

C 07 D 519

Ans.nr.: 3520/82

Indleveret: 05 aug 1982

Løbedag: 05 aug 1982

Alm. tilgængelig: 08 feb 1983

Prioritet: 07 aug 1981 CH 5104/81

*SANDOZ A.G.; Basel, CH.

Opfinder: Hans *Kobel; CH, Jean-Jacques

*Sanglier; CH, Hans *Tscherter; CH, Georg

*Bolliger; CH.

Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbureau

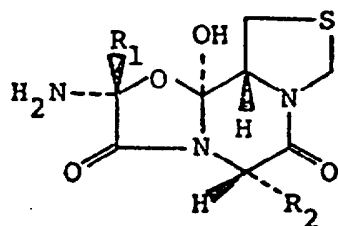
Fremgangsmåde til fremstilling af ergopeptinderivater

SAMMENDRAG

3520-82

Cycliske 9'-thia-peptidergotalkaloider fremstilles i form af frie baser eller syreadditionssalte deraf ved kondensation af relevante reaktive lysergsyrederivater med syreadditionssalte af relevante svovlholdige aminocycloler og påfølgende fakultativ omdannelse til syreadditionssalte deraf. Cycliske 9'-thia-peptidergotalkaloider, som er afledt af et fermentativt fremstilleligt 9'-methylen-peptidergotalkaloid, fremstilles ved, at man til en flydende kultur af en stamme, der producerer den tilsvarende 9'-methylenforbindelse, sætter L-thiazolidin-4-carboxylsyre eller et salt af denne syre og eventuelt omdanner den vundne forbindelse til et syreadditionssalt.

Hidtil ukendte forbindelser til anvendelse som udgangsmaterialer er bl.a. forbindelser II



II

hvor R_1 betegner alkyl med 1-4 carbonatomer, og R_2 betegner alkyl med 1-6 carbonatomer eller benzyl.

De cycliske 9'-thia-peptidergotalkaloider har dopaminreceptorstimulerende, prolaktinsekretionshæmmende, kationiserende, antidepressive og vigilansforøgende egenskaber.