

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成25年11月14日 (2013.11.14)

【公開番号】特開2012-176956(P2012-176956A)

【公開日】平成24年9月13日 (2012.9.13)

【年通号数】公開・登録公報2012-037

【出願番号】特願2012-92614(P2012-92614)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/403 (2006.01)

A 6 1 K 31/7056 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/403 Z N A

A 6 1 K 31/7056

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 19/08
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 33/06
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 31/14

【手続補正書】

【提出日】平成25年9月27日(2013.9.27)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

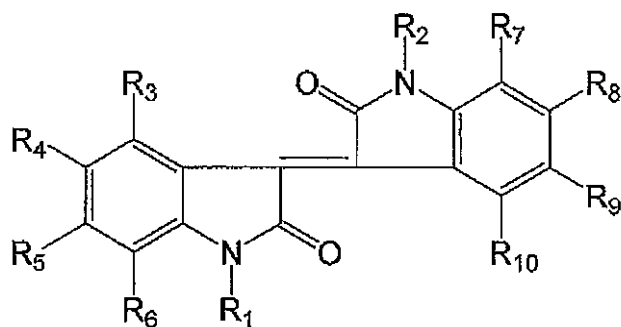
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



式 (I)

〔式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、及び R_{10} は、同じ又は異なり、水素原子；ヒドロキシ基；ニトロソ基；ニトロ基；モノサッカリド；ジサッカリド；ハロゲン原子；ヒドロカルビル基、又は官能性ヒドロカルビル基（非置換又は1個以上のヒドロキシ

部分、カルボキシ部分、ニトロキシ部分、モノサッカリド、ジサッカリド、アミン、アミド、チオール、スルフェート、スルホネート、スルホンアミドもしくはハロゲンで置換されており、ヒドロカルビルは1～8個の炭素原子を有する)； $-R_{11}R_{12}$ 基{ R_{11} 及び R_{12} は、同じ又は異なっていてよく、水素原子、1～18個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖アルキル基(1個以上のヒドロキシ及び/又はアミノ基をさらに持っていてよい)、置換又は非置換アリール基(1個以上のヘテロ原子を含んでいてもよい)、又はアシル基を表すか、又は R_{11} と R_{12} は一緒になって2～6個の、置換されていてもよい CH_2 基を有する環を形成する}；アゾ基 $-N=N-R_{13}$ { R_{13} は芳香族系(1個以上のカルボキシル基及び/又はホスホリル基で置換されていてもよい)又は糖、アミノ酸、ペプチドもしくはステロイドホルモンからなる群から選ばれる基を表す}を表すか；又は R_1 と R_6 及び R_2 と R_7 は、それぞれ、互いから独立して、1～4個の、置換されていてもよい CH_2 基を有する環を一緒になって形成し；そして

R_1 及び R_2 は、同じ又は異なり、水素原子；ハロゲン原子；ヒドロキシ基；ヒドロカルビル基、又は官能性ヒドロカルビル基(非置換又は1個以上のヒドロキシ部分、カルボキシ部分、ニトロキシ部分、モノサッカリド、ジサッカリド、アミン、アミド、チオール、スルフェート、スルホネート、スルホンアミドもしくはハロゲンで置換されており、ヒドロカルビルは1～8個の炭素原子を有する)；モノ-、ジ-又はトリアルキルシリル基(互いに独立して各場合において直鎖又は分枝鎖アルキル基に1～6個の炭素原子を有する)；モノ-、ジ-又はトリアリールシリル基(互いに独立して各場合において置換又は非置換アリール基を有する)； $-NR_{17}R_{18}$ 基{ R_{17} 及び R_{18} は、同じ又は異なっていてよく、水素原子、1～18個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖アルキル基(1個以上のヒドロキシ及び/又はアミノ基をさらに持っていてよい)、置換又は非置換アリール基(1個以上のヘテロ原子を含んでいてもよい)、又はアシル基を表す}；メチレンアミノ基 $-CH_2-NR_{17}R_{18}$ (R_{17} 及び R_{18} は上記定義を有する)；アミドとして窒素に結合している生理的アミノ酸残基、置換又は非置換モノサッカリド、ジサッカリド又はオリゴサッカリド；又は糖、アミノ酸、ペプチドもしくはステロイドホルモンを表す]の化合物を含む、リウマチ様関節炎、狼瘡、多発性硬化症、I型糖尿病、II型糖尿病、炎症性腸疾患、胃腸合併症、および胃腸障害からなる群から選ばれる炎症関連疾患を治療および/または予防するための医薬組成物。

【請求項2】

胃腸合併症が下痢であり、胃腸障害がセリアック病及び非特異性大腸炎からなる群から選ばれる請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

少なくとも R_1 又は R_2 が、モノサッカリド、ジサッカリド(非置換又は1個以上のヒドロキシ部分もしくはカルボキシ部分で置換されている)；ハロゲン；ヒドロカルビル基、又は官能性ヒドロカルビル基(非置換又は1個以上のヒドロキシ部分、カルボキシ部分、ニトロキシ部分、モノサッカリド、ジサッカリド、アミン、アミド、チオール、スルフェート、スルホネート、スルホンアミドもしくはハロゲンで置換されており、ヒドロカルビルは1～8個の炭素原子を有する)である、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項4】

少なくとも R_1 又は R_2 がメチル基である、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 及び R_{10} が水素であり、 R_1 が水素であり R_2 がメチル基であるか、 R_1 がトリアセチル化モノサッカリドであり R_2 がメチル基であるか、又は R_1 がトリアセチル化モノサッカリドであり R_2 が水素であるかのいずれかである、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項6】

薬学的に許容できる担体をさらに含み、前記化合物がメイソインジゴである、請求項1～5のいずれかに記載の組成物。

【請求項7】

前記化合物の用量が 5 m g ~ 1 5 0 m g である、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 8】

前記化合物の用量が約 2 5 m g、5 0 m g、7 5 m g、及び 1 0 0 m g からなる群から選択される、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記化合物の用量が、前炎症性サイトカインの発現を阻害することによって又は抗炎症性サイトカインの発現を刺激することによって又はこれら双方によって炎症関連疾患を治療するに足る量であるが、その量は、C D K 2、C D K 4 及び C D K 6 からなる群から選択されるサイクリン依存性キナーゼ (C D K) の 5 0 % を阻害するに足る量より少ない、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 1 0】

抗炎症薬をさらに含む請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 1 1】

抗炎症薬が、鎮痛薬；抗リウマチ薬；胃腸薬；痛風用製剤；グルココルチコイド；眼科用製剤；呼吸器薬；鼻用製剤；及び粘膜薬からなる群から選ばれる、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

鎮痛薬が、ナプロキセン、インドメタシン、イブプロフェン、ケトロラクトロメタミン、コリンマグネシウムトリサリチル酸及びロフェコキシブからなる群から選られ；抗リウマチ薬が、シクロスポリン、スルファサラジン、バルデコキシブ、ペニシラミン及びデキサメタゾンからなる群から選られ；胃腸薬が、メサラミン、バルサラジド二ナトリウム及びオルサラジンナトリウムからなる群から選られ；痛風用製剤がスリダクであり；グルココルチコイドが、デキサメタゾン、リン酸デキサメタゾン、酢酸メチルプレドニゾン、ヒドロコルチゾン及びリン酸ヒドロコルチゾンナトリウムからなる群から選られ；鼻用製剤が、ジプロピオン酸ベクロメタゾンー水和物、プロピオン酸フルチカゾン、トリアムシノロンアセトニド、フルニソリド、フランカルボン酸モメタゾンー水和物及びブデソニドからなる群から選られ；眼科用製剤がケトロラクトロメタミンであり；呼吸器薬がネドクロミルナトリウムであり；そして粘膜薬が、ジプロピオン酸アルクロメタゾン、酪酸ヒドロコルチゾン、フルランドレノリド、吉草酸ベタメタゾン及びプロピオン酸クロベタゾールからなる群から選ばれる、請求項 1 1 に記載の組成物。