

C 07 K 7

Ans.nr.: 5133/85

Indleveret: 07 nov 1985

Løbedag: 07 nov 1985

Alm. tilgængelig: 10 maj 1986

Prioritet: 09 nov 1984 JP 236076/84

*EISAI CO. LTD.; Tokyo, JP.

Opfinder: Hiroshi *Yoshino; JP, Yutaka *Tsuchiya; JP, Takeru *Kaneko; JP, Takahiro *Nakazawa; JP, Masuhiro *Ikeda; JP, Shin *Araki; JP, Kiyomi *Yamatsu; JP, Shinro *Tachibana; JP, Yoshihiro *Arakawa; JP.

Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau

Polypeptid, fremgangsmåde til dets fremstilling og farmaceutisk præparat indeholdende et sådant polypeptid

SAMMENDRAG

5133-85

Hidtil ukendt polypeptid, der er nyttigt som analgetikum, hvilket polypeptid har nedenstående formel

R^1

> L-Tyr-A-Gly-B-C-E-F

R^2

hvor R^1 og R^2 kan være ens eller forskellige og hver især betegner et hydrogenatom eller en lavere alkylgruppe eller lavere alkenylgruppe, A betegner en D-aminosyre, Gly eller Sar dog således at D-aminosyren, såfremt den er D-Cys, er bundet med L-Cys eller D-Cys i stilling 5 gennem en S-S-binding til tilvejebringelse af intramolekulær ringslutning, B betegner L-Phe eller D-Phe, hvori benzenringen kan være substitueret, eller et α -N-alkylderivat deraf, C betegner en L-aminosyre, D-Cys eller et

α -N-alkylderivat deraf, D og E betegner hver især en basisk L- eller D-aminosyre eller et α -N-alkylderivat deraf, F betegner en gruppe med formlen: $-\text{OR}^3$ (hvor R^3 er H eller en lavere alkylgruppe),

en gruppe med formlen: $-\text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{R}^4 \\ \diagdown \text{R}^5 \end{array}$ (hvor R^4 og R^5

er ens eller forskellige og hver især betegner H eller en lavere alkylgruppe), en gruppe med formlen: $-\text{G-OR}^6$ (hvor G er en α -aminosyre, β -alanin, γ -aminosmørsyre eller et α -N-alkylderivat deraf, og R^6 betegner H eller en lavere alkylgruppe),

en gruppe med formlen: $-\text{G-N} \begin{array}{l} \diagup \text{R}^7 \\ \diagdown \text{R}^8 \end{array}$ (hvor G har den

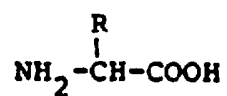
ovenfor angivne betydning, og R^7 og R^8 kan være ens eller forskellige og hver især betegner H eller en lavere alkylgruppe), en gruppe med formlen: $-\text{G-L-Arg-OR}^9$ eller $-\text{G-D-Arg-OR}^9$ (hvor D har den ovenfor angivne betydning, og R^9 betegner H eller en lavere alkylgruppe eller en gruppe med formlen:

$-\text{G-L-Arg-N} \begin{array}{l} \diagup \text{R}^{10} \\ \diagdown \text{R}^{11} \end{array}$ eller $-\text{G-D-Arg-N} \begin{array}{l} \diagup \text{R}^{10} \\ \diagdown \text{R}^{11} \end{array}$ (hvor G

har den ovenfor angivne betydning, og R^{10} og R^{11} kan være ens eller forskellig og hver især betegner H eller en lavere alkylgruppe), en gruppe med formlen: $-\text{G-H-OR}^{12}$, hvor G har den ovenfor angivne betydning, H er en neutral aminosyregruppe eller sur aminosyregruppe, og R^{12} er hydrogen eller en lavere alkylgruppe; eller en gruppe med formlen: $-\text{G-Arg-I-OR}^{13}$, hvor I er en D-aminosyregruppe og R^{13} er hydrogen eller en lavere alkylgruppe, dog således at ingen af de aminosyrer, der udgør polypeptidet med ovenstående formel, samtidig be-

5133-85

tegner en L-aminosyre med den almene formel:



(hvori R betegner en gruppe, der svarer til strukturformlen for en aminosyre berøvet en gruppe med formelen: $\begin{array}{c} \text{-CH-COOH) ,} \\ | \\ \text{NH}_2 \end{array}$

eller farmakologisk acceptable salte deraf.