



PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN  
(A) TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

SUOMI—FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11)(21) Patentihakemus—Patentansökan 870474  
(51) Kv.lk.<sup>4</sup>/Int.cl.<sup>4</sup> C 07 D 233/64, 401/12,\*  
(22) Hakemispäivä—Ansökningsdag 04.02.87  
(23) Alkupäivä—Löpdag  
(41) Tullut julkiseksi—Blivit offentlig 08.08.87  
(86) Kv. hakemus—Int.ansökan  
(30) Etuoikeus—Prioritet 07.02.86 CH 486/86-0  
20.08.86 CH 3347/86-1

(71) Hakija/Sökande: *Ciba-Geigy AG*, Basel, Sveitsi

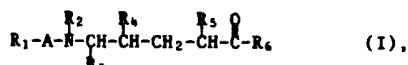
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Buehlmayer, Peter 2. Stanton, James Lawrence  
3. Fuhrer, Walter 4. Göschke, Richard 5. Rasetti, Vittorio 6.  
Rueeger, Heinrich

(74) Asiamies/Ombud: Ant-Wuorinen

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Rikkipitoisilla ryhmillä  
substituoidut 5-amino-4-hydroksivalerylijohdannaiset. Med svavel-  
haltiga grupper substituerade 5-amino-4-hydroxivalerylderivat.

(57) Tiivistelmä:

Yhdisteet, joiden kaava on



jossa  $\text{R}_1$  merkitsee tio-, sulfinyli- tai sulfonyyliryhmällä  
substituoitua asyyliä A merkitsee mahdollisesti N-alkyloitua  
α-aminohappotähdettä, joka on yhdistetty N-terminaaliseen  
tähteeseen  $\text{R}_1$  ja C-terminaaliseen ryhmään  $-\text{NR}_2-$ ,  $\text{R}_2$  mer-  
kitsee vetyä tai alempialkyliä,  $\text{R}_3$  merkitsee vetyä, ale-  
mpialkyliä, mahdollisesti eetteröityä tai esteröityä  
hydroksialempialkyliä, sykloalkyliä, sykloalkylialempial-  
kyliä, bisykloalkylialempialkyliä, trisykloalkylialempia-  
lkkyliä, aryliä tai aryylialempialkyliä,  $\text{R}_4$  merkitsee  
hydroksia, eetteröityä tai esteröityä hydroksia,  $\text{R}_5$  merkit-  
see alempialkyliä, mahdollisesti eetteröityä tai esteröityä  
hydroksialempialkyliä, sykloalkyliä, sykloalkylialempial-  
kyliä, bisykloalkyliä, bisykloalkylialempialkyliä, tri-  
sykloalkyliä, trisykloalempialkyliä, aryliä, aryylialem-  
pialkyliä, mahdollisesti substituoitua karbamoyliä, mah-  
dollisesti substituoitua aminoa, mahdollisesti substituoitua  
hydroksia tai mahdollisesti substituoitua merkaptoa ja  $\text{R}_6$   
merkitsee substituoitua aminoa sekä tälläisten suolanmuodos-  
tavia ryhmiä sisältävät suolat estäävät reniini-entsyymin ve-  
renpainetta nostavaa vaikutusta ja niitä voidaan käyttää  
antihypertensiivisinä aineina.

Jatkuu seur. sivulla  
Forts. nästa sida

(57) Sammandrag:

Föreningar med formeln I i vilken R<sub>1</sub> är med en tio-, sulfinyl- eller sulfonylgrupp substituerad acyl, A en eventuellt N-alkylerad α-aminosyrest, vilken N-terminalt är bunden med gruppen R<sub>1</sub> och C-terminalt med gruppen -NR<sub>2</sub>-, R<sub>2</sub> betecknar väte eller lågalkyl, R<sub>3</sub> betecknar väte, lågalkyl, eventuellt företrad eller förestrad hydroxilågalkyl, cykloalkyl, cykloalkyllågalkyl, bicycloalkyllågalkyl, tricycloalkyllågalkyl, aryl eller aryllågalkyl, R<sub>4</sub> betecknar hydroxi, företrad eller förestrad hydroxi, R<sub>5</sub> betecknar lågalkyl, eventuellt företrad eller förestrad hydroxilågalkyl, cykloalkyl, cykloalkyllågalkyl, bicycloalkyl, bicycloalkyllågalkyl, tricycloalkyl, tricycloalkyllågalkyl, aryl, aryllågalkyl, eventuellt substituerad karbamoyl, eventuellt substituerad amino, eventuellt substituerad hydroxi, eller eventuellt substituerad merkapto, sulfinyl eller sulfonyl och R<sub>6</sub> substituerad amino, och salter av dylika föreningar med saltbildande grupper, hämmar renin-enzymets blodtrycksteckande verkan och kan användas som antihypertensiva medel.

