

C 07 C 129

Ans.nr.: 3985/83

Indleveret: 01 sep 1983

Løbedag: 01 sep 1983

Alm. tilgængelig: 03 mar 1984

Prioritet: 02 sep 1982 JP 57/151698

\*MICROBIAL CHEMISTRY RESEARCH FOUNDATION; Tokyo, JP.

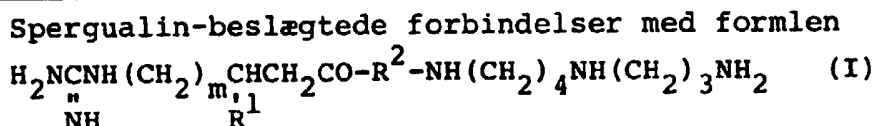
Opfinder: Hamao \*Umezawa; JP, Tomio \*Takeuchi; JP, Rinzo \*Nishizawa; JP, Katsutoshi \*Takahashi; JP, Teruya \*Nakamura; JP, Yoshihisa \*Umeda; JP.

Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

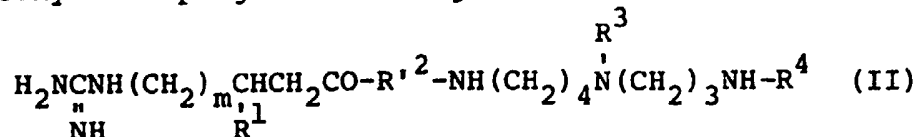
Spergualin-beslægtede forbindelser, fremgangsmåder til fremstilling deraf samt deres anvendelse som lægemidler

3985-83

SAMMENDRAG



hvor  $\text{R}^1$  er et hydrogenatom, en hydroxylgruppe eller en alifatisk acyloxygruppe med 1-10 carbonatomer,  $\text{R}^2$  er en rest af en  $\alpha$ - eller  $\omega$ -aminosyre fremkommet ved fjernelse af ét af hydrogenatomerne fra  $\alpha$ - eller  $\omega$ -aminogruppen og hydroxylgruppen fra  $\alpha$ -carboxylgruppen, idet dog R ikke indbefatter en  $\alpha$ -hydroxyglycinrest, og  $\text{R}^2$  er knyttet til nabocarbonylgruppen og amino-gruppen ved amidbindinger, og m er et helt tal fra 4 til 6, eller et fysiologisk acceptabelt salt deraf, kan fremstilles ved, at beskyttelsesgrupper fjernes fra en beskyttet spergualin-beslægtet forbindelse med formlen



hvor  $\text{R}^1$  har den ovenfor anførte betydning,  $\text{R}^2$  er en rest af en  $\alpha$ - eller  $\omega$ -aminosyre fremkommet ved fjernel-

se af ét af hydrogenatomerne fra  $\alpha$ - eller  $\omega$ -aminogruppen  
og hydroxylgruppen fra  $\alpha$ -carboxylgruppen, idet dog  $R^2$   
ikke indbefatter en  $\alpha$ -hydroxyglycinrest,  $\alpha$ - eller  $\omega$ -ami-  
nosyren eventuelt er beskyttet, hvis den som substituent  
har en funktionel gruppe, og  $R^2$  er knyttet til nabo-  
carbonylgruppen og aminogruppen ved amidbindinger, og  
 $R^3$  og  $R^4$  er ens eller forskellige og hver især betyder  
en beskyttelsesgruppe for aminogruppen, og m har den oven-  
for anførte betydning, under anvendelse af gængse metoder.

Forbindelserne (I) udviser en særdeles god stabilitet  
og antitumorvirkning.