

A 61 K 49

C 07 C 103/52

Ans.nr.: 5468/82

Indleveret: 09 dec 1982

Løbedag: 09 dec 1982

Alm. tilgængelig: 11 jun 1983

Prioritet: 10 dec 1981 US 329166

\*MERCK & CO. INC.; Rahway, US.

Opfinder: Daniel F. \*Veber; US, Joshua Schafer

\*Boger; US, Mark G. \*Bock; US.

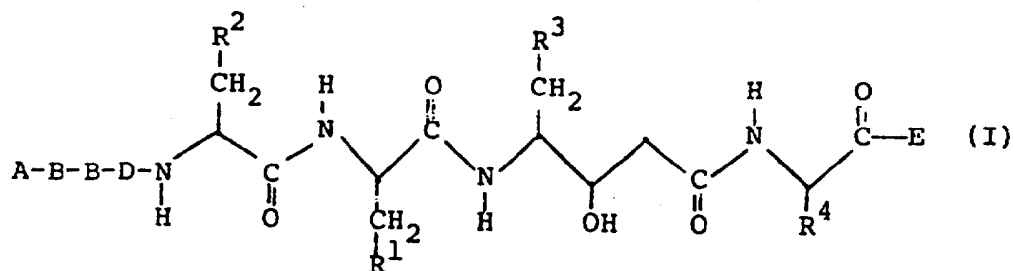
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af peptider

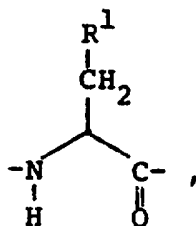
SAMMENDRAG.

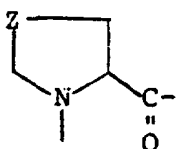
5468-82

Peptider med formelen:



og isomere og farmaceutisk acceptable salte deraf, i hvilken formel A er hydrogen eller en eventuelt substitueret estergruppe, B findes ikke eller er glycyl, sarcosyl eller



D findes ikke eller er  ,

hvor Z er  $(\text{CH}_2)_n$ , og n er 1 eller 2, eller -S-,  $\text{R}^1$  er hydrogen, alkyl, hydroxyalkyl, phenyl, monosubstitueret phenyl, indolyl, 4-imidazolyl, aminoalkyl, guanidylalkyl eller methylthiomethyl,  $\text{R}^2$  er hydrogen, alkyl, phenyl, monosubstitueret phenyl eller indolyl,  $\text{R}^3$  er alkyl, cycloalkyl, phenyl, monosubstitueret cycloalkyl eller monosubstitueret phenyl,  $\text{R}^4$  er hydrogen eller  $\text{CH}-\text{R}^5$ , hvor  $\text{R}^5$  er hydrogen, alkyl, hydroxy eller cycloalkyl, E er amino, hydroxy, substitueret amino eller substitueret hydroxy,

fremstilles ved sekvenssyntese, specielt ved fastfase-sekvenssyntese. Forbindelserne I og salte deraf har farmaceutisk virkning mod renin-associeret hypertension og mod renin-associeret hyperaldosteronisme, og de kan endvidere anvendes til bestemmelse af renin-associeret hypertension i en patient.