

C 07 D 519

Ans.nr.: 5418/82

Indleveret: 07 dec 1982

Løbedag: 07 dec 1982

Alm. tilgængelig: 09 jun 1983

Prioritet: 08 dec 1981 LU 83822

*OMNICHEM; Bruxelles, BE.

Opfinder: Andre Benoit Leon *Trouet; BE, Kan-
dukuri Sivaprasada Bushana *Rao; BE, Jean
Alfred Alphonse *Hannart; BE.

Fuldmægtig: Kontor for Industriel Eneret

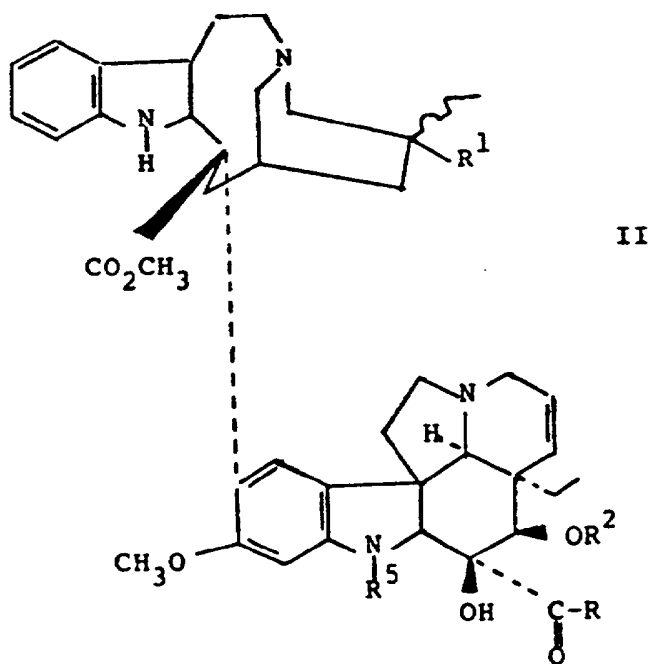
Fremgangsmåde til fremstilling af N-(vinbla-
stinoyl-23)-derivater af aminosyrer

Sammendrag

5418-82

Fremgangsmåde til fremstilling af N-(vinblastinoyl-23)-deri-
vater af aminosyrer

Vinblastinderivater med formlen



hvor R er en eventuelt beskyttet aminosyreester bundet til vinblastin-23-oyl-delen med en amidbinding, hvilken estergruppe kan være lige eller forgrenet og indeholde 2-9 kulstofatomer, R^1 er H eller OH, R^2 er H, formyl eller C_{2-9} acyl, R^5 er H, metyl eller formyl, idet R^5 ikke kan være metyl dersom R^1 er β -hydroxy, eller syreadditionssalte deraf fremstilles ved at omsætte et vinblastinderivat hvor R er en metoxygruppe med vandfrit hydrazin, nitrosering i surt medium af det vundne karboxyhydrazid, og omsætning af det vundne 3-karboxazid med den tilsvarende aminosyreester, eventuelt efterfulgt af formylering.

Forbindelserne har antitumoral virkning.