

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	930013
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5	
C 07K 7/06	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	04.01.93
(24) Alkupäivä - Löpdag	04.07.91
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	04.01.93
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/SE91/00477
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
09.07.90 SE 9002384 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Ferring AB, Soldattorpsvägen 5, 200 62 Malmö, Sverige, (SE)

(72) Keksiä - Uppfinnare

1. Trojnar, Jerzy, Stenöregatan 36, 230 44 Bunkelflostrand, Sverige, (SE)
2. Lebl, Michal, Rimska 36, 120 00 Praha 2, Czechoslovakia, (CS)
3. Melin, Per, Sveagatan 100 C, 215 16 Malmö, Sverige, (SE)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Jalo Ant-Wuorinen Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Aivolisäkkeen takalohkon hormonien johdannaiset
Hormonderivat av bakre hypofysloben

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee aivolisäkkeen takalohkon hormonien johdannaisia, tarkemmin sanottuna uusia vasotosiinijohdannaisia. Uusilla vasotosiinijohdannaisilla on kaava I, jossa A = Mpa tai Hmp, B = D-Tyr, D-Tyr(Et), D-Phe, D-Phe(p-Et) tai D-Trp, C = Thr, Val tai Hgn, D = Cys tai α -Abu, E = Pro tai peptidisidos, F = kaavan (a) D- tai L-tähde, jossa m = 0-6, n = 0-6, L on H, COOH, CO-NH₂ tai CH₂-OH, K = H, (b) tai se on D- tai L-aminohapotähde, sillä edellytyksellä, että L ei ole H kun A on Mpa, C on Thr tai Val ja D on Cys. Keksintö koskee myös farmaseuttisia koostumuksia, jotka sisältävät uusia vasotosiini-johdannaisia ja ovat mieluimmin intravenoosin, intra-nasaaliseen tai inraintestinaaliseen annostukseen sopivassa muodossa. Koostumukset on erityisesti tarkoitettu käytettäväksi kohtulihaksen liiallisten supistuksien terapeuttiseksi käsittelemiseksi.

(I) A - B - Ile - C - Asn - D - E - F
 1 2 3 4 5 6 7 8

(a) NH-(CH₂)_m-CH-L,
 \downarrow
 (CH₂)_n-NH-K

(b) C=NH
 \downarrow
 NH₂

Uppfinningen avser hormonderivat av bakre hypofysloben, specifikt nya vasotocinderivat. De nya vasotocinderivaten har formeln I, i vilken A = Mpa eller Hmp, B = D-Tyr, D-Tyr(Et), D-Phe, D-Phe(p-Et) eller D-Trp, C = Thr, Val eller Hgn, D = Cys eller α -Abu, E = Pro eller en peptidbindning, F = en D- eller L-rest med formeln (a), i vilken m = 0-6, n = 0-6, L är H, COOH, CO-NH₂ eller CH₂-OH, K = H, (b) eller den är en D- eller L-aminoacylrest, förutsatt att L inte är H när A är Mpa, C är Thr eller Val och D är Cys. Uppfinningen avser också farmaceutiska sammansättningar, som innehåller de nya vasotocinderivaten och är företrädesvis i form lämplig för intravenös, intranasal eller intraintestinal administration. Sammansättningarna är speciellt avsedda för användning vid terapeutisk behandling av excessiva kontraktioner hos livmodersmuskeln.

