



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus-Patentansökan 840577

(51) Kv.lk.³/Int.Cl.³ C 07 C 103/52

(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 14.2.84

(23) Alkupaivä-Löpdag

(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 17.8.84

(86) Kv. hakemus-Int. ansökan

(30) Etuoikeus-Prioritet 16.2.83 US 467117

(71) Hakija/Sökande: Smithkline Beckman Corporation, One Franklin Plaza, Philadelphia, PA, USA

(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Huffman, William Francis 2. Moore, Michael Lee

(74) Asiamies/Ombud: Berggren

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä vasopressiinia vastaan vaikuttavan oktapeptidin valmistamiseksi. Förfarande för framställning av vasopressinmotverkande oktapeptid.

(57) Tiivistelmä

Eräillä oktapeptideillä, joiden rakenteessa on kuusi yksikköä sisältävä peptidirengas, jossa on dipeptidihäntä, josta puuttuu glysiiniyksikkö asemasta 9, on voimakas vasopressiininvastainen vaikutus. Vastavaikutuksen omaavat sykliset oktapeptidit valmistetaan syklisoimalla dimekaptaani niin, että muodostuu ditiorengas. Keksintö koskee edellä mainittuja oktapeptidejä. Tärkeä tämän yhdistejoukon edustaja on $\overline{1}$ -(β -merkaptto- β , β -syklopentametyleenipropionihappo)-2-(O-etyyli-D-tyrosiini)-4-valiini-8-arginiini-9-desglysiini $\overline{7}$ vasopressiini.

(57) Sammandrag

Vissa oktapeptider, vilkas struktur innehåller en peptidring med sex enheter med en dipeptidsvans, som saknar en glycinenhet i ställning 9, har stark vasopressinantagonistisk verkan. De cykliska oktapeptidantagonisterna framställs genom cyklisering av en di-merkaptan för bildande av ditioringen. Uppfinningen avser ovannämnda oktapeptider. En viktig representant för denna föreningsgrupp är $\overline{1}$ -(β -merkaptto- β , β -cyklopentametylenpropionsyra)-2-(O-etyl-D-tyrosin)-4-valin-8-arginin-9-desglycin $\overline{7}$ vasopressin.