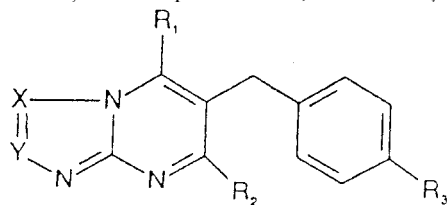


Revendicări:

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

**Formula (I)**

în care:

unul din radicalii R_1 și R_2 reprezintă:

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- un radical eter cu formula $-(CH_2)_pOR$, în care p este număr întreg de la 1 până la 6 și R reprezintă un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau radical benzil;

- un radical alcool cu formula $-(CH_2)_pOH$, în care p are valorile definite mai sus;

celălalt radical din R_1 și R_2 reprezintă:

- atomul de hidrogen;

- atom de halogen;

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- un radical, selectat din grupa ce conține radicalii N_3 , OR_4 , SR_4 , NR_5R_6 , $NH(CH_2)_n-NR_5R_6$, în care R_4 reprezintă:

- atomul de hidrogen;

- radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical cicloalchil C_3-C_7 ;

- un radical $(CH_2)_m-COOR'$, m fiind un număr întreg de la 1 până la 4, R' reprezintă un atom de hidrogen sau un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- un radical $(CH_2)_m-O-R'$, m și R' având valorile definite mai sus;

R_5 și R_6 , identici sau diferiți, reprezintă:

- atomul de hidrogen;

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical cicloalchil C_3-C_7 ;

sau

- R_5 și R_6 , împreună cu atomul de azot cuplat cu ei, formează un heterociclu, selectat dintre morfolină, pirolidină sau piperidină;

- n este număr întreg de la 1 până la 4;

- X și Y , diferiți, reprezintă:

- unul, atomul de azot,

- celălalt, o grupă $C-R_7$, în care R_7 reprezintă:

- atomul de hidrogen;

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon sau un radical cicloalchil C_3-C_7 ;

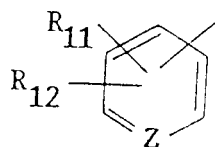
- un radical $(CH_2)_n-OH$, în care n este un număr întreg de la 0 până la 4;

- un radical SR' , R' are valorile definite mai

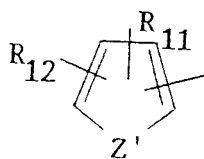
sus;

- un radical NR_5R_6 , în care R_5 și R_6 , identici sau diferiți, reprezintă atomul de hidrogen sau un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon sau un radical cicloalchil C_3-C_7 ;

- R_3 reprezintă un radical cu formula:



sau



în care:

- Z reprezintă CH , N sau Z' reprezintă S , O ;

- R_{11} reprezintă atomul de hidrogen sau atom de halogen;

- R_{12} reprezintă un radical tetrazol, CN , $COOH$, $CONH_2$, de asemenea

formele lor tautomere și sărurile lor aditive, în special, sărurile aditive farmaceutic acceptabile.

2. Derivați, conform revendicării 1, **caracterizați prin aceea că** corespund formulei generale (I) menționate anterior, în care:

unul din radicalii R_1 și R_2 reprezintă:

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- un radical eter cu formula $-(CH_2)_pOR$, în care p este un număr întreg de la 1 până la 6 și R reprezintă un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical benzil;

- un radical alcool cu formula $-(CH_2)_pOH$, în care p are valorile definite mai sus;

- celălalt radical din R_1 și R_2 reprezintă:

- atom de hidrogen;

- atom de halogen;

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- un radical, selectat din grupa ce conține radicalii N_3 , OR_4 , SR_4 , NR_5R_6 , $NH(CH_2)_n-NR_5R_6$;

în care:

R_4 reprezintă:

- atomul de hidrogen,
 - un radical $-(CH_2)_m-O-R'$, în care m este un număr întreg de la 1 până la 4 și R' reprezintă un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon,

R₅ și R₆, care pot fi atât identici, cât și diferiți, reprezintă:

- atomul de hidrogen, sau

- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau

R₅ și R₆, împreună cu atomul de azot cuplat cu ei, formează un heterociclu, selectat dintre morfolină, pirolidină sau piperidină;

- n este număr întreg de la 1 până la 4;

- X și Y, diferiți, reprezintă:

- unul, atomul de azot,

- altul, grupa C-R₇, în care R₇ reprezintă:

- atomul de hidrogen;

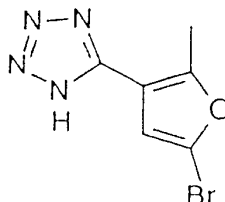
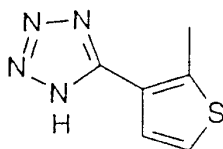
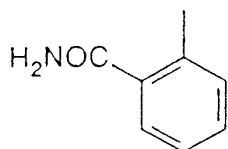
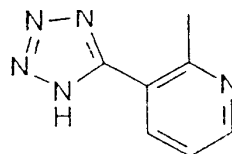
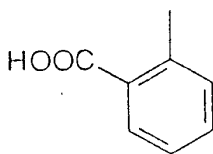
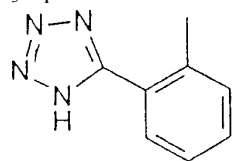
- un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- un radical $(CH_2)_n-OH$, în care n' este un număr întreg de la 0 până la 4;

- un radical SR', R' având valorile definite mai sus;

- un radical NR₅R₆, în care R₅ și R₆, identici sau diferiți, reprezintă atomul de hidrogen sau un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon;

- R₃ reprezintă unul din următorii radicali:



3. Derivați, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizați prin aceea că** R₁ este o grupă n-propil, n-butil sau N-dietilamino.

4. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 3, **caracterizați prin aceea că** R₂ este o grupă hidroxi, n-propil sau N-dietilamino.

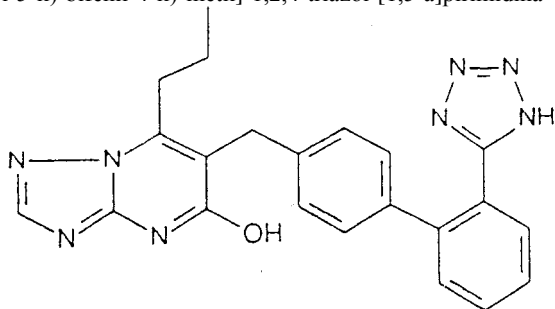
5. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 4, **caracterizați prin aceea că** R₃ este o grupă 2-(1-H-tetrazol-5-il)fenil.

6. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 5, **caracterizați prin aceea că** X este un atom de azot.

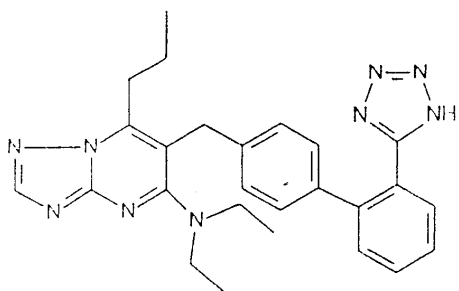
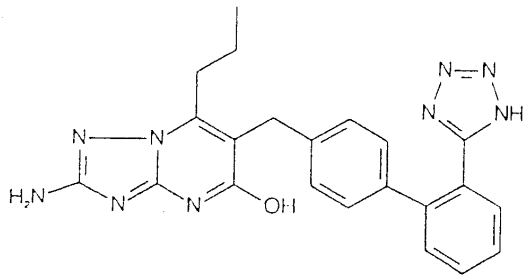
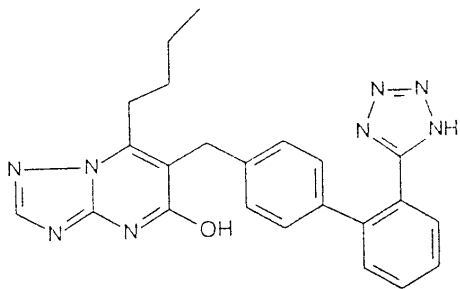
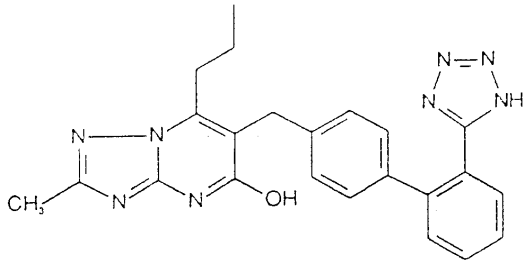
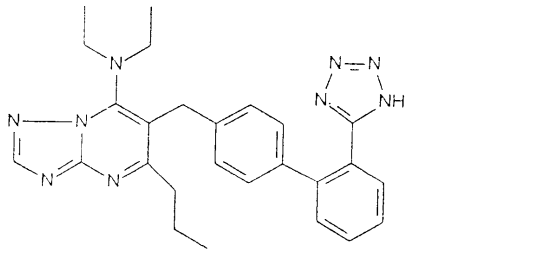
7. Derivați, conform uneia din revendicările de la 1 până la 6, **caracterizați prin aceea că** Y reprezintă o grupă CH, C-CH₃ sau C-NH₂.

8. Derivați, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizați prin aceea că** R₁ este un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, R₂ este o grupă hidroxi, R₃ este o grupă 2-(1-H-tetrazol-5-il)fenil, X reprezintă atomul de azot și Y reprezintă o grupă CH, C-CH₃.

9. Derivat, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizat prin aceea că** el trebuie să fie derivatul: 5-hidroxi-7-propil-6-[(2'-(1-H-tetrazol-5-il)-bifenil-4-il)-metil]-1,2,4-triazol-[1,5-a]pirimidină

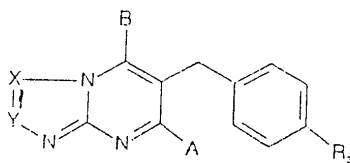


10. Derivați, conform revendicării 1 sau 2, **caracterizați prin aceea că** ei sunt selectați dintre derivații cu formula:



11. Procedeu de preparare a compușilor cu formula (I), conform uneia din revendicările de la 1 până la 10, **caracterizat prin aceea că el include:**

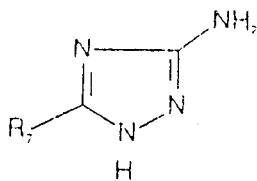
a) prepararea unui compus cu formula (a):



Formula (α)

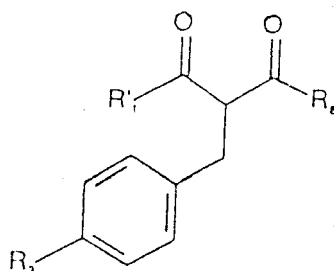
în care:

- X, Y și R₃ au valorile definite în revendicarea 1;
- A și B, reprezintă: unul, o grupă hidroxi sau un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, celălalt un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical eter cu formula -(CH₂)_p-OR, în care p este număr întreg de la 1 până la 6 și R reprezintă un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical benzil, prin condensarea 3-amino-1,2,4-triazolului cu formula (II):



Formula(II)

în care R₇ este definit în revendicarea 1, cu un derivat cu formula (b):



Formula (β)

în care R₁' este un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical eter cu formula -(CH₂)_p-OR, în care p este număr întreg de la 1 până la 6 și R este un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau un radical benzil, R₈ reprezintă un radical alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, sau o grupă O-alchil inferior, ce conține de la 1 până la 6 atomi de carbon, de preferință metil sau etil și R₃ are semnificațiile definite în revendicarea 1, într-un solvent aprotonic, așa ca diclor- sau triclorbenzenul, sau într-un solvent acid, așa ca acidul acetic, sau într-un alcool în prezența alcoolatului de sodiu sau de potasiu, respectiv, sau în piridină sau 2-metil-5-etilpiridină în prezența 4-dimetilaminopiridinei sau fără aceasta la o temperatură cuprinsă între 50⁰C și 200⁰C;

- b) eventual, protecția funcției purtate de R₃ conform unuia din procedeele cunoscute ca atare;
- c) încălzirea derivatului astfel obținut din derivatul cu formula (b), în cazul în care acesta este un cetoester, într-un reactiv potrivit, ca de exemplu POC₃, pentru a transforma grupa hidroxi, reprezentată prin A sau B, într-un atom de clor;
- d) încălzirea acestui derivat clorat în prezența unui nucleofil azotat, oxigenat sau sulfurat într-un alcool în reflux sau în autoclavă la 100⁰C, în prezența unei baze, așa ca de exemplu Na₂CO₃, sau fără aceasta, pentru a obține un derivat cu formula (a), în care A și B au aceleași valori ca și R₁ și R₂, respectiv;
- e) eventual, deprotecția funcției ce o posedă R₃;
- e₁) transformarea acestei funcții într-o funcție de acid, de exemplu prin hidroliză, în cazul în care această funcție este de nitril; sau

e₂) transformarea acestei funcții într-o funcție de tetrazol, de exemplu în cazul în care această funcție reprezintă un nitril, prin acțiunea azotării de trialchilenă la încălzirea toluenului sau xilenului, urmată de o tratare cu acid clorhidric gazos în tetrahydrofuran; sau

e₃) transformarea acestei funcții în funcție de amidă, de exemplu în cazul în care această funcție este un nitril, prin acțiunea acidului sulfuric sau prin acțiunea apei oxigenate sau încă prin acțiunea acidului polifosforic; și

f) eventual, transformarea derivatului astfel obținut într-o sare aditivă, de preferință, farmaceutic acceptabilă.

12. Compoziție farmaceutică, în special, cu activitate de antagonist al receptorilor angiotensinei II, ce permite tratărea și prevenirea eficientă a afecțiunilor cardiovasculare, în special, a hipertensiunii, insuficienței cardiace, 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 10, sau de una din sărurile lui aditive farmaceutic acceptabile, eventual, încorporată într-un excipient, vehicul sau suport farmaceutic acceptabil.

13. Compoziție farmaceutică, în special, cu activitate antiproliferativă, ce permite tratărea și prevenirea eficientă a afecțiunilor peretelui arterial, în special, a aterosclerozei, **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 10, sau de una din sărurile lui aditive farmaceutic acceptabile, eventual, încorporată într-un excipient, vehicul sau suport farmaceutic acceptabil.