1. Būdas, apimantis:

junginio, kurio formulė II:



kurioje PG yra blokuojanti grupė, ir LG1 yra atskylanti grupė, reakciją su etileno oksidu, dalyvaujant

(a) alkilličiui ir vario (I) druskai; arba

(b) alkilličiui ir Luiso rūgščiai, ir

tirpikliui,

gaunant junginį, kurio formulė III:



2. Būdas pagal 1 punktą, kur PG yra blokuojanti grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš sililo blokuojančios grupės, tetrahidropiranilo, metoksimetilo ir benzilo; ir, geriau, kai etileno oksidas, alkillitis ir vario (I) druska arba Luiso rūgštis pridedami į reakcijos mišinį, apimantį acid are added into the reaction Formulės IIjunginį, palaikant reakcijos mišinio tempereratūrą žemiau-20 °C; ir dar geriau, kai etileno oksidas, alkillitis ir vario (I) druska arba Luiso rūgštis pridedami į reakcijos mišinį, palaikant reakcijos mišinio tempereratūrą žemiau -55 °C; ir dar geriau, kai etileno oksidas pridedamas į reakcijos mišinį po to, kai pirmiau pridedamas alkillitis.

3. Būdas pagal 1 arba 2 punktą, kur, sudėjus reagentus, reakcijos mišiniui leidžiama sušilti iki kambario temperatūros.

4. Būdas pagal bet kurį iš 1-3 punktų, kur reakcija vykdoma dalyvaujant alkilličiui ir vario (I) jodidui; ir, geriau, alkillitis ir vario (I) jodidas pridedami palaikant reakcijos temperatūrą žemiau -55 °C.

5. Būdas pagal 1 punktą, apimantis:

junginio, kurio formulė II:



kurioje PG yra blokuojanti grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš sililo blokuojančios grupės, tetrahidropiranilo ir metoksimetilo, ir LG1 yra atskylanti grupė,

reakciją su etileno oksidu, dalyvaujant alkilličiui ir vario (I) jodidui bei tirpikliui, kur reakcijos temperatūra palaikoma žemiau -20 °C, kai į reakcijos mišinį pridedamas alkillitis ir vario (I) jodidas, kad gautų junginį, kurio formulė III:



6. Būdas pagal 5 punktą, kur etileno oksidas pridedamas į reakcijos mišinį po to, kai pirmiau pridedamas alkillitis; ir, geriau, kai alkillitis ir vario (I) jodidas pridedamas palaikant reakcijos temperatūrą žemiau -55 °C; ir, dar geriau, kur, pridėjus reagentus, reakcijos mišiniui leidžiama sušilti iki kambario temperatūros.

7. Būdas pagal bet kurį iš 1-6 punktų, kur tirpiklis yra parinktas iš grupės, susidedančios iš nepolinio aprotoninio organinio tirpiklio ir polinio aprotoninio organinio tirpiklio arba jų mišinio; ir, geriau, tirpiklis yra nepolinis aprotoninis organinis tirpiklis; ir dar geriau, tirpiklis yra dietilo eteris arba tret-butilo metilo eteris arba jų mišinys.

8. Būdas pagal 1 punktą, kur būdas apima:

(a) junginio, kurio formulė II:



reakciją su alkilličiu pirmajame tirpiklyje tam tikroje temperatūroje, kad gautų pirmąjį reakcijos mišinį; kur:

temperatūra yra žemiau -20 °C;

PG yra blokuojanti grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš sililo blokuojančios grupės, tetrahidropiranilo, metoksimetilo ir benzilo; ir LG1 yra atskylanti grupė, ir

arba

(b) etileno oksido tirpalo antrajame tirpiklyje minėtoje temperatūroje pridėjimą į minėtą pirmąjį reakcijos mišinį minėtoje temperatūroje, kad gautų antrąjį reakcijos mišinį; ir

(c) vario (I) druskos arba Luiso rūgšties pridėjimą į minėtą antrąjį reakcijos mišinį minėtoje temperatūroje, kad gautų trečiąjį reakcijos mišinį, apimantį juginį, kurio formulė III;

arba

(b) vario (I) druskos arba Luiso rūgšties pridėjimą į minėtą pirmąjį mišinį minėtoje temperatūroje, kad gautų antrąjį reakcijos mišinį; ir

(c) etileno oksido tirpalo antrajame tirpiklyje minėtoje temperatūroje pridėjimą į minėtą atrąjį reakcijos mišinį minėtoje temperatūroje, kad gautų trečiąjį reakcijos mišinį, apimantį juginį, kurio formulė III.

9. Būdas pagal 8 punktą, kuriame temperatūra yra žemiau -55 °C.

10. Būdas pagal 8 arba 9 punktą, kuriame minėtam trečiajam reakcijos mišiniui leidžiama sušilti iki temperatūros 20 °C – 25 °C; ir, geriau, minėtas trečiasis reakcijos mišinys laikomas 20 °C – 25 °C tempertūroje bent 4 valandas, bent 6 valandas, bent 8 valandas arba bent 10 valandų.

11. Būdas pagal bet kurį iš 8-10 punktų, kur minėtas pirmasis tirpiklis ir minėtas antrasis tirpiklis yra kiekvienas nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš nepolinio aprotoninio organinio tirpiklio ir polinio aprotoninio organinio tirpiklio arba jų mišinio; ir, geriau, pirmasis tirpiklis ir minėtas antrasis tirpiklis yra parinktas iš grupės, susidedančios iš dietilo eterio ir metilo tret-butilo eterio arba jų mišinio.

12. Būdas pagal bet kurį iš 8-11 punktų, kur būdas apima vario (I) jodidą.

13. Būdas pagal bet kurį iš 1-12 punktų, kur PG yra parinktas iš sililo blokuojančios grupės; ir, geriau, PG yra alkilo arba arilo sililo grupė arba jų derinys; ir, dar geriau, PG yra trialkilsililo grupė; ir dar geriau, PG yra TBDMS, TMS, TES, TIPS arba TBDPS; ir, dar geriau, PG yra tret-butildimetilsililas (TBDMS).

14. Būdas pagal bet kurį iš 1-13 punktų, kur LG1 yra chloridas, bromidas, jodidas arba fluoridas; ir, geriau, LG1 yra bromidas; ir kur alkillitis yra C1-6 alkillitis; ir, geriau, alkillitis yra n-butillitis.

15. Būdas pagal bet kurį iš 1-14 punktų, papildomai apimantis minėto junginio, kurio formulė III, išskyrimą ir, pasirinktinai, išskirto formulės III junginio gryninimą.

16. Būdas pagal bet kurį iš 1-15 punktų, papildomai apimantis minėto formulės III junginio reakciją su R1-Cl, kur R1 yra organinis sulfonatas, dalyvaujant pirmajai bazei, kad gautų junginį, kurio formulė IV:



ir, geriau, organinis sulfonatas yra tozilo grupė (Ts) arba mezilo grupė (Ms); ir, dar geriau, organinis sulfonatas yra tozilo grupė; ir, dar geriau, pirmoji bazė yra vienas arba daugiau iš amino, ketvirtinio amonio druskos derinyje su šarminio metalo hidroksido vandeniniu tirpalu, tetrabutilamonio hidroksidu arbašarminio mmetalo hidroksidu; ir, dar geriau, pirmoji bazė yra ketvirtinio amonio druska derinyje su šarminio metalo hidroksido vandeniniu tirpalu; ir, dar geriau, pirmoji bazė yra tetra-n-butilamonio bromidas vandeniniame NaOH.

17. Būdas pagal 16 punktą, kur reakcija yra vykdoma dalyvaujant tirpikliui.

18. Būdas pagal 16 arba 17 punktą, papildomai apimantis minėto formulės IV junginio reakciją su 4-hidroksibenzaldehidu,



dalyvaujant antrajai bazei ir tirpikliui, kad gautų formulės V junginį:



ir

geriau, antroji bazė yra šarminio metlo karbonatas, trialkilaminas arba šarminio metalo alkoksidas; ir, dar geriau, antroji bazė yra K2CO3; ir, dar geriau, tirpiklis yra parinktas iš grupės, susidedančios iš tolueno, etanolio, 2-propanolio, THF, 2-MeTHF ir vandens arba jų mišinio; ir, dar geriau, tirpiklis yra tolueno ir etanolio mišinys.

19. Būdas pagal 18 punktą, papildomai apimantis vandens pridėjimą į reakcijos mišinį; ir, geriau, pridedamo vandens kiekis yra nuo 2 % iki 7 % t/t; ir, geriau, papildomai apimantis minėto formulės V junginio išskyrimą ir gryninimą; ir, geriau, minėtas gryninimas apima ekstrahavimą vandeniniu bisulfito tirpalu.

20. Būdas pagal 18 arba 19 punktą, papildomai apimantis minėto formulės V junginio reakciją su 2,4-tiazolidindionu,



dalyvaujant piperidinui ir, pasirinktinai, tirpikliui, ir, pasirinktinai, organinei rūgščiai, kad gautų formulės VI junginį:



21. Būdas pagal 20 punktą, kur reakcija vykdoma dalyvaujant tirpikliui; ir, geriau, tirpiklis yra parinktas iš grupės, susidedančios iš tolueno, žemesniojo alkoholio, heksano ir cikloheksano arba jų mišinio; ir, dar geriau, tirpiklis yra toluenas arba metanolis, arba jų mišinys.

22. Būdas pagal 20 arba 21 punktą, kur reakcija vykdoma dalyvaujant organinei rūgščiai; ir, geriau, organinė rūgštis yra acto rūgštis arba skruzdžių rūgštis.

23. Būdas pagal bet kurį iš 20-22 punktų, kur reakcija vykdoma temperatūrai esant nuo 45 °C iki 80 °C; ir, geriau, tirpiklis yra metanolis, o būdas vykdomas esant 47 °C temperatūrai.

24. Būdas pagal bet kurį iš 20-23 punktų, papildomai apimantis minėto formulės VI junginio redukavimą, kad gautų formulės VII junginį:



ir, geriau, redukcija vykdoma leidžiant minėtam formulės VI junginiui reaguoti su readukuojančiu agentu, dalyvaujant metalo jonui ir metalo joną kompleksuojančiam agentui; ir, dar geriau, redukuojantis agentas yra NaBH4, metalo jonas yra Co2+, ir ligandas yra dimetilglioksimas; ir, dar geriau, reakcijos mišinio pH yra palaikomas nuo pH 9,5 iki 10,5; ir, dar geriau, redukcija atliekama inertinėje atmosferoje; ir, dar geriau, redukcija atliekama azoto atmosferoje.

25. Būdas pagal 24 punktą, papildomai apimantis minėto formulės VII junginio deblokavimą, ir, pasirinktinai, papildomą apdorojimą rūgštimi, kad gautų formulės I junginį:

,



arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską; ir, geriau, kai minėto formulės VII junginio deblokavimas ir druskos susidarymas vykdomas vienu metu; ir, dar geriau, papildomai apimantis minėto formulės I junginio arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos nusodinimą; ir, dar geriau, kai minėtas nusodinimas atliekamas veikiant reakcijos mišinį poliniu aprotoniniu tirpikliu paaukštintoje temperatūroje ir po to leidžiant reakcijos mišiniui atvėsti iki kambario temperatūros; ir, dar geriau, kai polinis aprotoninis tirpiklis yra acetonitrilas.

26. Būdas pagal 25 punktą, papildomai apimanis minėtų nuosėdų, apimančių formulės I junginį arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską, išskyrimą; ir, geriau, minėtos nuosėdos išskiriamos filtruojant, kad gautų išskirtas nuosėdas; ir, dar geriau, minėtos išskirtos nuosėdos praplaunakos acetonitrilu ir (arba) acetonitrilo ir vandens mišiniu; ir, dar geriau, būdas apima papildomą minėtų išskirtų nuosėdų gryninimą.

27. Būdas pagal 25 arba 26 punktą, kur minėtas formulės I junginys yra išskiriamas kaip jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

28. Būdas pagal 25 arba 26 punktą, kur minėtas formulės I junginys yra 5-[[4-[2-[5-(1-hidroksietil)-2-piridinil]etoksi]fenil]metil]-2,4-tiazolidindiono hidrochlorido druska.

29. Būdas pagal bet kurį iš 25-28 punktų, papildomai apimanis formulės I junginio arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos deuterinimą.

30. Būdas pagal 1 arba 8 punktą, kur formulės II junginys yra gaunamas blokuojant formulės VIII, kurioje LG1 yra atskylanti grupė, junginio hidroksilo grupę:



blokuojančia grupe PG, kur PG yra parinkta iš grupės, susidedančios iš sililo blokuojančios grupės, tetrahidropiranilo, metoksimetilo ir benzilo, kad gautų formulės II junginį; ir, geriau, minėtas formulės VIII junginys reaguoja su sililo chloridu, parinktu iš grupės, susidedančios iš TBDMSCl, TMS-Cl, TBDPS-Cl ir TIPS-Cl ir imidazolo, esant aukštoms koncetracijoms DMF tirpale.

31. Būdas pagal 30 punktą, kur minėtas formulės VIII junginys yra gaunamas reaguojant formulės IX junginiui:



kur LG1 yra atskylanti grupė, su CH3CHO, dalyvaujant alkilmagnio halogenidui ir tirpikliui, kad gautų formulės VIII junginį.

32. Formulės III junginys:



kur PG yra blokuojanti grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš sililo blokuojančios grupės ir benzilo, gautas būdu pagal bet kurį iš 1-15 punktų.