개념의 Solid Dispersion(고체분산체) 기술 특허를 발명하여 용출율이 개선된 타크로리무스 제제인 ‘타크로벨’을 순수 국내기술로서 종근당 연구소에서 개발하였다.

기존 타크로리무스 약물은 물에 난용성이기 때문에 경구 투여시에 용출율이 낮아 신속한 약물방출이 이루어지지 못해 혈액내로 흡수되는 비율이 불충분하며, 경구 투여시에 생체이용율이 낮다는 문제점이 있다.

흔히 난용성 약물의 용출을 개선을 위해서 약물 입자의 분쇄, 계면활성제 등의 첨가를 통한 약물의 가용화, 마이크로에멀전 및 고체분산체 등이 보편적으로 응용되고 있으며, 그 중 고체분산체는 고형의 담체에 약물을 비결정질 상태로 분산시켜 용출을 향상시키는 방법으로, 고형의 담체와 약물을 적절한 유기용매에 용해 또는 용융시킨 후 건조 또는 냉각하여 제조한다.

기존 타크로리무스 제제에서는 수용성 중합체를 담체로 함유하는 타크로리무스 고체분산체를 이용하였으나, 이 고체분산체의 경구흡수율은 그 편차가 심한 경향이 있는 것으로 지적되고 있다.

이에 종근당은 신개념의 고체분산체 기술은 비결정질 상태의 약물을 함유하고 있으며 이를 운반하는 운반체(carrier)로서의 역할을 담당하는 담체기능과 용출개선 기능을 한꺼번에 수행할 수 있는 계면활성제를 난용성 약물인 타크로리무스의 고체분산체 담체로 사용하여 용출율을 개선함으로써, 신속한 약물방출로 인하여 경구흡수율 및 생체이용율을 높일 수 있는 기술이다.

현재까지 면역억제제로서 가장 많이 사용되고 있는 면역억제제는 사이클로스포린(cyclosporine)이며, 이외에 널리 사용되는 주면억제제에는 타크로리무스를 비롯하여 보조면억제제 시롤리무스(sirolimus), 브레디닌(Mizoribine), 마이코 페놀레이트모페틸(mycophenolate mofetil) 등이 있다.



그 중에서, 사이클로스포린 A에 비해 이식거부와 고혈압 발생율이 적고, 적은 양으로도 동일한 면역억제효과를 나타내면서도 부작용이 적은 타크로리무스 제제(면역억제 효과를 가지고 있는 매크로라이드(macrolide)계에 속하는 항생물질)는 최근 가장 각광을 받고 있다.

국내 면역억제제 시장은 다국적 회사 제품이 대부분이나 종근당은 이를 극복한 자랑스런 국내 회사로서 주면억제제인 사이폴렌과 타크로리무스 제제인 타크로벨을 모두 국내기술로서 연구 개발하여 두 가지 성분에 특화를 보유한 유일한 회사이며 타크로벨은 충남 보령의 토양에서 채취한 *Streptomyces clavuligerus*(스트렙토마이세스 클라블리저러스) 균주와 기존 타크로리무스의 용출율을 크게 개선한 고순도의 신개념 Solid Dispersion 기술로서 개발한 우수한 제품으로 연간 200억 이상의 수입 대체 효과는 물론 미국, 유럽 등 전 세계에 수출 의약품으로 거대 품목이 될 것임을 확신하며 타크로벨의 확실한 경쟁력 확보를 통하여 국내외 면역억제제 시장에서 향후 약 200억 원 이상의 매출을 달성할 것으로 기대한다.

※ 면역억제제 홈페이지 [www.ckdimuno.com](http://www.ckdimuno.com)

※ 문의전화 : 종근당 마케팅부 면역억제제팀 T.3149-7925~9