



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 963252

(51) Kv.lk.6 - Int.cl.6

C 07K 5/107

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 20.08.96

(24) Alkupäivä - Löpdag 15.02.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 20.08.96

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/SE95/00158

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

21.02.94 GB 9403263 P

25.04.94 GB 9408179 P

03.05.94 SE 9401519 P

(71) Hakija - Sökande

1. Astra Aktiebolag, 151 85 Södertälje, Sverige, (SE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Brown, William, 756, St-Pierre Street, Ste-Dorothee, Laval, Quebec H7X 3L8, Canada, (CA)

2. Dimaio, John, 1204 Pierre Blanchet, Montreal, Quebec H1E 4L9, Canada, (CA)

3. Schiller, Peter, Apartment 1212, 3475 Mountain Street, Montreal, Quebec H3G 2A4, Canada, (CA)

4. Martel, Rene, Apartment 301, 1150 Cote Vertu, Saint Laurent, Quebec H4L 1Y5, Canada, (CA)

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

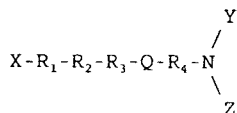
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Kivun hoitoon tarkoitettut uudet opioidipeptidit ja niiden käyttö
Nya opioidpeptider för behandling av smärta samt deras användning

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämä keksintö koskee sarjaa uusia opioidipeptidejä, jotka on tarkoitettu kivun hoitoon, ja farmaseuttisesti hyväksyttävistä koostumuksista, jotka sisältävät näitä peptidejä. Keksintö koskee myös menetelmiä kivun kontrolloimiseksi potilailla keksinnön mukaisia koostumuksia käyttämällä. Keksinnön mukaisilla peptideillä on suuri selektiivisyysaste μ -opioidireseptorille. Nämä peptidit ovat hyvin lipofiilisiä. Lipofiilisestä luonteestaan huolimatta ne eivät helposti läpäise veri-aivoestettä (BBB). Keksinnön mukaiset peptidit soveltuvat erityisen hyvin kipua lievittäviksi aineiksi, jotka vaikuttavat oleellisesti perifeerisiin μ -opioidireseptoreihin. Koska nämä peptidit vaikuttavat perifeerisesti, ne välttävät oleellisesti sentraaliseen kivunlievitysvaikutukseen normaalisti liittyvien sivuvaikutusten tuottamisen.

Uppfinningen avser en serie av nya opioidpeptider för behandling av smärta, och farmaceutiskt godtagbara sammansättningar innehållande dessa peptider. Uppfinningen avser även förfaranden för kontrollering av smärta hos en patient genom att använda sammansättningar enligt uppfinningen. Peptiderna enligt uppfinningen har hög selektivitetsgrad för μ -opioidreceptoren. Dessa peptider är mycket lipofiliska. Trots sin lipofiliska karaktär genomtränger de inte lätt blod-hjärnbarriären (BBB). Peptiderna enligt uppfinningen lämpar sig speciellt bra såsom smärtstillande medel, som verkar substantiellt på periferiska μ -opioidreceptorer. På grund av att dessa peptider verkar periferiskt, de undviker substantiellt produktionen av biverkningar som normalt hör ihop med central smärtstillande verkan.



(1)