

Title (en)
REDUCED IRREVERSIBLE BOMBESIN ANTAGONISTS.

Title (de)
IRREVERSIBLE, REDUZIERTE BOMBESINANTAGONISTEN.

Title (fr)
ANTAGONISTES IRREVERSIBLES REDUITS DE BOMBESINE.

Publication
EP 0452447 A1 19911023 (EN)

Application
EP 90915774 A 19901102

Priority
• GB 8925024 A 19891106
• GB 9006413 A 19900322

Abstract (en)
[origin: WO9106563A1] A peptide of the formula (I): R-A-B-C-Trp-Ala-Val-X-Y-T-W, wherein R represents a group of the formula 4-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CH₂CH(NHR₁)CO-; 3-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CH₂CH(NHR₁)CO-; 4-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CO-; 3-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CO-; ClCH₂CH₂NHCO-; ClCH=CH-CO-, BrCH=CH-CO-, CH₂=CClCO-, CH₂=CBrCO- (either cis or trans isomers); (a); CH=C-CO-; ClCH₂CH₂CH₂N(NO)CO-; ClCH₂CO-CH(R₂)NHCO(CH₂)₂CO-; A represents a valence bond, or a Gly, Leu-Gly, Arg-Leu-Gly, or Gln-Arg-Leu-Gly residue, B represents a valence bond or a Asn, Phe or Thr residue; C represents a Gln or His residue, X represents a Gly or ala residue; Y represents a valence bond, or a His(R₃), his(R₃), Phe, phe, Ser, ser, Ala or ala residue; T represents a valence bond, or a Leu, leu, Phe or phe residue; W represents a group of the formula OR₂, NH₂, NH(CH₂)₄CH₃, NH(CH₂)₂C₆H₅, Met-R₄, Leu-R₄, Ile-R₄ or Nle-R₄; R₁ represents a hydrogen atom, a Boc group or an acyl group, R₂ represents a hydrogen atom, a linear or branched aliphatic chain having from 1 to 11 carbon atoms, a benzyl or a C₁-C₂₁ phenyl group, R₃ represents a hydrogen atom or a Tos, Dnp or Bzl group, R₄ represents NH₂, NH-NH₂ or OR₂, one or more peptide bonds (CONH) are replaced by reduced peptide bonds (CH₂, NH), and the pharmaceutically acceptable salts thereof and pharmaceutically acceptable salts are bombesin antagonists. Their preparation and pharmaceutical compositions containing them are also described.

Abstract (fr)
Peptide de la formule (I): R-A-B-C-Trp-Ala-Val-X-Y-T-W, dans laquelle R représente un groupe de la formule 4-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CH₂CH(NHR₁)CO-; 3-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CH₂CH(NHR₁)CO-; 4-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CO-; 3-(ClCH₂CH₂)₂N-C₆H₄-CO-; ClCH₂CH₂NHCO-; ClCH=CH-CO-, BrCH=CH-CO-, CH₂=CClCO-, CH₂=CBrCO- (isomères soit cis soit trans); (a); CH=C-CO-; ClCH₂CH₂CH₂N(NO)CO-; ClCH₂CO-CH(R₂)NHCO(CH₂)₂CO-; A représente une liaison de valence ou un reste Gly, Leu-Gly, Arg-Leu-Gly, ou Gln-Arg-Leu-Gly, B représente une liaison de valence ou un reste Asn, phe ou Thr; C représente un reste Gln ou His, X représente un reste Gly ou ala; Y représente une liaison de valence ou un reste His(R₃), his(R₃), Phe, phe, Ser, ser, Ala ou ala; T représente une liaison de valence, ou un reste Leu, leu, Phe, phe; W représente un groupe de la formule OR₂, NH₂, NH(CH₂)₄CH₃, NH(CH₂)₂C₆H₅, Met-R₄, Leu-R₄, Ile-R₄, ou Nle-R₄; R₁ représente un atome d'hydrogène, un groupe Boc ou un groupe acyle, R₂ représente un atome d'hydrogène, une chaîne aliphatique linéaire ou ramifiée comportant 1 à 11 atomes, un groupe benzyle ou un groupe phényle contenant un à 21 atomes de carbone, R₃ représente un atome d'hydrogène ou un groupe Tos, Dnp ou Bzl, R₄ représente NH₂, NH-NH₂ ou OR₂, une ou plusieurs liaisons peptidiques (CONH) sont remplacées par des liaisons peptidiques réduites (CH₂NH), ainsi que leurs sels pharmaceutiquement acceptables et des sels pharmaceutiquement acceptables représentent des antagonistes de bombésine. Leur préparation et les compositions pharmaceutiques les contenant sont également décrites.

IPC 1-7
A61K 37/02; **C07K 7/02**

IPC 8 full level
A61K 38/00 (2006.01); **A61P 35/00** (2006.01); **C07K 1/06** (2006.01); **C07K 7/06** (2006.01); **C07K 7/08** (2006.01)

CPC (source: EP KR)
A61P 35/00 (2017.12 - EP); **C07K 7/02** (2013.01 - KR); **C07K 7/086** (2013.01 - EP); **A61K 38/00** (2013.01 - EP)

Citation (search report)
See references of WO 9106563A1

Designated contracting state (EPC)
AT BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)
WO 9106563 A1 19910516; AU 6610390 A 19910531; CA 2045494 A1 19910507; EP 0452447 A1 19911023; HU 912604 D0 19920128; HU T58763 A 19920330; IE 903958 A1 19910508; IL 96216 A0 19910816; JP H04502629 A 19920514; KR 920701242 A 19920811

DOCDB simple family (application)
EP 9001836 W 19901102; AU 6610390 A 19901102; CA 2045494 A 19901102; EP 90915774 A 19901102; HU 260491 A 19901102; IE 395890 A 19901102; IL 9621690 A 19901102; JP 51474790 A 19901102; KR 910700701 A 19910705