

Title (en)

CONFORMATIONALLY CONSTRAINED OXYTOCIN ANTAGONISTS WITH PROLONGED BIOLOGICAL ACTIVITIES.

Title (de)

IM AUFBAU BESCHRÄNKTE OXYTOCINANTAGONISTEN MIT VERLÄNGERTER BIOLOGISCHER WIRKUNG.

Title (fr)

ANTAGONISTES DE L'OXYTOCINE A CONFORMATION LIMITEE PRESENTANT DES ACTIVITES BIOLOGIQUES PROLONGEES.

Publication

**EP 0247033 A1 19871202 (EN)**

Application

**EP 85905687 A 19851025**

Priority

US 8502104 W 19851025

Abstract (en)

[origin: WO8702676A1] Polypeptides having formula (I), wherein X is hydrogen or -NH<sub>2</sub>; Y and Z are independently sulfur or CH<sub>2</sub>; R<1> and R<2> are hydrogen, methyl, cyclopentamethylene or an alkyl group having 1 to 5 carbon atoms; R<3> is Phe, D-Phe, Tyr, D-Tyr, Tyr(OMe), D-Tyr(OMe), Tyr(OEt), D-Tyr(OEt), Phe(4-Me), D-Phe(4-Me), Phe(4-Et) or D-Phe(4-Et); R<4> is Gln, Thr, Ser, Asn, or Val; and R<5> is Orn, Arg, Lys, Leu, or Ile; provided, however, that when X is hydrogen and R<3> is Tyr(OMe), R<4> may not be Thr or when X is hydrogen, R<3> is Phe and R<4> is Asn, R<5> may not be Orn. The polypeptides are oxytocin antagonists and are useful in inhibiting oxytocin induced contractions in mammals.

Abstract (fr)

Polypeptides de formule (I) où X est hydrogène ou -NH<sub>2</sub>; Y et Z sont indépendamment soufre ou CH<sub>2</sub>, R<sub>1</sub> et R<sub>2</sub> sont hydrogène, méthyle, cyclopentaméthylène ou un groupe alkyle possédant de 1 à 5 atomes de carbone; R<sub>3</sub> est Phe, D-Phe, Tyr, D-Tyr, Tyr(OMe), D-Tyr(OMe), Tyr(OEt), D-Tyr(OEt), Phe(4-Me), D-Phe(4-Me), Phe(4-Et) ou D-Phe(4-Et); R<sub>4</sub> est Gln, Thr, Ser, Asn, ou Val; et R<sub>5</sub> est Orn, Arg, Lys, Leu, ou Ile; à condition toutefois que lorsque X est hydrogène et R<sub>3</sub> est Tyr(OMe), R<sub>4</sub> ne puisse pas être Thr ou lorsque X est hydrogène, R<sub>3</sub> est Phe et R<sub>4</sub> est Asn, R<sub>5</sub> ne puisse pas être Orn. Ces polypeptides sont des antagonistes de l'oxytocine et sont utiles en tant qu'inhibiteurs des contractions induites par l'oxytocine chez les mammifères.

IPC 1-7

**C07K 7/06**; **C07K 7/16**; **A61K 37/64**

IPC 8 full level

**C07K 7/16** (2006.01); **A61K 38/00** (2006.01)

CPC (source: EP)

**C07K 7/16** (2013.01); **A61K 38/00** (2013.01)

Citation (search report)

See references of WO 8702676A1

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

**WO 8702676 A1 19870507**; EP 0247033 A1 19871202

DOCDB simple family (application)

**US 8502104 W 19851025**; EP 85905687 A 19851025