



SUOMI – FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21)	Patenttihakemus - Patentansökan	20002103
(51)	Kv.lk.7 - Int.kl.7	
	A61K 31/435, C07D 215/42, C07C 235/42	
(22)	Hakemispäivä - Ansökningsdag	25.09.2000
(24)	Alkupäivä - Löpdag	23.03.1999
(41)	Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	17.11.2000
(86)	Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/JP99/01462
(32) (33) (31)	Etuoikeus - Prioritet	
	26.03.1998 JP 10-100029 P	

(71) Hakija - Sökande

1 •Japan Tobacco Inc., 2-1, Toranomon 2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422, JAPANI, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1 •Shinkai,Hisashi, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc. 1-1, Murasaki-cho, Takatsuji-shi, Osaka 569-1125, JAPANI, (JP)

2 •Ito,Takao, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc. 1-1, Murasaki-cho, Takatsuji-shi, Osaka 569-1125, JAPANI, (JP)

3 •Yamada,Hideki, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc. 1-1, Murasaki-cho, Takatsuji-shi, Osaka 569-1125, JAPANI, (JP)

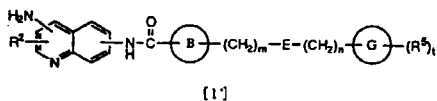
(74) Asiamies - Ombud: Berggren Oy Ab
Jaakonkatu 3 A, 00100 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**Amidijohdannaisia ja nosiseptiiniantagonisteja
Amidderivat och nociceptinagonister**

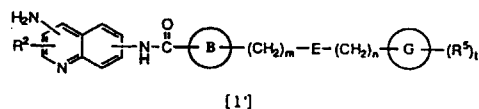
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Esillä oleva keksintö liittyy yhdisteeseen, jolla on kaava [1']



jossa R² on mahdollisesti hydroksilla, aminolla ja muilla näitä vastaavilla ryhmillä substituoitu alempi alkyyli, rengas B on fenyyl, tienyyli ja jokin muu näitä vastaava ryhmä, E on yksinkertainen sidos, -O-, -S- ja jokin muu näitä vastaava rakenne, rengas G on aryyli, heterosyklinen ryhmä ja jokin muu näitä vastaava ryhmä, R⁵ on halogeeniatomi, hydroksi, mahdollisesti halogeeniatomilla ja muilla vastaavilla ryhmillä substituoitu alempi alkyyli, ja jokin muu näitä vastaava ryhmä, t on 0 tai alueelta 1 - 5 oleva kokonaisluku, silloin kun t on alueelta 2 - 5 oleva kokonaisluku voi kukin R⁵ olla samanlainen tai toisistaan poikkeava, m on 0 tai alueelta 1 - 8 oleva kokonaisluku ja n on 0 tai alueelta 1 - 4 oleva kokonaisluku, ja aktiivisena ainesosana yhdistettä [1'] sisältävään nosiseptiiniantagonistiin. Yhdisteellä [1'] esiintyy nosiseptiin suhteen antagonistisen vaikutuksen johdosta kipua lievittävä vaikutus pistävää kipua, kuten leikkauksen jälkeistä kipua ja jotakin muuta tätä vastaavaa kipua vastaan. Esillä oleva keksintö liittyy myös tietyn amidijohdannaisen, joihin yhdiste [1'] kuuluu, käyttö nosiseptiiniantagonistina tai kipulääkkeenä.

Föreliggande uppfinning anknyter sig till en förening av formeln [1']



där R² är lägre alkyl, möjligen substituerad med hydroxi, amino och liknande, ringen B är fenyli, tienyli och liknande, E är en enkel bindning, -O-, -S- och liknande, ringen G är aryl, en heterocyklisk grupp och liknande, R⁵ är en halogeenatom, hydroxi, lägre alkyl möjligen substituerad med en halogeenatom etc., och liknande, t är 0 eller ett heltal av 1 - 5, när t är ett heltal av 2 - 5, kan varje R⁵ vara lika eller olika, m är 0 eller ett heltal av 1 - 8, och n är 0 eller ett heltal av 1 - 4, och till en nociceptinantagonist, som innehåller föreningen [1'] som en aktiv ingrediens. Föreningen [1'] har, beroende av den nociceptinantagonistiska funktionen, en analgetisk verkan emot en stark smärta, såsom en postoperativ smärta och liknande. Föreliggande uppfinning anknyter sig även till användning av vissa amidderivat inkluderande föreningen [1'], som en nociceptinantagonist eller som en analget.