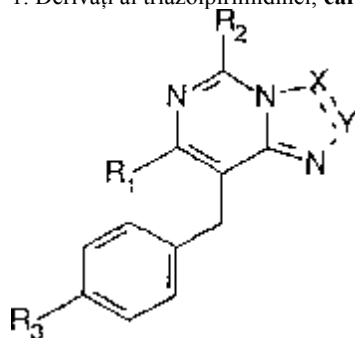


Revendicări:

1. Derivați ai triazolpirimidinei, **caracterizați prin aceea că** ei corespund formulei generale (I):



Formula (I)

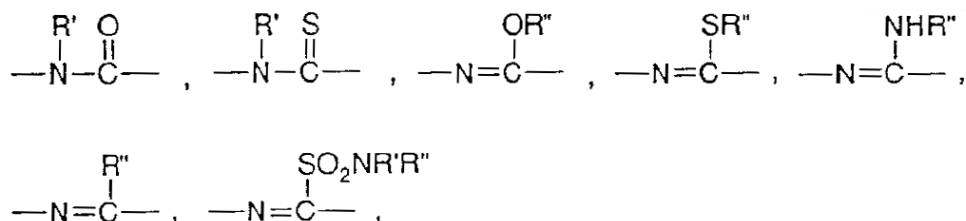
în care:

R₁ reprezintă radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau radical cicloalchil cu C₃-C₇,

R₂ reprezintă atom de hidrogen, radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, radical halogeno alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, grupa NR₄R'₄, grupa NH-NH₂, grupa (CH₂)_mOR₄, (CH₂)_mSR₄,

R₄ și R'₄, identici sau diferiți, reprezintă atom de hidrogen, radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, și m reprezintă număr întreg de la 0 până la 5,

ansamblul $\text{---X}=\text{---Y---}$ sau $\text{---Y}=\text{---X---}$ reprezintă unul din următorii radicali bivalenți:

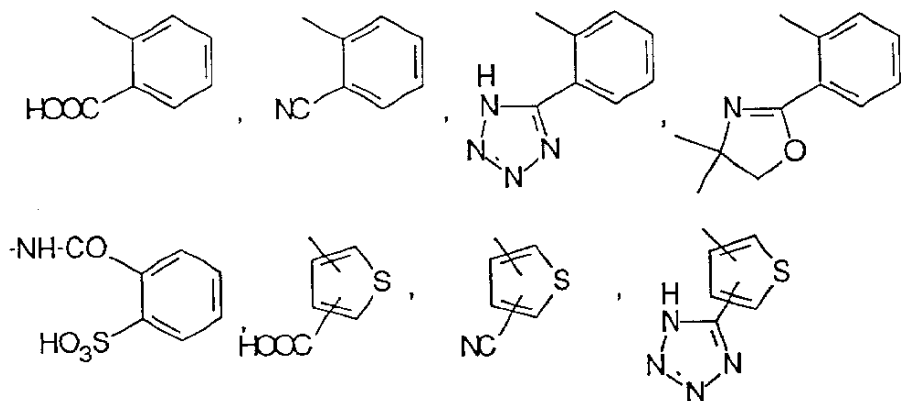


în care R' și R'', identici sau diferiți, reprezintă:

atom de hidrogen, radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, radical halogen alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, grupa (CH₂)_nCOOR₅, (CH₂)_n-OR₅, (CH₂)_n-O-CO-R₅, (CH₂)_nSR₅; n fiind număr întreg de la 0 până la 5, n' fiind număr întreg de la 1 până la 5 și R₅ fiind atom de hidrogen sau radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

radical fenil, piridil, tienil sau furil,

R₃ reprezintă grupa NO₂, NH₂ sau următorii radicali:



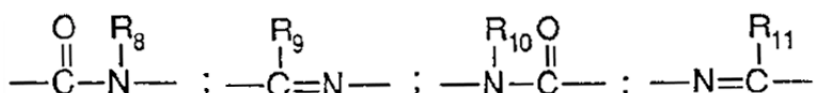
derivații sus-citați trebuie să fie luați în considerare și sub formele lor tautomere și pot să se prezinte sub forma sărurilor sale aditive, în special, a sărurilor sale aditive farmaceutic acceptabile.

2. Derivați de triazolpirimidină, conform revendicării 1, **caracterizați prin aceea că**:

R₁ reprezintă radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau radical cicloalchil cu C₃-C₇;

R₂ reprezintă atom de hidrogen, radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, grupa NH-NH₂, grupa (CH₂)_mOR₄, (CH₂)_mSR₄; R₄ reprezentând atom de hidrogen, radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, și m reprezentând număr întreg de la 0 până la 2;

ansamblul $\text{---X}=\text{---Y---}$ reprezintă radical ales dintre următorii radicali bivalenți:



în care

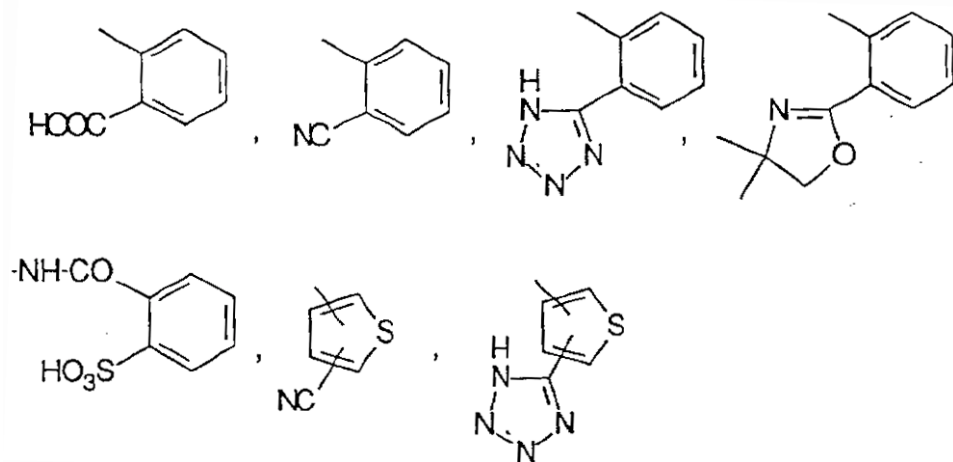
R_8 reprezintă radical ales din grupa constituită din atom de hidrogen, $-(CH_2)_nOH$, $(CH_2)_nCOOH$, $-R_{12}$, $-(CH_2)_nCOOR_{12}$; R_{12} reprezentând radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, și n fiind număr întreg egal cu 1 sau 2;

R_9 reprezintă atom de hidrogen sau radical $-SH$;

R_{10} reprezintă atom de hidrogen sau radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

R_{11} reprezintă radical ales din grupa constituită de atomul de hidrogen, radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, radical halogenoalchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, fenil, piridinil, $-O(CH_2)_nOH$, $-OR_{12}$, $-O(CH_2)_nOCOR_{12}$, SH , $-SR_{12}$, $-S(CH_2)_nCOOR_{12}$, $-S(CH_2)_nOCOR_{12}$, $-NH(CH_2)_nCOOR_{12}$, $-NR_{13}R_{14}$, $SO_2NR_{13}R_{14}$, $(CH_2)_nOH$, $(CH_2)_nOR_{12}$, $COOH$, $COOR_{12}$, $(CH_2)_nCOOH$, $(CH_2)_nCOOR_{12}$; n și R_{12} fiind definiți anterior, R_{13} și R_{14} , identici sau diferiți, reprezentând atom de hidrogen sau radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

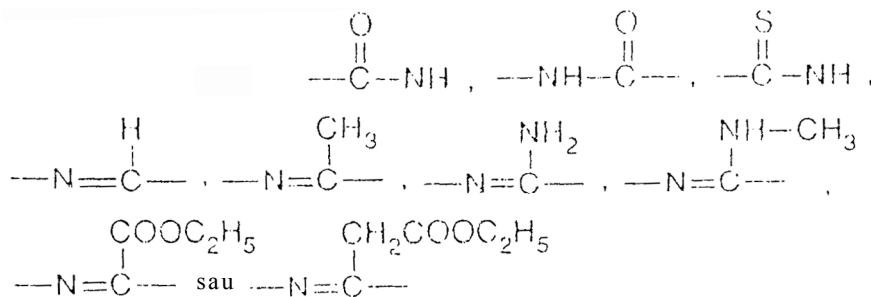
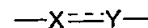
R_3 reprezintă unul din următorii radicali:



3. Derivați, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizați prin aceea că** R_1 este grupa aleasă dintre: etil, n-propil și n-butil.

4. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 3, **caracterizați prin aceea că** R_2 este grupa aleasă dintre: metil, etil sau metoxi metil.

5. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 4, **caracterizați prin aceea că** ansamblul reprezintă unul din următorii radicali bivalenți:



sau formele lor tautomere.

6. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 5, **caracterizați prin aceea că** R_3 este grupa (tetrazolil-5)-2 fenil.

7. Derivați, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizat prin aceea că** este vorba de derivatul:

n-propil-7 metil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină on-2 (3H).

8. Derivați, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizați prin aceea că** ei se aleg dintre derivații:

-n-propil-7 metil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [4,3-c] pirimidină on-3 (2H);

-n-propil-7 metil-5 mercapto-3 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [4,3-c] pirimidină;

-n-propil-7 dimetil-2,5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină;

-n-propil-7 metil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină;

-n-propil-7 metil-5 amino-2 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină;

-n-propil-7 metil-5 metilamino-2 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină;

-[n-propil-7 metil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină -il-2] carboxilat de etil;

-[n-propil-7 metil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină -il-2] acetat de etil;

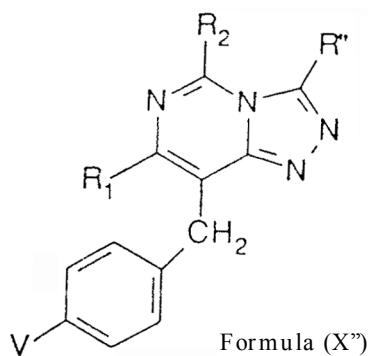
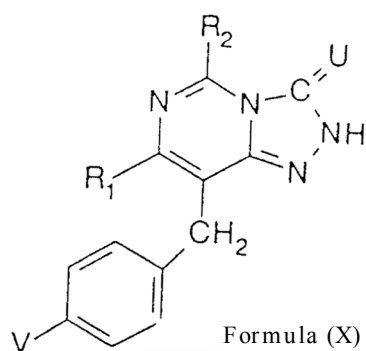
-etil-7 dimetil-2,5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină;

-n-butil-7 metil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină on-2 (3H);

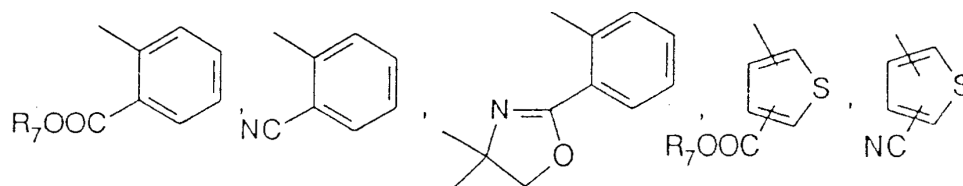
-n-propil-7 etil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină on-2 (3H);

-n-propil-7 metoximetil-5 [[(tetrazolil-5)-2' bifenil-il-4] metil]-8 1,2,4-triazol [1,5-c] pirimidină on-2 (3H).

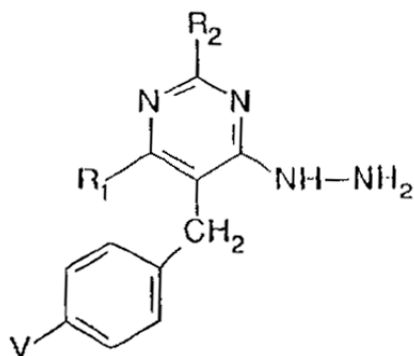
9. Procedeu de preparare a compușilor cu formula (I), conform uneia din revendicările de la 1 până la 8, **caracterizat prin aceea că** conține la preparare un compus intermediar cu formulele (X) sau (X')



în care R_1 , R_2 sunt definiți în revendicarea 1; V reprezintă grupa aleasă dintre radicalii NO_2 ,



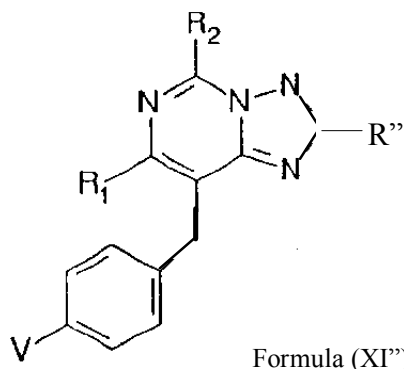
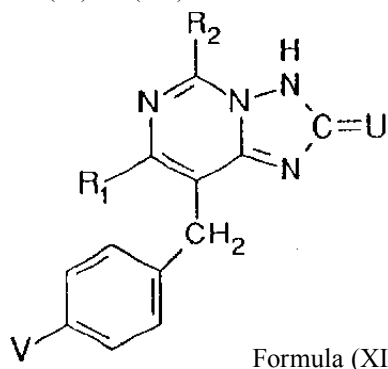
R_7 reprezentând radical alchil inferior sau benzil; U reprezintă atom de oxigen sau de sulf sau grupa $\text{N-R}''$, R'' este definit în revendicarea 1; prin ciclizarea compușilor cu formula (IX):



în care R_1 , R_2 și V sunt definiți mai sus, numită ciclizare fiind realizată prin acțiunea asupra compușilor cu formula (IX):

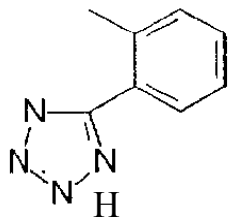
- fie cu carbonil diimidazol în reflux în tetrahidrofuran;
- fie cu uree prin încălzire fără solvent sau cu solvent, ca N -metil pirolidona;
- fie cu xantogenat de potasiu în reflux în alcool, ca metoxi etanolul;
- fie cu sulfură de carbon în alcool în prezența sau fără amină, ca trietilamina;
- fie cu izocianat, urmat de tratarea cu POCl_3 ;
- fie cu izotiocianat, urmat de metilarea în SCH_3 cu iodură de metil, apoi ciclizarea termică;
- fie cu orto ester prin încălzire;
- fie încă cu clorură de acid, urmată de ciclizarea cu ajutorul POCl_3 .

10. Procedeu de preparare, conform revendicării 9, caracterizat prin aceea că conține prepararea unui compus intermediar cu formula (XI) sau (XI'')

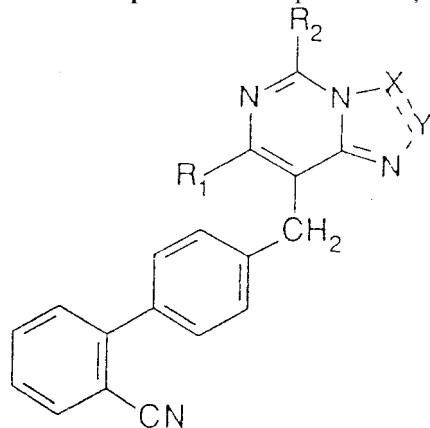


în care R_1 , R_2 , V , U și R'' sunt definiți mai sus, prin izomerizarea compușilor sus-citați cu formulele (X) sau (X'') în mediu bazic în apă sau în amestec apă-alcool la temperatura cuprinsă între 20 și 100°C; această izomerizare poate fi realizată și în mediu acid prin încălzire în acid acetic în prezența sau fără acetat de sodiu sau de potasiu, sau și în diclor benzen în prezența acidului formic.

11. Procedeu de preparare a compușilor cu formula (I), în care R_3 reprezintă grupa



caracterizat prin aceea că se pune în reacție compusul cu formula:



în care R_1 , R_2 , X și Y sunt definiți mai sus, cu azotura de sodiu în dimetil formamidă în prezența sării de amoniu, ca clorura de amoniu, la temperatura cuprinsă între 100 și 150°C, sau, de exemplu, prin încălzire în toluen sau xilenă cu azotură de trimetil cositor, urmată de tratarea cu gaz clorhidric în tetrahidrofuran.

12. Compoziție farmaceutică, **caracterizată prin aceea că** ea conține o cantitate farmaceutic eficientă de, cel puțin, un compus cu formula (I), definit în una din revendicările de la 1 până la 8, sau de una din sărurile lui aditive farmaceutic acceptabile, eventual încorporate într-un excipient, vehicul sau suport farmaceutic acceptabil.

13. Compoziție farmaceutică cu activitate antagonistă a receptorilor angiotensinei II, ce face posibilă tratarea favorabilă a bolilor cardiovasculare, în special, a hipertensiunii, a insuficienței cardiace, a afecțiunilor peretelui arterial, **caracterizată prin aceea că** ea conține o cantitate farmaceutic eficientă de, cel puțin, un compus cu formula (I), definit în una din revendicările de la 1 până la 8, sau de una din sărurile lui aditive farmaceutic acceptabile, eventual încorporate într-un excipient, vehicul sau suport farmaceutic acceptabil.

14. Procedeu de preparare a compoziției farmaceutice, **caracterizat prin aceea că** conține cel puțin un compus cu formula (I), definit în una din revendicările de la 1 până la 8, sau una din sărurile sale aditive farmaceutic acceptabile, într-un excipient, vehicul sau suport farmaceutic acceptabil.

15. Procedeu, conform revendicării 14, **caracterizat prin aceea că** compoziția farmaceutică este sub formă de gelule, comprimate, dozate de la 1 până la 400 mg, sau sub formă de preparate injectabile, dozate de la 0,01 până la 50 mg.