РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2012 105 460** (13) **A**

(51) МПК
A61K 31/55 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: **2012105460/04, 16.07.2010**

Приоритет(ы):
(30) Конвенционный приоритет:
17.07.2009 US 61/271,185

(43) Дата публикации заявки: **27.08.2013** Бюл. № **24**

(85) Дата начала рассмотрения заявки PCT на национальной фазе: **17.02.2012**

(86) Заявка PCT:
IB 2010/001747 (16.07.2010)

(87) Публикация заявки PCT:
WO 2011/007247 (20.01.2011)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

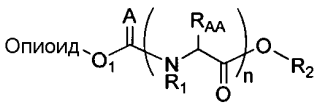
(71) Заявитель(и):
ШАЙЕ ЭлЭлСи (US)

(72) Автор(ы):
ФРАНКЛИН Ричард (GB),
ГОЛДИНГ Бернард Т. (GB),
ТАЙСОН Роберт Дж. (GB)

(54) НОВЫЕ КАРБАМАТНЫЕ И ПЕПТИДНЫЕ ПРОЛЕКАРСТВА ОПИОИДОВ И ИХ ИСПОЛЬЗОВАНИЕ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:



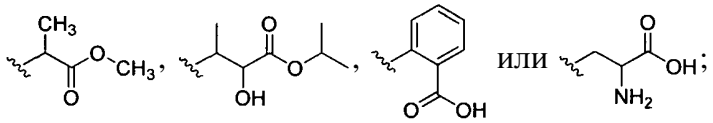
или его фармацевтически приемлемая соль, где

O_1 является кислородом гидроксила в несвязанных опиоидных молекулах,

A является кислородом или серой,

в каждом случае R_1 независимо означает водород, алкил или замещенный алкил,

R_2 является C_1-C_4-алкилом, аминокислотой, замещенной фенильной группой, замещенной алкильной группой, трет-бутилом, изопропилом, этилом, метилом,



n является целым числом от 1 до 9,

в каждом случае R_{AA} независимо означает боковую цепь протеиногенной или непротеиногенной аминокислоты,

и опиоид выбран из группы, состоящей из буторфанола, бупренорфина, кодеина,

RU 2012105460 A

RU 2012105460 A

дезоцина, дигидрокодеина, гидроморфона, леворфанола, мептазинола, морфина, нальбуфина, оксикодона, оксиморфона, пентазоцина и их активных метаболитов.

2. Соединение по п.1, отличающееся тем, что R_2 является серином или треонином.

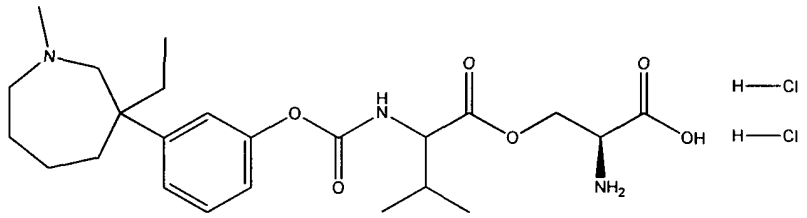
3. Соединение по п.1, отличающееся тем, что A является O, R_1 представляет собой водород, R_2 является серином или треонином, и n=1.

4. Соединение по п.1, отличающееся тем, что R_{AA} означает аминокислотную боковую цепь валина.

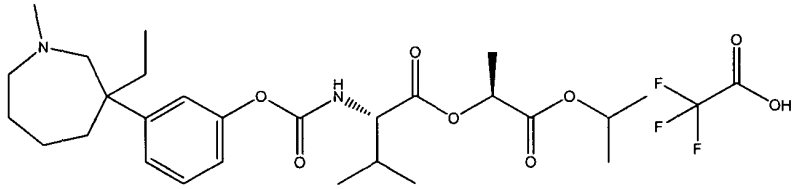
5. Соединение по п.1, отличающееся тем, что опиоидом является мептазинол, A является кислородом, R_1 представляет собой водород, R_{AA} является боковой цепью или валином, n=1, и R_2 представляет собой серин.

6. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по п.5 и фармацевтически приемлемый наполнитель.

7. Соединение по п.5, содержащее дигидрохлоридную соль, представленную формулой:



8. Соединение, представленное формулой:



9. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по п.8 и фармацевтически приемлемый наполнитель.

10. Применение соединения по п.1 для снижения болевых симптомов у пациента, страдающего болью.

RU 2012105460 A

RU 2012105460 A