

Title (en)  
BOMBESIN ANTAGONISTS.

Title (de)  
BOMBESINANTAGONISTEN.

Title (fr)  
PEPTIDES.

Publication  
**EP 0541654 A1 19930519 (EN)**

Application  
**EP 91914148 A 19910730**

Priority  
GB 9016810 A 19900731

Abstract (en)  
[origin: WO9202545A1] The present invention provides a polypeptide of the formula (I):  $XX<1>TrpX<2>X<3>X<4>X<5>X<6>X<7>NH_2$ , wherein X is a group  $X<8>Arg$ (or D-Arg) $X<9>X<10>$  and  $X<8>$  is des  $NH_2Pro, TyrPro, des NH_2TyrPro, Ada, Pro, D-Pro$  or is deleted;  $X<9>$  is Gly, Ala, D-Ala or is deleted;  $X<10>$  is Asn, Phe, D-Phe, or Phe or D-Phe substituted by one or more halo atoms; or X is a group  $A-(CH_2)_n-CO-$  in which A is a group containing 1 to 3 rings of which at least one ring is aromatic, each ring system being optionally substituted; and the alkylene group is optionally substituted by one to four groups selected from amino, hydroxy, C1-4 alkoxy and C1-4 alkyl optionally substituted by halo and n is 0 to 4; or X is cyclopentyl carbonyl substituted by a group  $X<8>Arg$ (or D-Arg) $X<9>X<10>$  as hereinbefore defined;  $X<1>$  is His, ThiAla or is deleted;  $X<2>$  is Ala, D-Ala, CPenc, D-tBuGly or Pro;  $X<3>$  is Val or Val substituted by one or more halo atoms;  $X<4>$  is Gly, Ala, D-Ala, Sarcosine, Pro, D-Pro or D-Phe;  $X<5>$  is His or ThiAla;  $X<6>$  is D-Pro psi, Pro psi, 2-pyrrolidinyl-3-hydroxypropionyl or D-Pro;  $X<7>$  is Nle, Leu, Phe, Val, Mox, D-Phe, Phe, or D-Phe substituted by one or more halo atoms or naphthylAla or naphthyl D-Ala or a hydrophobic, substituted aromatic amino acid or aralkylamine or is deleted, and the pharmaceutically acceptable salts thereof. The polypeptides possess antagonist properties against bombesin-like peptides and are of value in the treatment of malignant disease.

Abstract (fr)  
L'invention décrit un polypeptide correspondant à la formule (I)  $XX1TrpX2X3X4X5X6X7NH_2$ , dans laquelle X représente un groupe  $X8Arg$ (ou D-Arg) $X9X10$  et  $X8$  représente des  $NH_2Pro, TyrPro, Des NH_2TyrPro, Ada, Pro, D-Pro$  ou est supprimé;  $X9$  représente Gly, Ala, D-Ala ou est supprimé;  $X10$  représente Asn, Phe, D-Phe ou Phe ou D-Phe substitués par un ou plusieurs atomes halo; ou X représente un groupe  $A-(CH_2)_n-CO-$  dans lequel A représente un groupe contenant de 1 à 3 noyaux, dont l'un au moins est aromatique, chaque système de noyau étant éventuellement substitué; et le groupe alkylène est éventuellement substitué par un à quatre groupes sélectionnés à partir d'amino, hydroxy, C1-4alcoxy et C1-4alkyle éventuellement substitué par halo et n est situé entre 0 et 4; ou X représente un carbonyle de cyclopentyle substitué par un groupe  $X8Arg$ (ou D-Arg) $X9X10$  définis comme précédemment;  $X1$  représente His, ThiAla ou est supprimé;  $X2$  représente Ala, D-Ala, CPenc, D-tBuGly ou Pro;  $X3$  représente Val ou Val substitué par un ou plusieurs atomes halo;  $X4$  représente Gly, Ala, D-Ala, Sarcosine, Pro, D-Pro ou D-Phe;  $X5$  représente His ou ThiAla;  $X6$  représente D-Propsi, Propsi, 2-pyrrolidinyle-3-hydroxypropionyle ou D-Pro;  $X7$  représente Nle, Leu, Phe, Val, Mox, D-Phe, Phe ou D-Phe substitué par un ou plusieurs atomes halo ou naphthylAla ou naphthyle D-Ala ou un acide aminé aromatique substitué hydrophobe ou aralkylamine, ou est supprimé. L'invention décrit également les sels dudit polypeptide acceptables en pharmacologie. Ces polypeptides possèdent des propriétés d'antagonisme aux peptides analogues à la bombésine et sont efficaces dans le traitement des maladies malignes.

IPC 1-7  
**A61K 37/02; C07K 7/06; C07K 7/08**

IPC 8 full level  
**A61K 38/00** (2006.01); **A61K 38/04** (2006.01); **A61P 35/00** (2006.01); **A61P 43/00** (2006.01); **C07K 1/06** (2006.01); **C07K 7/00** (2006.01); **C07K 7/06** (2006.01); **C07K 7/08** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**A61P 35/00** (2017.12); **A61P 43/00** (2017.12); **C07K 7/086** (2013.01); **A61K 38/00** (2013.01)

Citation (search report)  
See references of WO 9202545A1

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

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9202545 A1 19920220**; AU 653544 B2 19941006; AU 8311191 A 19920302; CA 2088166 A1 19920201; CZ 8093 A3 19940119; EP 0541654 A1 19930519; FI 930411 A0 19930129; FI 930411 A 19930129; GB 9016810 D0 19900912; HU 9300239 D0 19930428; HU T63178 A 19930728; IE 912671 A1 19920212; IL 99009 A0 19920715; JP H05509100 A 19931216; MC 2312 A1 19930927; MY 107031 A 19950830; NO 930262 D0 19930126; NO 930262 L 19930126; NZ 239183 A 19930727; PL 167322 B1 19950831; PL 297652 A1 19920713; PT 98498 A 19920529; SK 3893 A3 19930707; TW 234130 B 19941111; ZA 915978 B 19930428

DOCDB simple family (application)  
**GB 9101289 W 19910730**; AU 8311191 A 19910730; CA 2088166 A 19910730; CS 809391 A 19910730; EP 91914148 A 19910730; FI 930411 A 19930129; GB 9016810 A 19900731; HU 23993 A 19910730; IE 267191 A 19910730; IL 9900991 A 19910730; JP 51321891 A 19910730; MC 2312 D 19910730; MY P119911370 A 19910730; NO 930262 A 19930126; NZ 23918391 A 19910730; PL 29765291 A 19910730; PT 9849891 A 19910730; SK 3893 A 19910930; TW 80105951 A 19910730; ZA 915978 A 19910730