

BUSERELIN

Cas No: 68630-75-1

Summenformel: $C_{60}H_{86}N_{16}O_{13} \cdot C_2H_4O_2$

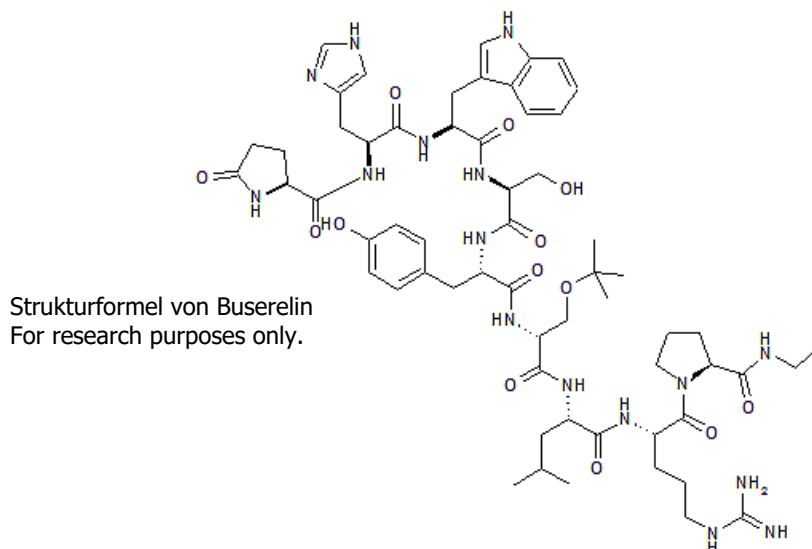
Molekulargewicht: 1299.47 g/mol

Source: Synthetic

Synonym: des-Gly¹⁰-[D-Ser(t-Bu)⁶]-LH-RH ethylamide acetate salt,

Sequenz: Glp-His-Trp-Ser-Tyr-D-Ser(t-Bu)-Leu-Arg-Pro-NHEt acetate salt, Glp=Pyroglutamat (Pyr), NHEt=Ethylamid

Gegenion: Acetat



Buserelin ist ein stärker wirksames Derivat des Gonadotropin-Releasing-Hormons (GnRH). An Position 6 wurde die Aminosäure Glycin gegen O-tert-Butyl-D-Serin ausgetauscht. Die C-terminale Aminosäure Glycin wurde entfernt und der C-Terminus als Ethylamid geschützt. Die chemische Abwandlung führt zu einer erhöhten Resistenz gegen den enzymatischen Abbau durch Peptidasen und zu einer lang anhaltenden Gonadotropinfreisetzung bei wesentlich verringerter Wirkstoffdosis gegenüber GnRH. Buserelin ist hundert- bis zweihundertfach wirksamer als natürliches GnRH.

GnRH: Pyr-His-Trp-Ser-Tyr-Gly-Leu-Arg-Pro-Gly

Triptorelin: Glp-His-Trp-Ser-Tyr-D-Trp-Leu-Arg-Pro-Gly-NH₂

Goserelin: Glp-His-Trp-Ser-Tyr-Ser(t-Bu)-Leu-Arg-Pro-azaGly-NH₂

Buserelin: Glp-His-Trp-Ser-Tyr-D-Ser(t-Bu)-Leu-Arg-Pro-NHEt acetate salt

Der Wirkstoff bindet in der Hypophyse agonistisch an den GnRH-Rezeptor und führt so zur Sekretion eines weiteren Hormons, des Luteinisierenden Hormons (LH), sowie in weniger starkem Umfang, des Follikelstimulierenden Hormones (FSH). Letztlich bewirkt eine pulsatile Verabreichung von Buserelin die Reifung der Ovarialfollikel im Eierstock und eine Ovulation. Dies macht man sich bei der Behandlung von Eierstockzysten und bei der künstlichen Befruchtung zunutze, in der Tiermedizin auch für den Ovar-Stimulationstest.

Bei kontinuierlicher Stimulierung des Rezeptors über mehr als 24 Stunden kommt es zu einer paradoxen Hemmung, da es zu einer Rezeptor-Desensibilisierung kommt, woraufhin die LH-Sekretion trotz Bindung des fördernden Hormons unterdrückt wird. Als Folge dessen wird im Hoden die Produktion des männlichen Geschlechtshormons Testosteron auf Kastrationsniveau unterdrückt. Dieser Mechanismus wird zur Behandlung testosteronabhängiger Tumore, vor allem bei fortgeschrittenem Prostatakrebs ausgenutzt. Außerdem findet Buserelin Anwendung in der Brustkrebs-Behandlung.

References:

Lam, P., et al., Gynecol. Endocrinol., 24, 674 (2008)

Chi, K., et al., J. Urol., 180, 565 (2008)

Genosphere Biotechnologies

21 place de la République

F-75003 Paris

Internet:

www.biomodul.de/peptide.html

E-mail:

info@genosphere-biotech.de

