

C 07 C 103/52

Ans.nr.: 2729/82

Indleveret: 17 jun 1982

Løbedag: 17 jun 1982

Alm. tilgængelig: 18 dec 1983

Prioritet: -

*SCHERING CORPORATION; Kenilworth, US.

Opfinder: Joel G. *Berger; US, Jay *Weinstein; US.

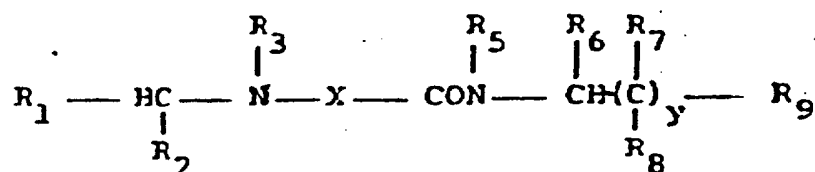
Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau

Fremgangsmåde til fremstilling af substituerede dipeptider

SAMMENDRAG

2729-82

Substituerede dipeptider med formlen



hvor R_1 er hydrogen, alkyl, halogenalkyl, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, aryloxyalkyl, aminoalkyl, alkylaminoalkyl, dialkylaminoalkyl, acylaminoalkyl, diarylaminoalkyl, arylaminoalkyl, guanidinoalkyl, heteroaryl, aryl, aralkyl, mercaptoalkyl, arylthioalkyl, alkylaralkyl, alkylthioalkyl, aralkyloxyalkyl, aralkylthioalkyl eller heteroaryloxyalkyl, hvor de sidste tre grupper kan være substitueret med halogen, alkyl, alkoxy, hydroxy, amino, aminomethyl, carboxyl, cyano og/eller sulfamoyl, eller R_1 er en med en eventuelt substitueret heterocyclisk

gruppe substitueret alkenyl- eller alkylgruppe, R_2 er $-\text{COOH}$, $-\text{COO-alkyl}$, $-\text{COO-arylalkyl}$, $-\text{COO-aryl}$, $-\text{COO-CH}_2-$, $-\text{O}-\overset{\text{O}}{\underset{\text{R}_{11}}{\text{C}}}-\text{alkyl}$, $-\text{CONR}_{20}\text{R}_{21}$, hvori R_{20} og R_{21} er ens eller forskellige og er valgt blandt hydrogen, alkyl, aryl, substitueret aryl, aralkyl og substitueret aralkyl, hvori substituentene sidder på aryldelen, eller R_{20} og R_{21} tilsammen danner en mættet 5- til 7-leddet ring, der også kan indeholde oxygen som ringheteroatom, eller gruppen

$$\text{O}=\overset{\text{R}_{11}}{\underset{\text{R}_{11}}{\text{P}}}-\text{OR}_{10},$$

hvori R_{10} er hydrogen, alkyl eller benzyl, og R_{11} er hydroxy, alkoxy, benzyloxy, alkyl, aryl eller benzyl, R_3 er hydrogen eller alkyl,

X er $\overset{\text{R}_4}{\underset{|}{\text{CH}}}$ eller $\overset{(\text{CH}_2)_q \text{R}_4}{\underset{|}{\text{N}}}$, hvori q er 0 eller 1, R_4 er valgt blandt de for R_1 anførte grupper, indolyl, indolylalkyl, aminomethyl-phenylalkyl, 3-thianaphthenylmethyl og tetrahydronaphthylmethyl, R_5 er hydrogen eller alkyl, y er 0, 1, 2 eller 3, R_6 , R_7 og R_8 er valgt blandt de for R_4 anførte grupper, og R_9 er valgt blandt de for R_2 anførte grupper, hvorhos R_7 og R_8 , når y er 2 eller 3, kan sidde på det samme eller forskellige carbonatomer, eller farmaceutisk acceptable salte heraf, fremstilles ved en række forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne har hæmmende virkning på enkephalinase.