

C 07 C 103/52

Ans.nr.: 0652/84

Indleveret: 14 feb 1984

Løbedag: 14 feb 1984 840214

Alm. tilgængelig: 17 aug 1984

Prioritet: 16 feb 1983 US 467117

*SMITHKLINE BECKMAN CORPORATION;

Philadelphia, US.

Opfinder: William Francis *Huffman; US, Mi-

chael Lee *Moore; US.

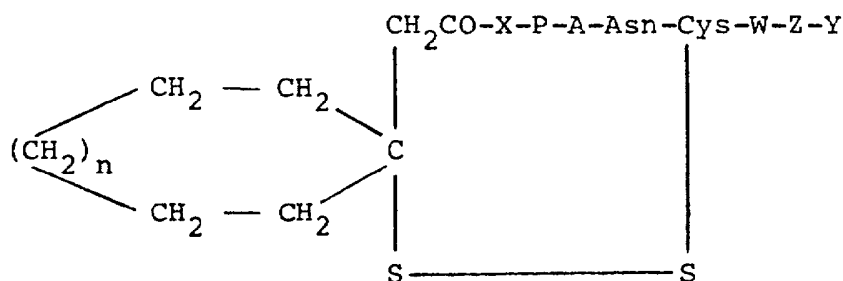
Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude

Octapeptider, der er vasopressin-antagonister

SAMMENDRAG

652-84

Visse octapeptider, der har strukturer, der er karakteristiske ved at være en cyklisk peptidring med 6 enheder og med en dipeptidhale, som mangler en glycin-enhed i stilling 9, har kraftig vasopressin-antagonist-virkning. De cykliske octapeptid-antagonister fremstilles ved anvendelse af cyklisering af en dimercaptan til dannelsen af dithioringen. Octapeptiderne har formelen



hvor

P er Phe eller Phe(4'-Alk),

X er D-Phe, D-Val, D-Leu, D-Ile, D-Nva, D-Pba, D-Nle, D-Cha,
D-Abu, D-Met, D-Chg, D-Tyr, L-Tyr, D-aIle, D-Tyr(Alk) eller
L-Tyr(Alk),

Y er NH_2 , NHAik, NHBzl eller OH,

W er D eller L-Pro eller Δ Pr(dehydro-Pro),

A er Val, Ile, Abu, Ala, Gly, Lys, Cha, Nle, Phe, Leu, Chg
eller Nva,

Z er D-Arg, L-Arg, D-Lys eller L-Lys, og

n er 0, 1 eller 2.