



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 865323
(51) Kv.lk.⁴/Int.cl.⁴ C 07 C 101/20, 101/26,
C 07 K 5/06
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 29.12.86
(23) Alkuperäpäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 01.07.87
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 30.12.85 ES 550527

(71) Hakija/Sökande: *Torcan Chemical Ltd.*, Aurora, Ontario, Kanada

(72) Keksijä/Uppfinnare: Oudenes, Jan

(74) Asiamies/Ombud: Ant-Wuorinen

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä karboksialkyyli-
lidiptidien valmistamiseksi. Förfarande för framställning av kar-
boxialkyldipeptider.

(57) Tiivistelmä

Farmaseuttisesti aktiiviset karboksialkyyliidipti-
dit, kuten enalapriili, lisinopriili ja vastaavat valmis-
tetaan lähtöaineena käytetystä aminohaposta, kuten L-ala-
niinista suojaamalla aminohapon happofunktio alkyyli-
lyyliryhmällä, hapon reagoidessa α -halogeeniesterin kans-
sa aminofunktiossaan. Sen jälkeen silyylisuojarahmä pois-
tetaan ja happoryhmä saatetaan reagoimaan sopivan amino-
hapon, kuten L-proliinin aminofunktion kanssa dipeptidi-
tuotteen muodostamiseksi.

(57) Sammandrag

Farmaceutiskt aktiva karboxialkyldipeptider, såsom
enalapril, lisinopril och motsvarande framställes från
ett som utgångsämne använd aminosyra, såsom L-alanin, ge-
nom att skydda syrafunktionen i aminosyran med en alkyl-
silylgrupp medan denna reagerar med en α -halogenester vid
sin aminofunktionen. Därefter avlägsnas silylskyddsgrup-
pen och syragruppen omsätts med aminofunktionen av en
lämplig aminosyra, såsom L-prolin, för att bilda dipep-
tidprodukten.