



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 103479645 A

(43) 申请公布日 2014. 01. 01

(21) 申请号 201310476144. X

(22) 申请日 2013. 10. 14

(71) 申请人 南京正亮医药科技有限公司

地址 211300 江苏省南京市高淳区经济开发
区古檀大道 3 号科创大楼 812 室

(72) 发明人 不公告发明人

(51) Int. Cl.

A61K 31/56(2006. 01)

A61P 1/00(2006. 01)

权利要求书1页 说明书2页

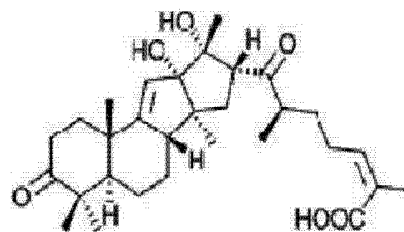
(54) 发明名称

Kadcoccitones A 在制备治疗促进小肠蠕动
药物中的应用

(57) 摘要

本发明涉及 Kadcoccitones A 在制备促
进小肠蠕动药物中的应用, 从药理实验看出,
Kadcoccitones A 有较好的促进小肠蠕动的作用,
本发明涉及的 Kadcoccitones A 在制备促进小肠
蠕动药物中的用途属于首次公开, 属于全新的骨
架类型, 而且其促进小肠蠕动活性强, 具备突出的
实质性特点, 同时用于制备促进小肠蠕动药物显
然具有显著的进步。

1.Kadcoccitones A在制备治疗促进小肠蠕动药物中的应用,所述化合物Kadcoccitones A结构如式(I)所示:



式(I)。

Kadcoccitones A 在制备治疗促进小肠蠕动药物中的应用

技术领域

[0001] 本发明涉及化合物 Kadcoccitones A 的新用途,尤其涉及 Kadcoccitones A 在制备治疗促进小肠蠕动药物中的应用。

背景技术

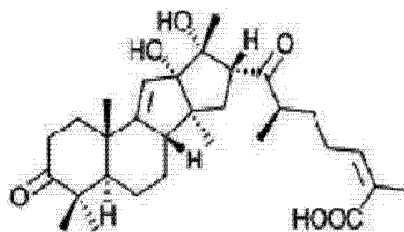
[0002] 本发明涉及的化合物 Kadcoccitones A 是一个 2012 年发表(Cheng-Qin Liang, et al., Kadcoccitones A and B, Two New 6/6/5/5-Fused Tetracyclic Triterpenoids from Kadsura coccinea. Organic Letters, 2012, 14(24):6362 - 6365.) 的新化合物,该化合物拥有全新的骨架类型,目前的用途仅仅涉及抑制艾滋病毒,对多种肿瘤无效,(Cheng-Qin Liang, et al., Kadcoccitones A and B, Two New 6/6/5/5-Fused Tetracyclic Triterpenoids from Kadsura coccinea. Organic Letters, 2012, 14(24):6362 - 6365.), 本发明涉及的 Kadcoccitones A 在制备治疗促进小肠蠕动药物中的用途属于首次公开。

发明内容

[0003] 本发明提出 Kadcoccitones A 在制备促进小肠蠕动药物中的应用。从药理实验看出, Kadcoccitones A 有较好的促进小肠蠕动的作用。可以用于多种小肠蠕动不良疾病的治疗。由于本发明首次公开 Kadcoccitones A 在促进小肠蠕动方面的药理作用。

[0004] 所述化合物 Kadcoccitones A 结构如式(I)所示:

[0005]



式(I)

[0006] 本发明通过对小鼠的药理对比试验发现, Kadcoccitones A 低剂量组小鼠的小肠推进性蠕动较空白组有所增加,差异有显著性意义($P < 0.01$); Kadcoccitones A 高剂量组较空白组,差异有显著性意义。因此, Kadcoccitones A 用于制备多种小肠蠕动不良疾病的药物,具有良好的开发应用前景。

[0007] 以下通过实施例对本发明作进一步详细的说明,但本发明的保护范围不受具体实施例的任何限制,而是由权利要求加以限定。

具体实施方式

[0008] 本发明所涉及化合物 Kadcoccitones A 的制备方法参见文献(Cheng-Qin Liang, et al., Kadcoccitones A and B, Two New 6/6/5/5-Fused Tetracyclic Triterpenoids from Kadsura coccinea. Organic Letters, 2012, 14(24): 6362 - 6365.)

[0009] 以下通过实施例对本发明作进一步详细的说明,但本发明的保护范围不受具体实施例的任何限制,而是由权利要求加以限定。

[0010] 实施例 1: 本发明所涉及化合物 Kadcoccitones A 片剂的制备:

[0011] 取 5 克化合物 Kadcoccitones A, 加入糊精 195 克, 混匀, 常规压片制成 1000 片。

[0012] 实施例 2: 本发明所涉及化合物 Kadcoccitones A 胶囊剂的制备:

[0013] 取 5 克化合物 Kadcoccitones A, 加入淀粉 195 克, 混匀, 装胶囊制成 1000 粒。

[0014] 下面通过药效学实验来进一步说明其药物活性。

[0015] 实验例 1: 采用药理实验法评价化合物 Kadcoccitones A 对小肠推动性蠕动的影
响

[0016] 1、方法: 取昆明小鼠 30 只, $20 \pm 5\text{g}$, 南京中医药大学实验动物中心, 雌雄各半, 按性别, 体重随机分为 3 组, 即空白组, Kadcoccitones A ($0.06\text{mg}/10\text{g}$, $0.24\text{mg}/10\text{g}$) 两个剂量组。每组 10 只, Kadcoccitones A 与 5% 炭末、10% 阿拉伯胶制成混悬液, 空白组不加药物直接给炭末、阿拉伯胶混悬, 均用生理盐水配制。实验前小鼠禁食 24 小时。小鼠灌胃给药 $0.2\text{ml}/10\text{g}$, 给药后 30min 处死。取幽门至回盲部消化管, 不加牵引地平铺与薄板上, 测全长及幽门至炭末前沿的距离, 由此推算出推进百分率。

[0017] 2. 结果: 统计结果表明 Kadcoccitones A 低剂量组小鼠的小肠推进性蠕动较空白组有所增加, 差异有显著性意义 ($P < 0.01$); Kadcoccitones A 高剂量组较空白组, 差异有显著性意义 ($P < 0.001$) 结果如表 1。

[0018]

表 1 Kadcoccitones A 对小鼠小肠推进性蠕动的影响 ($\bar{x} \pm s$)

组别	推进率 (%)
空白组	54.92 ± 6.81
本发明低剂量组	$62.47 \pm 8.52^*$
本发明高剂量组	$69.54 \pm 8.27^{**}$

[0019] 与空白组比较, $^{**}P < 0.001$, $^*P < 0.01$

[0020] 由上述实验例表明, 本发明的 Kadcoccitones A 低剂量组小鼠的小肠推进性蠕动较空白组有所增加, 差异有显著性意义 ($P < 0.01$); Kadcoccitones A 高剂量组较空白组, 差异有显著性意义。由此证明, 本发明的 Kadcoccitones A 有较好的促进小肠蠕动的作用。可以用于多种小肠蠕动不良疾病的治疗。