



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2008152751/04, 06.06.2007

(30) Конвенционный приоритет:
06.06.2006 US 60/804,067

(43) Дата публикации заявки: 20.07.2010 Бюл. № 20

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 11.01.2009(86) Заявка РСТ:
СА 2007/001008 (06.06.2007)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/140611 (13.12.2007)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. А.В.Мицу, рег.№ 364

(71) Заявитель(и):

АНТИБ ТЕРАПЬЮТИКС ИНК. (СА)

(72) Автор(ы):

УОЛЛЭЙС Джон Л. (СА),
ЧИРИНО Джузеппе (ИТ),
САНТАГАДА Винченцо (ИТ),
КАЛЕНДО Джузеппе (ИТ)

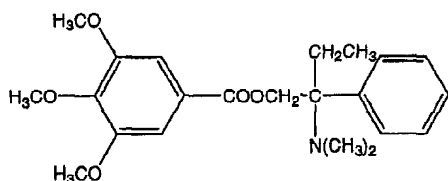
(54) СОЛИ ТРИМЕБУТИНА И N-ДЕСМЕТИЛТРИМЕБУТИНА

(57) Формула изобретения

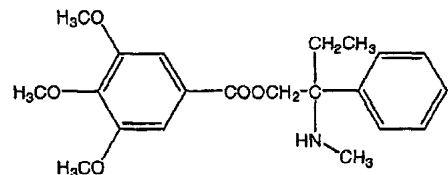
1. Соединение общей формулы:



где А представляет собой



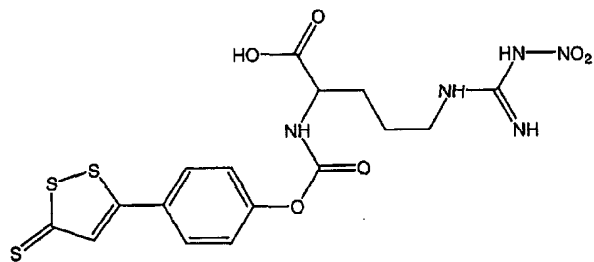
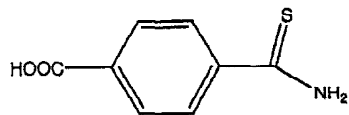
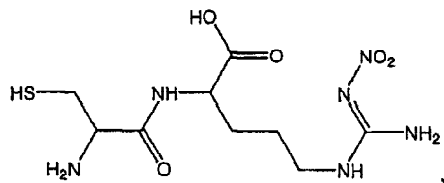
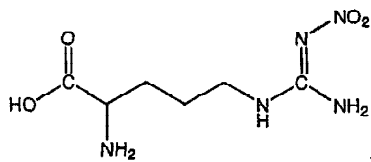
ИЛИ



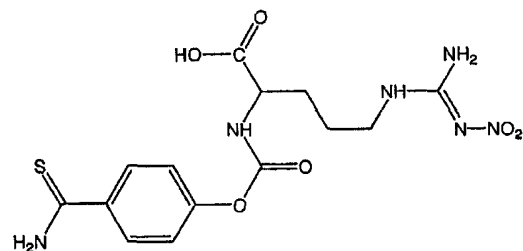
и их стереоизомеры;

и X представляет собой фрагмент, высвобождающий NO, H₂S или комбинацию NO и H₂S.

2. Соединение по п.1, где фрагмент X выбран из группы, состоящей из:



И



3. Соединение по п.2, где соединение представляет собой аргининат тримебутина.
4. Соединение по п.2, где соединение представляет собой цистеинил-нитроаргининат тримебутина.
5. Соединение по п.2, где соединение представляет собой тиокарбамоилбензоат тримебутина.
6. Соединение по п.2, где соединение представляет собой 5-фенил-1,2-дителион-3-тион-нитроаргининат тримебутина.
7. Соединение по п.2, где соединение представляет собой п-гидрокситиобензамид-нитроаргининат тримебутина.
8. Соединение по п.2, где соединение представляет собой нитроаргининат N-десметилтримебутина.
9. Соединение по п.2, где соединение представляет собой цистеинил-нитроаргининат N-десметилтримебутина.
10. Соединение по п.2, где соединение представляет собой тиокарбамоилбензоат N-десметилтримебутина.
11. Соединение по п.2, где соединение представляет собой 5-фенил-1,2-дителион-3-тион-нитроаргининат N-десметилтримебутина.
12. Соединение по п.2, где соединение представляет собой п-гидрокситиобензамид-нитроаргининат N-десметилтримебутина.
13. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по любому из пп.1-10, а также фармацевтически приемлемый наполнитель или носитель.
14. Способ лечения висцеральной боли у субъекта, нуждающегося в таком лечении,

включающий введение субъекту соединения по любому из пп.1-10 в количестве, облегчающем висцеральную боль.

15. Способ по п.14, где висцеральная боль является абдоминальной болью.

16. Способ по п.15, где причиной абдоминальной боли являются желудочно-кишечные заболевания, такие как воспалительное заболевание кишечника (IBD), синдром раздраженного кишечника (IBS), диабетический гастропарез и диспепсия.

17. Соединение, имеющее общую формулу нитроаргинин-R, где R представляет собой фрагмент, высвобождающий H_2S , предназначенное для получения солей тримебутина и N-монодесметилтримебутина.

18. Соединение по п.17, где заместитель R выбран из группы, состоящей из 5-п-гидроксифенил-1,2-дитион-3-тиона, цистеина и 4-(тиокарбамоил)бензойной кислоты.

19. Применение соединения по пп.1-10 с целью получения лекарственного средства, предназначенного для лечения висцеральной боли у субъекта, нуждающегося в таком лечении.

20. Применение по п.19, где висцеральная боль является абдоминальной болью.

21. Применение по п.20, где причиной абдоминальной боли являются желудочно-кишечные заболевания, такие как воспалительное заболевание кишечника (IBD), синдром раздраженного кишечника (IBS), диабетический гастропарез и диспепсия.