

C 07 K 7

Ans.nr.: 4079/85

Indleveret: 06 sep 1985

Løbedag: 06 sep 1985

Alm. tilgængelig: 09 apr 1986

Prioritet: 07 sep 1984 US 648637

THE *SALK INSTITUTE FOR BIOLOGICAL
STUDIES; La Jolla, US.

Opfinder: Wylie Walker *Vale Jr.; US, Jean Ed-
ouard Frederic *Rivier; US.

Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude
GnRH antagonist VI

SAMMENDRAG

4079-85

Peptider, som hæmmer hypofysens sekretion af gonadotropiner og hæmmer kønskirtlernes steroidfrigivelse. Indgift af en effektiv mængde hindrer ægløsning hos hunpattedyr og/eller kønskirtlernes steroidfrigivelse. Peptiderne har strukturen: $X-R_1-(W)D-Phe-R_3-R_4-R_5-R_6(V)-R_7-Arg-Pro-R_{10}$, hvori X er hydrogen eller en acylgruppe med 7 eller færre carbonatomer, R_1 er dehydro-Pro, Pro, D-pGlu, D-Phe, D-Trp eller β -D-NAL, W er F, Cl, Cl_2 , Br, NO_2 eller C^aMe-Cl , R_3 er D-Trp, $(N^{in}For)D-Trp$ eller D-Trp, som er substitueret i 5- eller 6-stillingen med NO_2 , NH_2 , OCH_3 , F, Cl, Br eller CH_3 , R_4 er Ser, Orn, AAL eller aBu, R_5 er Tyr, (3F)Phe, (2F)Phe, (3I)Tyr, (3CH₃)Phe, (2CH₃)Phe, (3Cl)Phe eller (2Cl)Phe, R_6 er D-Lys, D-Orn eller D-Dap, V er $(Arg-R', R'')_n(X)$, idet n er 1-5, og R' og R'' er H, methyl, ethyl, propyl eller butyl, R_7 er Leu, NML, Nle eller Nva, og R_{10} er Gly-NH₂, D-Ala-NH₂ eller NH-Y, idet Y er lavere alkyl, cykloalkyl, fluor-lavere-alkyl eller NH-CONH-Q, hvor Q er H eller lavere alkyl.