



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 893211  
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5  
C 07C 237/22, 271/20, C 07D 233/64  
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 30.06.89  
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 30.06.89  
(41) Tulnut julkiseksi - Blivit offentlig 02.01.90  
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

01.07.88 US 214698

28.06.89 US 370962

(71) Hakija - Sökande

1. G D Searle & Co., P.O. Box 5110, Chicago, Ill. 60680, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Hanson, Gunnar J., 7410 Keystone Avenue, Skokie, Ill. 60077, USA, (US)  
2. Baran, John S., 659 Locust Street, Winnetca, Ill. 60093, USA, (US)

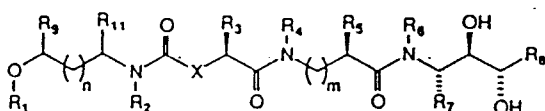
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Antihypertensiivisiä, N-terminaalisia eetteriaminodioliainohappojohdannaisia  
Antihypertensiva, N-terminala eteraminodiolaminosyraderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

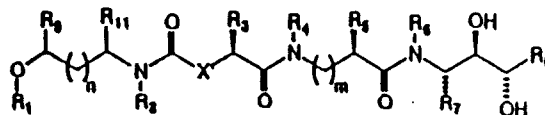
Keksintö koskee yhdisteitä, joilla on kaava



jossa X on happiatomi tai metyleeniryhmä;  $R_1$  on metyyli-, etyyli-, t-butylioksikarbonyyli- tai 2-(N-piperidinyyli)etyyliryhmä;  $R_2$  on hydridi-, metyyli-, etyyli- tai isopropyliryhmä;  $R_3$  on bentsyyli-, fenetyyli-, pyridyylimetyyli- tai 2-pyridylylietyyliryhmä; missä kukin  $R_4$  ja  $R_6$  erikseen on hydridi- tai metyyliiryhmä;  $R_7$  on sykloheksyylimetyyliiryhmä;  $R_8$  on isobutyyliryhmä; missä kukin  $R_9$  ja  $R_{11}$  on hydridiryhmä; missä m on 0 tai 1 ja n on lukumäärä välillä 1-5; ja näiden farmaseuttisesti hyväksyttävien suolojen; edellyttäen, että kun m on 0, niin  $R_5$  on imidatsolimetyyli-, tiatsolimetyyli- tai isobutyyliryhmä; ja kun m on 1,  $R_5$  on metyyli- tai etyyliiryhmä.

Eetterityyppisiksi N-pään aminodioli johdannaiseksi yleisesti luonnehditut ei-peptidyyliyhdisteet ovat hyödyllisiä reniini-inhibiittoreina korkean verenpaineen hoidossa.

Uppfinningen avser föreningar med formeln:



vari X är en syreatom eller en metylengrupp;  $R_1$  är en metyl-, etyl-, t-butyloxikarbonyl- eller 2-(N-piperidinyli)etylgrupp;  $R_2$  är en hydrid-, metyl-, etyl- eller isopropylgrupp;  $R_3$  är en bensyl-, fenetyl-, pyridylmetyl- eller 2-pyridyletylgrupp, vardera  $R_4$  och  $R_6$  är självständigt en hydrid- eller metylgrupp;  $R_7$  är en cyklohexylmetylgrupp;  $R_8$  är en isobutylgrupp; vardera  $R_9$  och  $R_{11}$  är en hydridgrupp; m är 0 eller 1 och n är ett tal 1 - 5; och deras farmaceutiskt godtagbara salt; med villkor att då m är 0, är  $R_5$  en imidazolmetyl-, tiazolmetyl eller isobutylgrupp; och då m är 1, är  $R_5$  en metyl- eller etylgrupp.

Icke-peptidföreningar, vilka vanligtvis karakteriseras som eteriska, N-terminala aminodiolderivat av aminosyror är användbara som renininhibitorer vid behandlingen av hypertension.