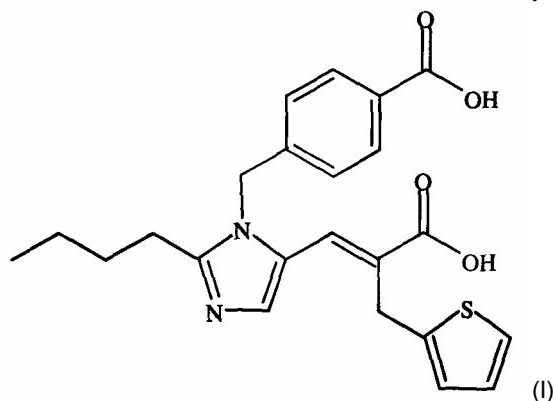
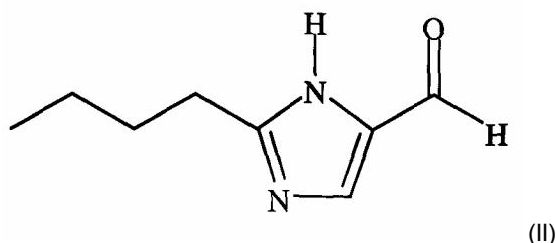


1. Спосіб одержання епросартану, сполуки формули (I)



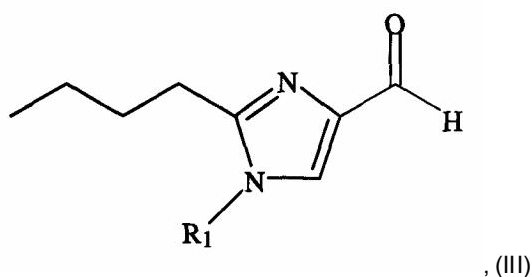
або її фармацевтично прийнятної солі,
який включає стадії:

(i) обробки сполуки формули (II)

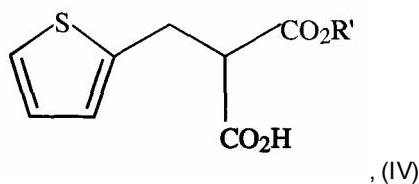


основною з наступною реакцією з ділянкоселективним азотозахисним реагентом;

(ii) реагування сполуки формули (III)

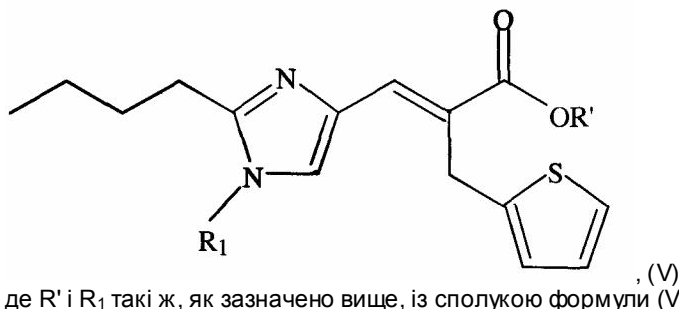


де R₁ є азотозахисна група, яка складається або (1) з етиленового містка, що сполучає азот з електронноакцепторною групою, такою як ефірна (COOR", де R" = C₁₋₄алкіл), кислотна, карбонільна, нітрильна, сульфенова або сульфоксидна група, або (2) з метиленового містка, що сполучає азот з півалатною, 2-(триметилсиліл)етокси-, метокси-, трет-бутоксид- або бензилоксигрупою, із сполукою формули (IV)

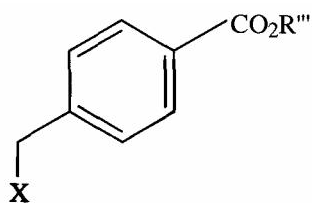


де R' є C₁₋₄алкіл, в присутності каталізатора; і

(iii) реагування сполуки формули (V)



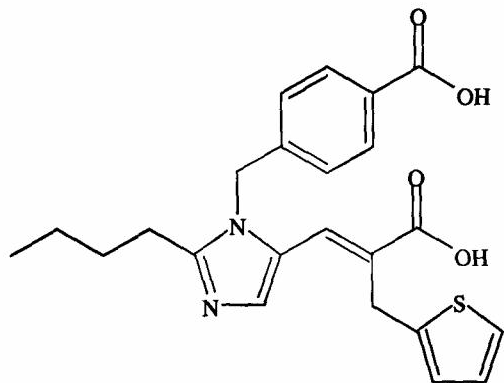
де R' і R₁ такі ж, як зазначено вище, із сполукою формули (VI)



, (VI)

де R''' є C₁₋₄алкіл і X є галоген або OR*, де R* є CH₃SO₂- або p-CH₃C₆H₄SO₂-, при підвищених температурах; і після цього гідролізування R' і R''' ефірних груп та видалення N-3 захисної групи, і необов'язкове утворення фармацевтично прийнятної солі.

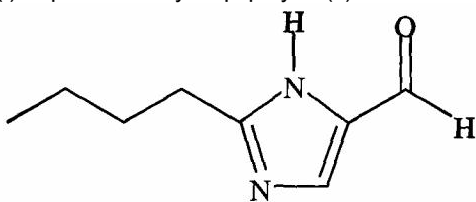
2. Спосіб за п. 1 одержання епросартану, сполуки формули (I)



(I)

або її фармацевтично прийнятної солі, який включає стадії:

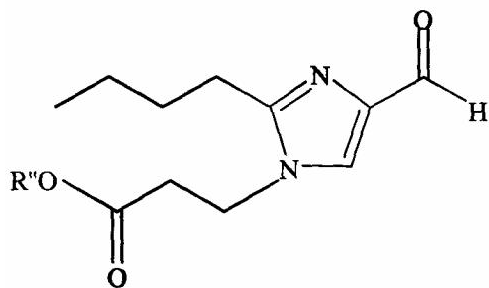
(i) обробки сполуки формули (II)



(II)

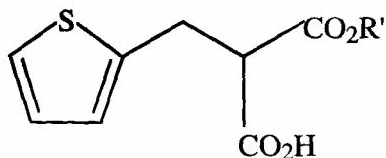
основною з наступною реакцією з C₁₋₄алкілефірною похідною акрилової кислоти;

(ii) реагування сполуки формули (IIIb)



, (IIIb)

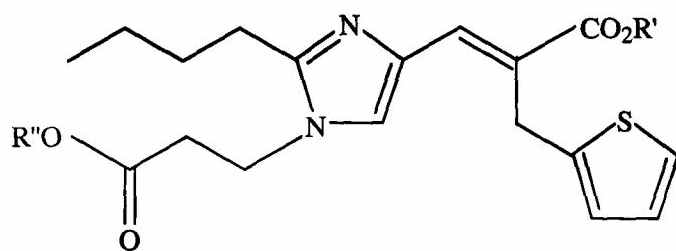
де R'' є C₁₋₄алкіл, із сполукою формули (IV)



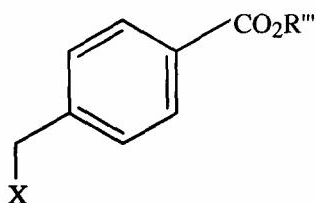
, (IV)

де R' є C₁₋₄алкіл, в присутності каталізатора; і

(iii) реагування сполуки формули (Vb)



де R' і R'' такі ж, як визначено вище, із сполукою формули (VI) , (Vb)

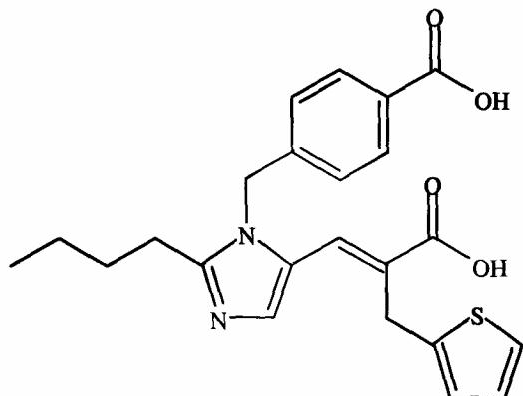


, (VI)

де R''' є C₁₋₄ алкіл і X є галоген, при підвищених температурах;

і після цього гідролізування R' і R''' ефірних груп та видалення N-3 захисної групи, і необов'язкове утворення фармацевтично прийнятної солі.

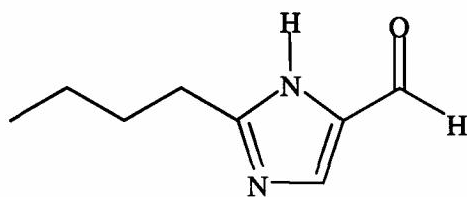
3. Спосіб за п. 1 одержання епросартану, сполуки формули (I)



(I)

або її фармацевтично прийнятної солі, який включає стадії:

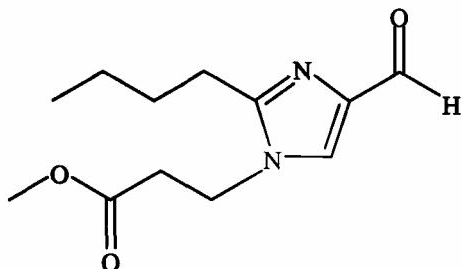
(i) обробки сполуки формули (II)



(II)

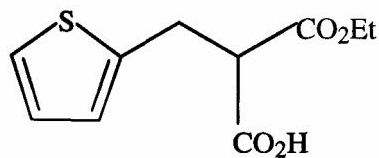
1,8-дізабіцикло[5.4.0]ундек-7-еном із наступною реакцією з метилакрилатом;

(ii) реагування сполуки формули (IIIa)



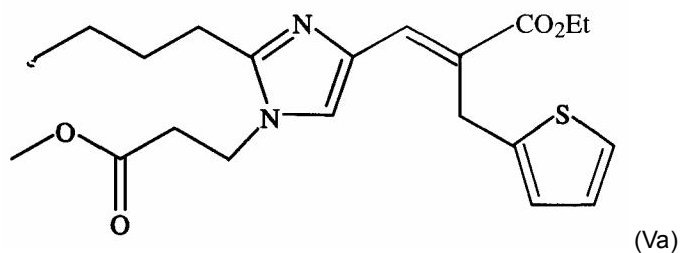
(IIIa)

із сполукою формули (IVa)

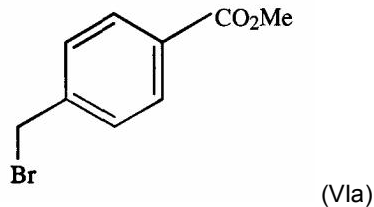


(IVa)

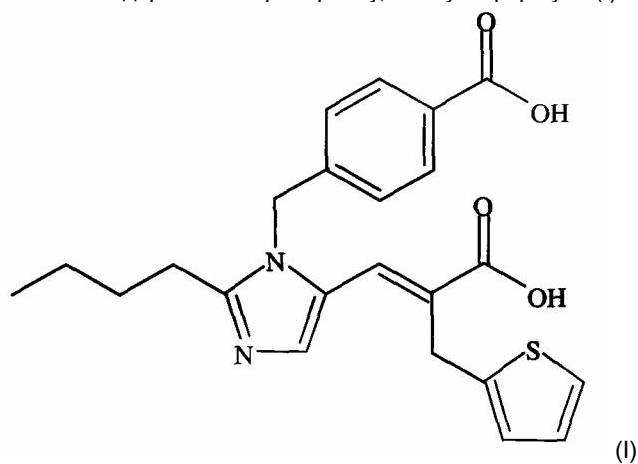
в присутності піперидину; і
(iii) реагування сполуки формули (Va)



із сполукою формули (Vla)

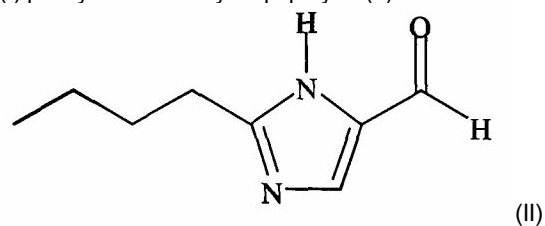


при підвищених температурах;
і після цього гідролізування ефірних груп та видалення N-3 захисної групи,
і необов'язкове утворення фармацевтично прийнятної солі.
4. Спосіб одержання епросартану, сполуки формули (I)

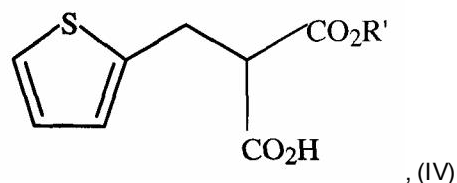


або її фармацевтично прийнятної солі,
який включає стадії:

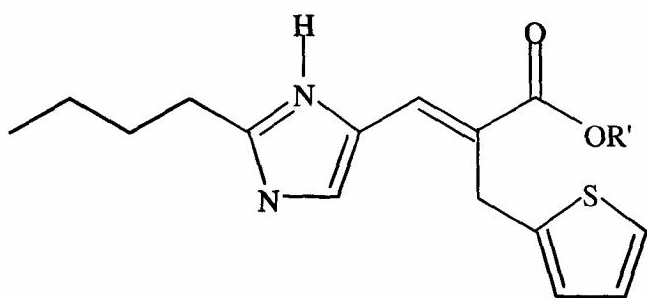
(i) реагування сполуки формули (II)



із сполукою формули (IV)

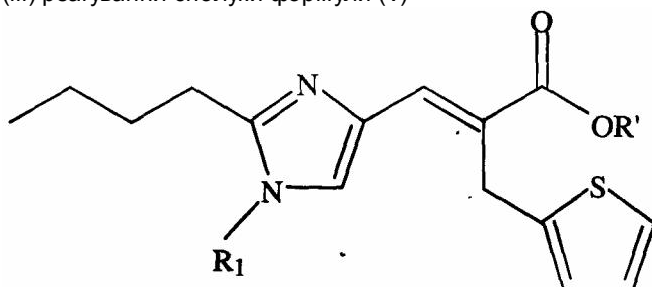


де R' є C₁₋₄ алкіл, в присутності каталізатора;
(ii) обробки сполуки формули (VI)



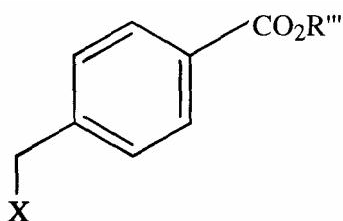
(VII)

основною з наступною реакцією з ділянкоселективним азотозахисним реагентом; і
(iii) реагування сполуки формули (V)



(V)

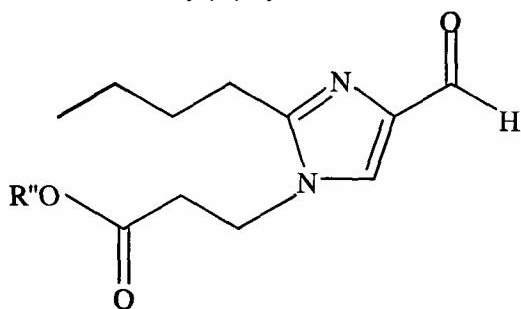
де R' такий, як визначено вище, і R₁ є азотозахисна група, яка складається або (1) з етиленового містка, що сполучає азот з електроноакцепторною групою, такою як ефірна (COOR'', де R'' = C₁₋₄алкіл), кислотна, карбонільна, нітрильна, сульфонова або сульфоксидна, або (2) з метиленового містка, що сполучає азот з півалатною, 2-(триметилсиліл)етокси-, метокси-, трет-бутоксид- або бензилоксигрупою, із сполукою формули (VI)



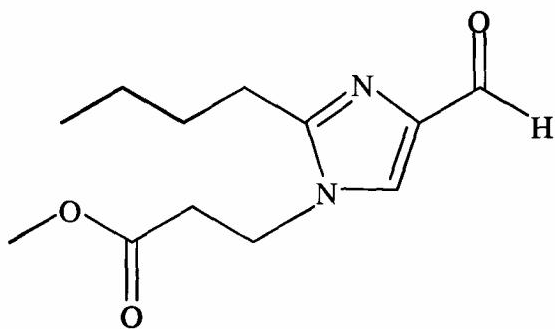
(VI)

де R''' є C₁₋₄алкіл і X є галоген або OR*, де R* є CH₃SO₂- або p-CH₃C₆H₄SO₂-, при підвищених температурах; і після цього гідролізування R' і R''' ефірних груп та видалення N-3 захисної групи, і необов'язкове утворення фармацевтично прийнятної солі.

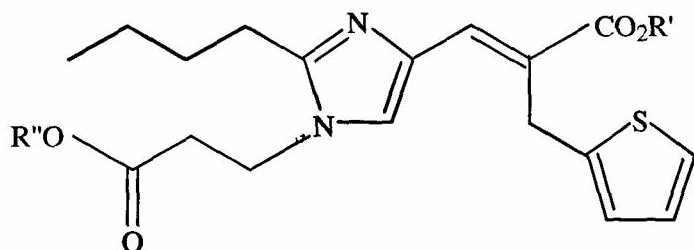
5 Похідні імідазолу формули



де R'' є C₁₋₄алкіл,
які є проміжними сполуками для одержання сполуки формули (I).
6. Сполука за п. 5, яка є

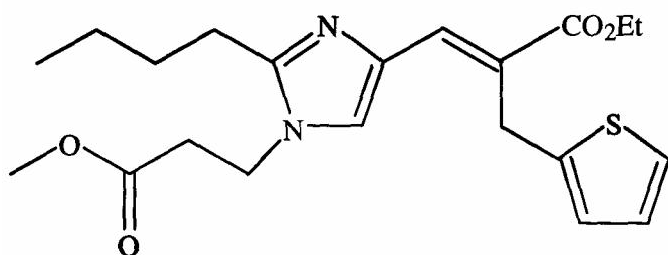


7. Похідні імідазолу формули

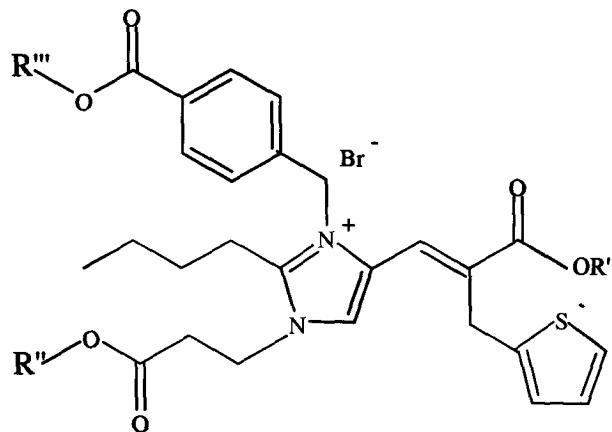


де R' і R'' незалежно є C₁₋₄ алкілами, які є проміжними сполуками для одержання сполуки формули (I).

8. Сполука за п. 7, яка є



9. Похідні імідазолу формули



де R'' та R''' незалежно є C₁₋₄ алкілами, які є проміжними сполуками для одержання сполуки формули (I).

10. Сполука за п. 9, яка є

