



Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr. : 2268/89 (51) Int. Cl. 4: C 07 K 7/06
(22) Indleveringsdag:.... 09 maj 1989
(24) Løbedag:..... 09 maj 1989
(41) Alm. tilgængelig:.... 11 nov 1989
(62) Stamansøgningsnummer:.....
(86) International ansøgning nr. :... -
(86) International indleveringsdag:
(85) Videreførselsdag:
(30) Prioritet: 10 maj 1988 US 192409
(71) Ansøger: *Merrell Dow Pharmaceuticals Inc., 2110 East Galbraith Road;
Cincinnati; Ohio 45215-6300, US
(72) Opfinder: John Leonard *Krstenansky, 3749 Ault Park; Cincinnati; Ohio
45208, US
(74) Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co., H.C. Andersens Boulevard 4
, 1553, København V

(54) Alkoholpeptidderivat samt anvendelse deraf til mindskning af blodkoagulation

(57) Sammendrag

2268-89

Alkoholpeptidderivat med formelen



idet X

er en aminoterminalgruppe valgt blandt hydrogen, en eller to alkylgrupper med 1-6 C-atomer, en eller to acylgrupper med 2-10 C-atomer, carbobenzyloxy eller t-butyloxycarbonyl, A₁ er en binding eller et peptid indeholdende fra 1-11 grupper af en hvilken som helst aminosyre,

A₂ er aPhe, SubPhe, β-(2- og -3-thienyl)alanin, β-(2- og -3-furanyl)alanin, β-(2-, -3- og -4-pyridyl)alanin, β-(benzothienyl-2- og -3-yl)alanin, β-(1- og -2-naphthyl)alanin, Tyr eller Trp,

A₃ er Glu eller Asp,

A₄ er en hvilken som helst aminosyre,

A₅ er Ile, Val, Leu, Nle eller Phe,

A₆ er Pro, Hyp, 3,4-dehydroPro, thiazolidin-4-carboxylat, Sar, NMePgl eller D-Ala,

A₇ er en hvilken som helst aminosyre,

A₈ er en hvilken som helst aminosyre,

A₉ er en lipophil aminosyre, valgt blandt Tyr, Met, Trp, Phe, Leu, Nle, Ile, Val, Cha og Pro eller et dipeptid indeholdende mindst en af disse lipophile aminosyrer,

A₁₀-O₁ er et reduceret peptidfragment indeholdende fra 0-5 grupper af en hvilken som helst aminosyre, hvori den carboxyterminale aminosyre er reduceret til alkoholderivatet deraf. kan anvendes til nedsættelse af blodkoagulation hos patienter.