

C 07 C 103/52

Ans.nr.: 5089/83

Indleveret: 07 nov 1983

Løbedag: 07 nov 1983

Alm. tilgængelig: 13 maj 1984

Prioritet: 12 nov 1982 US 441137

ELI *LILLY AND COMPANY; Indianapolis, US.

Opfinder: Robert Theodore *Shuman; US.

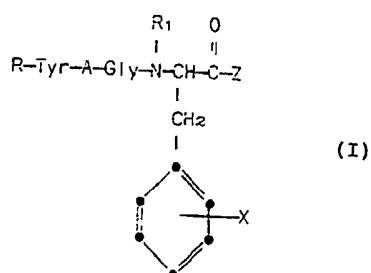
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af analgetisk virksomme peptidforbindelser

SAMMENDRAG

5089-83

Farmakologisk aktive peptider med formlen



og farmaceutisk acceptable syreadditionssalte deraf, hvori R er hydrogen, methyl, ethyl, cyclopropylmethyl, en amino- og/eller hydroxy-beskyttende gruppe eller allyl; A er en D-aminosyre eller en beskyttet rest deraf valgt blandt Ala, Abu, Nva, Val, Nle, Leu, Ile, Gly(Al), Gly(Cp), Met, Cys(Me), Met(O), Cys(Me)(O), Ser, Ser(Me), Thr og Hse; R₁ er hydrogen, primær C₁-C₃-alkyl, cyclo-

4a

propylmethyl, allyl, ethylthiomethyl, 2-fluorethyl eller propargyl; X er hydrogen, halogen, hydroxy, beskyttet hydroxy, C₁-C₃-alkyl, trifluormethyl eller C₁-C₂-alkoxy og Z er methyl eller ethyl, fremstilles ved, at man fjerner blokeringen fra en tilsvarende beskyttet forbindelse med formel (I) ved hjælp af et de-blokerende middel.

Forbindelserne er nyttige som analgetiske midler.