

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-518381(P2005-518381A)

【公表日】平成17年6月23日(2005.6.23)

【年通号数】公開・登録公報2005-024

【出願番号】特願2003-554096(P2003-554096)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/352	(2006.01)
A 6 1 K	9/06	(2006.01)
A 6 1 K	9/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/07	(2006.01)
A 6 1 K	31/122	(2006.01)
A 6 1 K	31/164	(2006.01)
A 6 1 K	31/335	(2006.01)
A 6 1 K	31/355	(2006.01)
A 6 1 K	31/375	(2006.01)
A 6 1 K	31/593	(2006.01)
A 6 1 K	31/7048	(2006.01)
A 6 1 K	36/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	17/16	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	39/06	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/352
A 6 1 K	9/06
A 6 1 K	9/12
A 6 1 K	31/07
A 6 1 K	31/122
A 6 1 K	31/164
A 6 1 K	31/335
A 6 1 K	31/355
A 6 1 K	31/375
A 6 1 K	31/593
A 6 1 K	31/7048
A 6 1 K	35/78
A 6 1 K	47/22
A 6 1 P	3/10
A 6 1 P	9/00
A 6 1 P	9/10

C

A 6 1 P 17/14
 A 6 1 P 17/16
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/02 1 0 1
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 39/06
 A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月7日(2005.11.7)

【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】

小径繊維神経障害（ニューロパシー）若しくは糖尿病性神経障害を治療するための組成物であって、小径線維神経障害若しくは糖尿病性神経障害を治療するために治療上有効な量の抗酸化作用を有するフラボノイドと、小径線維神経障害若しくは糖尿病性神経障害を治療するために治療上有効な量のビタミンD₃、1,25-ジヒドロキシビタミンD₃、1(S),3(R)-ジヒドロキシ-20(R)-(1-エトキシ-5-エチル-5-ヒドロキシ-2-ヘプチン-1-イル)-9,10-セコ-プレグナ-5(Z),7(E),10(19)-トリエン(1(S),3(R)-dihydroxy-20(R)-(1-ethoxy-5-ethyl-5-hydroxy-2-heptyn-1-yl)-9,10-seco-pregna-5(Z),7(E),10(19)-triene、それらの薬学的に許容され得る塩、及びそれらの混合物から選択される成分と、許容され得る担体とから調合される混合物から成る組成物。

【請求項2】

請求項1の組成物であって、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、(-)-エピガロカテキン;(-)-エピガロカテキン-ガラート;1,2,3,6-テトラ-o-ギャロール-d-グルコース(1,2,3,6-tetra-o-gallyol-d-glucos);2'-o-アセチルアセトシド;3,3',4-トリ-o-メチル-エラグ酸;6,3',4'-トリヒドロキシ-5,7,8-トリメトキシフラボン(6,3',4'-trihydroxy-5,7,8-trimethoxyflavone);6-ヒドロキシ-ルテオリン(6-hydroxy-luteolin);6-ヒドロキシケンフェロール-3,6-ジメチルエーテル(6-hydroxykaempferol-3,6-dimethylether);7-o-アセチル-8-エピ-ロガニク酸(7-o-acetyl-8-epi-loganic acid);アカセチン(acacetin);アセトシド(acetoside);アセチルトリサルフェートケルセチン(acetyltrisulfatequercetin);アメントフラボン(amentoflavone);アピゲニン(apigenin);アピイン(apiin);アストラガリン(astragaline);アビクラリン(avicularin);アキシラリン(axillarlin);バイカレン(baicalin);ブラジリン(brazilin);ブレビフォリン(brevifolin);カルボン酸(carboxylic acid);カリオフィレン(caryophyllene);カテキン(catechins);クリシン(chrysin);クリシン-5,7-ジヒドロキシフラボン(chrysin-5,7-dihydroxyflavone);クリソエリオール(chryso

eriol); クリソスプレノール (chrysosplenol); クリソスプレノシド - a (chrysosplenoside - a); クリソスプレノシド - d (chrysosplenoside - d); コスモシン (cosmosiin); - カジネン (- cadinene); クルクミン (curcumin); ジヒドロケルセチン (dihydroquercetin); ジメチルムッサエノシド (dimethylmussaenoside); ジアセリルサーシマリチン (diacerylcirsimaritin); ジオスメチン (diosmetin); ドスメチン (dosmetin); エビニン (ebinin); エピカテキン (epicatechin); エチルブレビフォリンカルボキシレート (ethylbrevifolincarboxylate); フラボカンニビシド (flavocannibiside); フラボサチバシド (flavosativaside); ゲニステイン (genistein); ギンコフラボングリコシド (ginkgo flavone glycosides); ギンコヘテロシド (ginkgo heterosides); ゴシペチン (gossypetin); ゴシペチン - 8 - グルコシド (gossypetin - 8 - glucoside); ヘマトキシリン (haematoxylin); ヘスペルジン (hesperidine); ヒスピデュロシド (hispiduloside); ハイペリン (hyperin); インドール (indole); イリジン (iridine); イソリクイレチゲニン (isoliquiritigenin); イソリクイリチン (isoliquiritin); イソクエルチトリン (isoquercitrin); ジオノシド (jionoside); ジュグラニン (juglanin); ケンフェロール (kaempferol); ケンフェロール - 3 - ラムノシド (kaempferol - 3 - rhamnoside); ケンフェロール - 3 - ネオヘスペリドシド (kaempferol - 3 - neohesperidoside); コラビロン (kolaviron); リクラシド (licuraside); リナリン (linarin); リナリン (linarin); ロニセリン (lonicerin); ルテオリン (luteolin); ルテオリン - 7 - グルコシド (luteolin - 7 - glucoside); ルテオリン - 7 - グルコロニド (luteolin - 7 - glucoronide); マクロカルパル - a (macrocarpal - a); マクロカルパル - b (macrocarpal - b); マクロカルパル - d (macrocarpal - d); マクロカルパル - g (macrocarpal - g); マニフラボン (maniflavone); モリン (morin); メチルスクテラレイン (methylscutellarein); ミリセチン (myricetin); ナリングニン (naringenin); ナリンジン (naringin); ネルモボシド (nelumboside); ネペチン (nepetin); ネペトリン (nepetrin); ネロリドール (nerolidol); オリゴメリックプロアントシアニジン (oligomeric proanthocyanidins); オキシアヤニン - a (oxyayanin - a); ペクトリナリゲニン (pectolinarigenin); ペクトリナリン (pectolinarin); 緑茶ポリフェノールを含むポリフェノール; ケルセタゲチン (quercetageetin); ケルセチン (quercetin); クエルシメルトリン (quercimertrin); クエルシトリン (quercitrin); クエルシトリル - 2 "アセテート (quercitryl - 2 "acetate); レイノウトリン (reynoutrin); ラムネチン (rhamnetin); ロイフォリン (rhoifolin); ルチン (rutin); スクテラレイン (scutellarein); シデリトフラボン (sideritoflavone); シリピン (silibin); シリダイアニン (silydianin); シリクリスチン (silychristine); シリマリン (silymarin); ソフォリコシド (sophoricoside); ソルバリン (sorbarin); スピレオシド (spiraeoside); トリフォリン (trifolin); ビテキシン (vitexin); オウゴン (wogonin); 緑茶成分; 及びそれらの薬学的に許容され得る塩から成るグループから選択される。

【請求項 3】

請求項 1 の組成物において、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、(-) - エピガ

ロカテキン - 3 - カリウム酸塩；カテキン (catechins)；ルチン (rutin)；ケルセチン (quercetin)；ケルシトリン (quercitrin)；ミリセチン (myricetin)；ケンフェロール (kaempferol)；ミルセトリン (myrecetrin)；ルテオリン (luteolin)；モリン (morin)；フィセチン (fisetin)；シリマリン (silymarin)；アピゲニン (apigenin)；ヘスペリチン (hesperitin)；ヘスペリジン (hesperidin)；シトリン (citric acid)；ゴシベチン (gossypetin)；クリシン (chrysin)；オリゴマリックプロアントシアニジン (oligomeric proanthocyanidins)；ポリフェノール (polyphenols)；ピアカレイン (biacalein)；クルクミン (curcumin)；エピカテキン (epicatechin)；ジヒドロキナゾリン (dihydroquercetin)；ギンナン・フラボン配糖体；ギンナンヘテロシド (ginkgo heterosides)；シリピン (silibin)；シリデアニン (silydianin)；シリクリスチン (silychristine)；緑茶成分；及びそれらの薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 4】

請求項 1 の組成物において、抗酸化作用を有するフラボノイドは、ケルセチン (quercetin)；ケルシトリン (quercitrin)；ミリセチン (myricetin)；ルチン (rutin)；ケンフェロール (kaempferol)；ミルセトリン (myrecetrin)；ガラングイン (galangin)；モノヒドロキシエチルルトシド (monoHER)；ジヒドロキシエチルルトシド (diHER)；トリヒドロキシエチルルトシド (triHER)；テトラヒドロキシエチルルトシド (tetraHER)；ナリンゲニン (naringenin)；ナリンジン (naringin)；タクフォリン (taxufolin)；ジオスミン (diosmin)；フロレチン (phloretin)；フロリドジン (phloridzin)；シアニジン (cyanidin)；ペラルゴニジン (pelargonidin)；緑茶成分；及びその薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 5】

請求項 1 の組成物において、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、ケルセチン (quercetin)、ケルシトリン (quercitrin)、ミリセチン (myricetin)、ルチン (rutin)、ケンフェロール (kaempferol)、ミルセトリン (myrecetrin)、緑茶成分、及びそれらの薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 6】

請求項 1 の組成物において、非フラボノイド抗酸化化合物は、アスコビル・パルミタート、アスコルビン酸、ビタミン A、ビタミン E 及びその薬学的に許容され得るエステル；- リポ酸、コエンザイム Q10、グルタチオン、緑茶成分、及びそれらの薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれかの組成物において、前記薬学的に許容され得る担体は、D - パンテノール及び DL - パンテノールから選択される十分な量のパンテノールを有し、前記組成物の 1 若しくはそれ以上の成分を皮膚中に浸透させることを促進する。

【請求項 8】

請求項 7 の組成物において、前記組成物は、保湿剤、DL - パンテノール、ケルセルチン、及びビタミン D₃ を有する。

【請求項 9】

請求項 7 の組成物において、前記組成物は、親水性軟膏基剤と、組成物 1 ポンドにつき 2 ~ 100 g の L - ピロリドンカルボン酸ナトリウムと、組成物 1 ポンドにつき 1 ~ 10 cc の DL - パンテノールと、組成物 1 ポンドにつき 10 g ~ 50 g のケセルチンと、ビタミン D₃、1, 25 - ジヒドロキシビタミン D₃、1 (S), 3 (R) - ジヒドロキシ

- 20 (R) - (1 - エトキシ - 5 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 2 - ヘプチン - 1 - イル) - 9, 10 - セコ - プレグナ - 5 (Z), 7 (E), 10 (19) - トリエン、それらの薬学的に許容され得る塩、及びそれらの混合物から選択される200 ~ 3,000,000国際単位 (International Units) の成分とを有する。

【請求項10】

小径線維神経障害若しくは糖尿病性神経障害を治療するための薬剤製造のための組成物の使用であって、前記組成物は、治療上有効な量の抗酸化作用を有するフラボノイドと、ビタミンD₃、1,25 - ジヒドロキシビタミンD₃、1 (S), 3 (R) - ジヒドロキシ - 20 (R) - (1 - エトキシ - 5 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 2 - ヘプチン - 1 - イル) - 9, 10 - セコ - プレグナ - 5 (Z), 7 (E), 10 (19) - トリエン (1 (S), 3 (R) - dihydroxy - 20 (R) - (1 - ethoxy - 5 - ethyl - 5 - hydroxy - 2 - heptyn - 1 - yl) - 9, 10 - seco - pregnane - 5 (Z), 7 (E), 10 (19) - triene、それらの薬学的に許容され得る塩、及びそれらの混合物から選択される成分の治療上有効な量と、許容され得る担体とから調合される混合物から成る。

【請求項11】

請求項10の使用について、小径線維神経障害若しくは糖尿病性神経障害の全身的な作用が治療される。

【請求項12】

請求項10の使用において、小径線維神経障害若しくは糖尿病性神経障害の局所的な作用が治療される。

【請求項13】

請求項10の使用において、前記使用は、傷みの減少、ひりひり痛の減少、寒熱に対する感覚の正常化、痙攣の減少、筋肉衰弱の減少、痺れの減少、髪抜の減少、損傷した神経の再形成、及び新たな神経の形成から選択される効果を提供する。

【請求項14】

請求項10の使用について、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、(-) - エピガロカテキン; (-) - エピガロカテキン - カリウム酸塩; 1, 2, 3, 6 - テトラ - o - ギャロル - d - グルコース; 3, 3', 4 - トリ - o - メチル - カリウム酸塩; 2' - o - アセチルアセトシド; 6, 3', 4' - トリヒドロキシ - 5, 7, 8 - トリメトキシフラボン; 6 - ヒドロキシ - ルテオリン; 6 - ヒドロキシケンフェロール - 3, 6 - ジメチルエーテル; 7 - o - アセチル - 8 - エピ - ロガニック酸; アカセチン (acacetin); アセトシド; アセチルトリサルフェートケルセチン; アメントフラボン; アピゲニン; アピイン; アストラガリン; アピクラリン; アキシラリン; バイカレン; ブラジリン; プレビフォルン; カルボン酸; カリオフィレン; カテキン; クリシン; クリシン - 5, 7 - ジヒドロキシフラボン; クリソエリオール; クリソスプレノール; クリソスプレノシド - a; クリソスプレノシド - d; コスモシイン; - カジネン; クルクミン; シアニジン; ジヒドロケルセチン; ジメチルムッサエノシド; ジアセリルサーシマリチン; ジオスミン; ジオスメチン; ドスメチン; エピニン; エピカテキン; エチルプレビフォルンカルボキシレート; フラボカンニビシド; フラボサチバシド; ガランジン; ゲニスチン; ギンコフラボングリコシド; ギンコヘテロシド; ゴシペチン; ゴシペチン - 8 - グルコシド; ヘマトキシチン; ヘスペルジン; ヒスピデュロシド; ハイペリン; インドール; イリジン; イソリクイレチゲニン; イソリクイリチン; イソクエルチトリン; ジオノシド; ジュグラニン; ケンフェロール; ケンフェロール - 3 - ラムノシド; ケンフェロール - 3 - ネオヘスペリドシド; コラピロン; リクラシド; リナリイン; リナリン; ロニセリン; ルテオリン; ルテオリン - 7 - グルコシド; ルテオリン - 7 - グルコロニド; マクロカルパル - a; マクロカルパル - b; マクロカルパル - d; マクロカルパル - g; マニフラボン; モリン; メチルスクテラレイン; モノヒドロキシエチルルトシド、ジヒドロキシエチルルトシド、トリヒドロキシエチルルトシド、テトラヒドロキシエチルルトシド、ミリセチン; ナリンゲニン; ナリンジン; ネルモボシド; ネペチン; ネペトリン; ネロリドール; オリゴメリックプロアントシアニン; オキシアヤニン - a; ペクトリナリゲニン; ペクト

リナリン；ペラルゴニジン；フロレチン；フロリジン；ケルセタゲチン；ケルセチン；クエルシメルトリン；クエルシトリン；クエルシトリル - 2 "アセテート；レイノウトリン；ラムネチン；ロイフォリン；ルチン；スクテラレイン；シデリトフラボン；シリピン；シリダイアニン；シリクリスチン；シリマリン；ソフォリコシド；ソルパリン；スピレオシド；タクフォリン；トリフォリン；ピテキシン；オウゴニン；緑茶の成分；及びそれらの薬学的に許容され得る塩から成るグループから選択される。

【請求項 15】

請求項 10 の使用において、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、(-) - エピガロカテキン - 3 - カリウム酸塩；カテキン (catechins)；ルチン (rutin)；ケルセチン (quercetin)；ケルシトリン (quercitrin)；ミリセチン (myricetin)；ケンフェロール (kaempferol)；ミルセトリン (myrecetrin)；ルテオリン (luteolin)；モリン (morin)；フィセチン (fisetin)；シリマリン (silymarin)；アピゲニン (apigenin)；ヘスペリチン (hesperitin)；ヘスペリジン (hesperidin)；シトリン (citrin)；ゴシペチン (gossypetin)；クリシン (chrysin)；オリゴマリックプロアントシアニジン (oligomeric proanthocyanidins)；ポリフェノール (polyphenols)；ピアカレイン (biacalein)；クルクミン (curcumin)；エピカテキン (epicatechin)；ジヒドロキナゾリン (dihydroquercetin)；ギンナン・フラボン配糖体；ギンナンヘテロシド (ginkgo heterosides)；シリピン (silibin)；シリデアニン (silydianin)；シリクリスチン (silychristine)；緑茶成分；及びそれらの薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 16】

請求項 10 の使用において、抗酸化作用を有するフラボノイドは、ケルセチン (quercetin)；ケルシトリン (quercitrin)；ミリセチン (myricetin)；ルチン (rutin)；ケンフェロール (kaempferol)；ミルセトリン (myrecetrin)；ガラングイン (galangin)；モノヒドロキシエチルルトシド (monoHER)；ジヒドロキシエチルルトシド (diHER)；トリヒドロキシエチルルトシド (triHER)；テトラヒドロキシエチルルトシド (tetraHER)；ナリンゲニン (naringenin)；ナリンジン (naringin)；タクフォリン (taxufolin)；ジオスミン (diosmin)；フロレチン (phloretin)；フロリドジン (phloridzin)；シアニジン (cyanidin)；ペラルゴニジン (pelargonidin)；緑茶成分；及びその薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 17】

請求項 10 の使用において、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、ケルセチン (quercetin)、ケルシトリン (quercitrin)、ミリセチン (myricetin)、ルチン (rutin)、ケンフェロール (kaempferol)、ミルセトリン (myrecetrin)、緑茶成分、及びそれらの薬学的に許容され得る塩とから成るグループから選択される。

【請求項 18】

請求項 10 の使用において、前記抗酸化作用を有するフラボノイドは、緑茶成分を有する。

【請求項 19】

請求項 10 ~ 18 のいずれかの使用において、前記許容され得る担体は、D - パンテノール及び DL - パンテノールから選択される十分な量のパンテノールを有し、前記組成物の 1 若しくはそれ以上の成分を皮膚中に浸透させることを促進する。

【請求項 20】

請求項 10 ~ 19 のいずれかの使用において、前記許容され得る担体は十分な量の少な

くとも1つの非U・S・P親水性軟膏基剤を有し、実質的に局所的な組成物を形成する。

【請求項21】

請求項10の使用において、小径線維神経若しくは糖尿病性神経の治療は、皮膚の発赤を減らすか若しくは防ぐ、皮膚の変色を減らすか若しくは防ぐ、皮膚を美しくする、皮膚の外観を改善する、皮膚の魅力効果を進める、皮膚をクレンジングする、皮膚から死んでいるか損傷を受けている皮膚または皮膚細胞を除去する、および皮膚に潤いを与えることのうち少なくとも1つの効果を有する。

【請求項22】

請求項21の使用において、前記組成物は、保湿剤、DL-パンテノール、ケルセルチン、及びビタミンD₃を有する。

【請求項23】

請求項10の使用において、前記組成物は、親水性軟膏基剤と、組成物1ポンドにつき2～100gのL-ピロリドンカルボン酸ナトリウムと、組成物1ポンドにつき1～10ccのDL-パンテノールと、組成物1ポンドにつき10g～50gのケセルチンと、ビタミンD₃、1,25-ジヒドロキシビタミンD₃、1(S),3(R)-ジヒドロキシ-20(R)-(1-エトキシ-5-エチル-5-ヒドロキシ-2-ヘプチン-1-イル)-9,10-セコ-プレグナ-5(Z),7(E),10(19)-トリエン、それらの薬学的に許容され得る塩、及びそれらの混合物から選択される200～3,000,000国際単位(International Units)の成分とを有する。