



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2013년01월14일
(11) 등록번호 10-1221640
(24) 등록일자 2013년01월07일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
A61K 31/4741 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
(21) 출원번호 10-2006-7027912
(22) 출원일자(국제) 2005년06월08일
심사청구일자 2010년03월16일
(85) 번역문제출일자 2006년12월29일
(65) 공개번호 10-2007-0030246
(43) 공개일자 2007년03월15일
(86) 국제출원번호 PCT/IT2005/000320
(87) 국제공개번호 WO 2005/120643
국제공개일자 2005년12월22일
(30) 우선권주장
RM2004A000288 2004년06월11일 이탈리아(IT)
(56) 선행기술조사문헌
US20040018988 A1*
*는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자
시그마타우 인두스트리에 파르마슈티케 리우니테
에스.피.에이.
이탈리아 로마 00144 비알레 샤케스파아레 47
(72) 발명자
카르미나티 파올로
이탈리아, 포메지아 아이-00040, 케이엠.30,400,
비아 폰티나, 시그마-타우 인두스트리에 파르마슈
티케 리우니테 에스.피.에이내
코르시 마르코
이탈리아, 포메지아 아이-00040, 케이엠.30,400,
비아 폰티나, 시그마-타우 인두스트리에 파르마슈
티케 리우니테 에스.피.에이내
(뒷면에 계속)
(74) 대리인
백남훈, 한라특허법인

전체 청구항 수 : 총 6 항

심사관 : 윤소라

(54) 발명의 명칭 자궁 중양 치료용 약제의 제조를 위한 7-티-부톡시이미노메틸캄토테신의 용도

(57) 요약

자궁 중양, 특히 자궁내막 및 자궁경부암의 치료에 유용한 약제의 제조에 있어서 7-t-부톡시이미노메틸캄토테신의 용도를 개시한다.

(72) 발명자

잔나 클라우디오

이탈리아, 포메지아 아이-00040, 케이엠.30,400,
비아 폰티나, 시그마-타우 인두스트리에 파르마슈티
케 리우니테 에스.피.에이내

카발리 프랑코

스위스 벨린조나 씨에이치-6500 오스페달레 레지오
날레 디벨린조나 에 발리, 디아이브이. 디 온콜로
지아 메디카 인스티투토온콜로지코 델라 스비제라
이탈리아나 내

지아니 루카

이탈리아 밀라노 아이-20133 비아 베네지안 1 아이
투모리인스티투토 나치오날레 페르 로 스튜디오 에
라 쿠라 데 내

세사 크리스티아나

스위스 벨린조나 씨에이치-6500 오스페달레 레지오
날레 디벨린조나 에 발리, 디아이브이. 디 온콜로
지아 메디카 인스티투토온콜로지코 델라 스비제라
이탈리아나 내

특허청구의 범위

청구항 1

7-t-부톡시이미노메틸캄토테신(지마테칸)을 단일치료 성분으로 함유하는 진행된 자궁 종양 치료제.

청구항 2

제 1 항에 있어서, 상기 종양이 자궁내막암인 것을 특징으로 하는 종양 치료제.

청구항 3

제 1 항에 있어서, 상기 종양이 자궁 경부암인 것을 특징으로 하는 종양 치료제.

청구항 4

제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 종양 치료제는 경구 투여제인 것을 특징으로 하는 종양 치료제.

청구항 5

제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 종양 치료제는 리포솜 제형인 것을 특징으로 하는 종양 치료제.

청구항 6

제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 종양 치료제는 비 경구 투여제인 것을 특징으로 하는 종양 치료제.

청구항 7

삭제

청구항 8

삭제

청구항 9

삭제

청구항 10

삭제

청구항 11

삭제

청구항 12

삭제

명세서

기술분야

[0001] 본 발명은 항암 활성, 특히 자궁 종양에 대한 활성을 갖는 약제의 제조를 위한 7-3급부톡시이미노메틸캄토테신의 용도에 관한 것이다.

배경기술

[0002] 항암 화학요법제는 가장 제한적인 치료 창을 갖는 약물이다. 실제로, 그의 세포독성 활성은 비 선택적이기 때

문에, 상기 약물이 접촉하게 되는 신체의 모든 세포에 무차별 손상을 입힐 수 있다.

[0003] 과거 20년간 자궁암(상기 용어는 자궁경부 및 자궁내막 암종을 모두 포함한다)은 여성에서 가장 흔한 골반 암이 되었다. 수술은 대부분의 환자가 선택하는 치료이다. 화학요법의 사용은 일반적으로 전이되거나 또는 진행된 질병의 치료에 국한된다. 자궁암의 치료에 통상적으로 처방되는 화학요법제는 상당히 낮은 양성 반응 수준, 전형적으로는 20% 내지 35% 범위의 수준을 특징으로 한다. 따라서, 보다 높은 양성 반응률을 생성시킬 수 있고 동시에 보다 적은 부작용 또는 적어도 보다 허용 가능한 정도의 부작용을 제공할 수 있는 항암 약물을 동정할 필요성이 여전히 인식되고 있다. 7-3급부톡시이미노메틸캄토테신(CPT184 또는 ST1481 또는 지마테칸)은 경구 활성 캄토테신 유도체이며 유럽 특허 EP 1 044 977에 개시되어 있고, 상기 특허에는 비 소세포 폐암 세포주에 대한 그의 활성이 명시되어 있으며 자궁 암은 언급되어 있지 않다.

발명의 상세한 설명

[0004] 발명의 요약

[0005] 본 발명에 이르러 지마테칸이 자궁 종양, 특히 자궁내막 및 자궁 경부의 종양에도 또한 활성이 있음이 밝혀졌다.

[0006] 따라서, 본 발명의 목적은 자궁암, 특히 자궁내막 및 자궁경부암의 치료를 위한 약제의 제조를 위한 7-t-부톡시이미노메틸캄토테신(이후부터 또한 지마테칸이라고도 칭함)의 용도이다.

[0007] 본 발명의 또 다른 목적은 자궁 종양을 앓고 있는 환자에게 유효량의 7-t-부톡시이미노메틸캄토테신을 투여함을 포함하는, 상기 환자의 치료 방법이다.

[0008] 본 발명의 주제인 상기 약제는 개시된 그대로, 예를 들어 상기 언급한 유럽 특허에 개시된 약학 조성물의 형태를 취할 것이다. 바람직하게는, 상기 약제 형태는 경구 투여에 적합할 것이다. 바람직한 형태에서, 상기 활성 성분을, 예를 들어 국제 특허 출원 PCT/IT00/00137에 개시된 바와 같은 리포솜 제형, 또는 비 경구 경로를 통한 그의 투여를 허용하는 일부 다른 형태에 통합시킬 것이다.

[0009] 하기의 실시예는 본 발명을 추가로 예시한다.

실시예

[0010] 실시예 1

[0011] 지마테칸은 생체 내 임상 전 시험에서 높은 치료 지수를 나타낸 신규의 항암 화합물이다. 더욱이, 지마테칸은 상이한 투여 섭생, 즉 간헐적 및 연장된 투여 섭생 모두에서 유지되는 항암 활성을 특징으로 한다.

[0012] 상기 임상 전 증거에 비추어, 유럽의 I 기 시험을, 지마테칸을 상이한 투여 섭생으로 단일 치료제로서 투여하여 수행하였다. 연구된 환자들은 치료 또는 표준 요법이 더 이상 적용되지 않는 진행된 암에 걸려 있었다. 상기 연구의 목적이 지마테칸의 치료 허용성을 평가하기 위한 것이었지만, 상기 임상 시험 도중 지마테칸은 다수의 지속적인 객관적인 임상 반응들을 생성시켰다. 특히 많은 선행 치료를 받고 전이된 질병을 나타낸 다수의 자궁 경부 및 자궁 내막 모두의 자궁암 환자의 반응들은 언급할만하다. 이러한 임상 반응들을 부분적인 반응으로서 규정하였다, 즉 이들은 진단 영상 기법, 예를 들어 컴퓨터 단층촬영에 의해 평가 시 종양 병변 또는 병변들의 30%를 초과하는 감소를 나타내었다.

[0013] 상기 반응들에 대해 상기 임상 시험에 참여하지 않은 전문가가 상기 관찰을 확인하여 2 개의 독립적인 평가를 수행하였다.