PCT WORLD ORGANISATION FOR INTELLECTUAL PROPERTY
International Office
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification[6] : C07K — A2

(11) International publication number: WO 97/19953

(43) International publication date: 5 June 1997 (05.06.97)

(21) International application number: PCT/DE96/02171

(22) International filing date: 14 November 1996 (14.11.96)

(30) Data relating to the priority:
195 44 212.1 28 November 1995 (28.11.95) DE

(71) Applicant (for all designated States except US):
ASTA MEDICA AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];
An der Pikardie 10, D-01277 Dresden (DE).

(72) Inventors; and
(75) Inventors/Applicants (US only): Bernhard KUTSCHER [DE/DE]; Stresemannstrasse 9, D-63477 Maintal (DE). Michael BERND [DE/DE]; Güntersburgallee 52, D-60316 Frankfurt (DE). Thomas BECKERS [DE/DE]; Passavantstrasse 26, D-60596 Frankfurt (DE). Thomas KLENNER [DE/DE]; Im Kannengießer 4, D-55218 Ingelheim (DE). Peter-Paul EMIG [DE/DE]; Ludwig-Erhard-Strasse 22, D-63486 Bruchköbel (DE). Patricia-Marie CHARPENTIER [FR/DE]; Rhönstrasse 1, D-63477 Maintal (DE).

(81) Designated States: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, HU, IS, JP, KR, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, UA, US, European Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

Published
Without the International Search Report and to be republished once the report has been received.

As printed

(54) Title: NEW LH-RH ANTAGONISTS WITH IMPROVED EFFECTIVENESS

(54) Bezeichnung: NEUE LH-RH-ANTAGONISTEN MIT VERBESSERTER WIRKUNG

(57) Abstract

New LH-RH antagonists are disclosed, in particular peptidomimetics and peptides modified in a side chain, their salts with pharmaceutically acceptable acids and a process for preparing these LH-RH antagonists and their salts. The disclosed peptides represent analogues of the luteinising hormone releasing hormone (LH-RH). The disclosed compounds have a high antagonistic power and are free of undesirable side effects, in particular edematogenic effects.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue LH-RH-Antagonisten, insbesondere Peptidomimetika und in einer Seitenkette modifizierte Peptide, Salze derselben mit pharmazeutisch akzeptablen Säuren sowie Verfahren zur Herstellung der LH-RH-Antagonisten und ihrer Salze. Die erfindungsgemäßen Peptide stellen Analoge des das luteinisierende Hormon freisetzenden Hormons (LH-RH) dar. Die erfindungsgemäßen Verbindungen weisen eine hohe antagonistische Potenz auf und sind frei von unerwünschten Nebenwirkungen, insbesondere frei von oedematogenen Wirkungen.