

Señores
Superintendencia de Industria y Comercio
División de Nuevas Creaciones
E. S. D.

323 205

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO	
Radicación : 00001575 00000002	Folios: 59
Fecha (AMD): 2000-04-14 15:17:13	
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 RESPUESTA	
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES	

Ref: Expediente No. 00001575
Solicitud para la Patente de Invención denominada
"Derivados de Monosacáridos Como Inhibidores de
Adhesión Celular"
Solicitante: Ranbaxy Laboratories Limited

Prioridades

Solicitudes de Patente Nos. 09/276,368 presentada ante la Oficina de Patentes de Estados Unidos de América el día 25 de Marzo de 1.999, y No. 86/Del/99 presentada ante la Oficina de Patentes de la India el 15 de Enero de 1.999

Darío Cárdenas Navas, identificado como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad **Ranbaxy Laboratories Limited**, solicitante de la Patente en referencia, me permito dar respuesta formal al Auto No. 0066 notificado por estado el 2 de Marzo de 2.000 y al Concepto Técnico No. 268.

Prioridad

Las copias auténticas de las solicitudes de Patente Nos. 09/276,368 presentada ante la Oficina de Patentes de Estados Unidos de América el día 25 de Marzo de 1.999, y No. 86/Del/99 presentada ante la Oficina de Patentes de la India el 15 de Enero de 1.999, debidamente certificadas, consularizadas y acompañadas de su traducción oficial al español fueron radicadas ante ese Despacho mediante memorial de fecha 12 de Abril de 2.000.

34306

Poder

A efectos de presentar nuevamente el poder a mí conferido por **Ranbaxy Laboratories Limited**, solicito al Despacho una prórroga del término concedido mediante el Auto No. 0066 notificado el 2 de Marzo de 2.000. Para tal efecto adjunto el recibo oficial de caja No. por valor de \$50.000.00 por concepto de los gastos administrativos correspondientes.

Documentación / Anexos

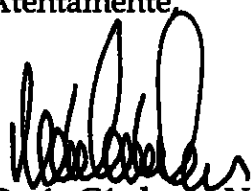
Adjunto a este escrito los siguientes documentos:

1. Nuevo capítulo reivindicatorio.
2. Nuevo capítulo descriptivo.
3. Nueva tarjeta de archivo temático.
4. Nueva tarjeta de archivo de propietarios.
5. Nuevo extracto para la publicación.
6. Arte final del dibujo característico según las exigencias legales.
7. Nuevos dibujos correctos, según las exigencias legales.
8. Recibo oficial de caja No. 19,579 por valor de \$68.000.00 por concepto de modificación de la solicitud.
9. Recibo oficial de caja No. 7,759 por valor de \$50.000.00 por concepto de los gastos administrativos correspondientes a la prórroga del término para la nueva presentación del poder a mí conferido por **Ranbaxy Laboratories Limited**.

305 307

Solicito al Despacho continuar con el presente trámite.

Atentamente,



Darío Cárdenas Navas
C.C. 17.066.629 de Bogotá
T. P. 1.250 de Minjusticia

AMR/d:/modelos/memorial/respauto.doc/

VENIR 31-05-02



306 306

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 7,759
FECHA : FEBRERO 2 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CARDENAS & CARDENAS ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	516812	2,632,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-08	PRORROGA DE TERMINOS	50,000.00
31		PRORROGA DE TERMINOS	5,000.00
TOTAL :			55,000.00

SON: CINCUENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

00001575

CARDENAS & CARDENAS

ABOGADOS

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

RC 357 384

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 19,579
FECHA : MARZO 23 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CARDENAS & CARDENAS ABOG	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	959747	3,997,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	8,000.00
		TOTAL :	8,000.00

SON: SESENTA Y OCHO MIL PESOS

[Handwritten signature]

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



00001575

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogot , D.C., Colombia



REPUBLICA DE COLOMBIA



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SOLICITUD DE
PATENTE DE
INVENCION

2

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

RANBAXY LABORATORIES LIMITED

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

INDIA

Departamento o Estado

Ciudad

NUEVA DELHI

Teléfono

Dirección

19 NEHRU PLACE, NUEVA DELHI, 110.019, INDIA

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

DARIO CARDENAS NAVAS

Dirección

CARRERA 7ª. No. 71-52 TORRE B PISO 9, SANTAFE DE BOGOTA D.C.

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

1. SUDERSHAN K. ARORA 2. NAWAL KISHORE

3. JANG B. GUPTA 4. VISHWAS D. JOSHI

Dirección y Domicilio

1. B-3/5 DLF PHASE-I, QUTAB ENCLAVE, GURGAON, HARYANA 122 001 INDIA.

2. C/O 1534, SECTOR 13, KURUKSHETRA, HARYANA 136 118 INDIA

3. 349, SECTOR-14, GURGAON, HARYANA 122 001 INDIA

4. RANBAXY RESEARCH LABS 220, A1, PHASE 1, OKHLA INDUSTRIAL AREA, NEW DELHI 110 020 INDIA

Identificación

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

DERIVADOS DE MONOSACARIDOS COMO INHIBIDORES DE ADHESION CELULAR

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI

X

NO

(33) País INDIA

(32) Fecha

ENERO 15, 1999

(31) No. Solicitud

86/Del/99

ESTADOS UNIDOS

MARZO 25, 1999

09/276,368

DE AMERICA

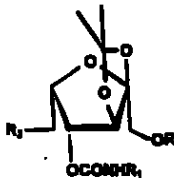
(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

309 24

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

2

Este invento se relaciona en general a compuestos por ejemplo el contenido en la estructura de la Fórmula I:



y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas, pro-medicamentos, metabólicos o poliformos que sean farmacológicamente aceptables, en los que R sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne (cadena recta o ramificada), aril, sustitución de aril o álcilariil y R₁ sea fenil *o*-, *m*- or *p*-clorofenil, toliil, metoxifenil o nitrofenil y R₂ sea H, pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexametilenoimino o una radical de la fórmula NHR₃, en la que R₃ sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada), y procesos para sintetizar derivados del ácido hexulofuranosónico 2-3-*O*-isopropilideno- α -L-xilo-2. Los compuestos de este invento son útiles, entre otras aplicaciones, para la inhibición y prevención de la adhesión celular y patologías en las que interviene la adhesión celular, que incluyen enfermedades inflamatorias y auto-inmunes, tales como asma bronquial, artritis reumática, diabetes tipo I, esclerosis múltiple, rechazo a injertos alopáticos y psoriasis. Este invento también se relaciona con los compuestos farmacológicos que contienen derivados de ácido hexulofuranosónico 2-3-*O*-isopropilideno- α -L-xilo-2 y los métodos para tratar las patologías que se han anotado anteriormente.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el Solicitante sea Persona Jurídica

☐

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la S.I.C.

☐

Recibo de la tasa respectiva

☒

Si se reivindica prioridad, el certificado respectivo (copia legalizada)

☒

Traducción oficial

☒

Capítulo descriptivo

☒

Dibujos, planos necesarios

☒

Capítulo reivindicatorio

☒

Tarjeta archivo propietarios según formato

☒

Tarjeta archivo temático según formato

☒

Extracto para resumen o para publicación según formato

☒

Arte final 12 x 12 cms.

☒

**SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES
NUEVA Y DE MI PROPIEDAD**

FIRMA DEL APODERADO

C.C.

TP No.

313
310

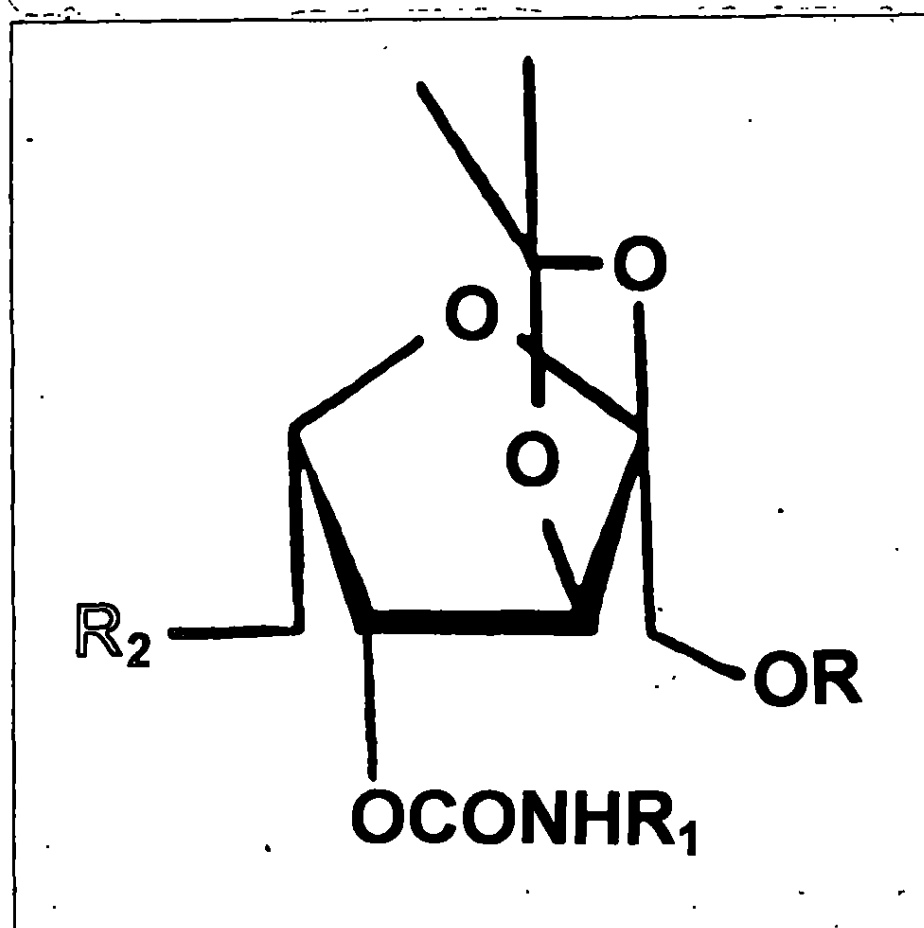
OBSERVACIONES:

Se retiró tarjeta para el archivo temático (folio 313).
tarjeta de propietarios : folio 314
Arte final tamaño 12 x 12 cm : folio 315
Extracto para publicación : folio 312

202039

7-marzo/02

316
311



317
312

1
2
3
4
5
6
7
8
9
10
11
12
13
14
15
16
17
18
19
20
21
22
23
24
25
26
27

**DERIVADOS DE MONOSACÁRIDOS COMO INHIBIDORES DE ADHESION
CELULAR**

CAMPO DEL INVENTO

Este invento se relaciona en general con compuestos y procesos para sintetizar derivados de del ácido hexulofuranosónico 2-3-Q-isopropilideno- α -L-xilo-2. Los compuestos de este invento son útiles, entre otros, debido a la inhibición y prevención de adhesión celular y patologías en las que media la adhesión celular, incluyendo enfermedades inflamatorias y auto-inmunes, tales como asma bronquial, artritis reumática, diabetes tipo I, esclerosis múltiple, rechazo al injerto alopático y psoriasis. Este invento también se relaciona con compuestos farmacológicos que contengan derivados del ácido hexulofuranosónico 2-3-Q-isopropilideno- α -L-xilo-2 y los métodos para tratar patologías tales como las anotadas anteriormente.

ANTECEDENTES DEL INVENTO

La adhesión celular constituye un proceso mediante el cual las células se asocian unas con otras y emigran hacia metas específicas ubicadas dentro de la matriz extracelular. Moléculas especializadas, denominadas moléculas de adhesión celular (CAMs), median en estas reacciones. Se ha demostrado que las CAMs participan en varias interacciones de célula a célula, de célula a matriz extracelular, y de plaqueta a plaqueta. Las CAMs influyen sobre la adhesión de leucocitos al endotelio vascular, su migración transendotelial, retención en sitios extravasculares, así como en la activación de células T y células eosinófilas. Estos procesos son de extrema importancia dentro de la

1 integrales desde el exterior de las células hacia el interior de las células, y vice-
2 versa. Las integrales pueden clasificarse sobre la base de las sub-unidades beta
3 que contengan. Por ejemplo, la subfamilia beta-1 contiene una subunidad beta-1
4 que está enlazada sin covalencia a una de las 10 diferentes subunidades alfa.

5
6 La integral alfa-4 beta-1, también conocida como VLA4 (antígeno 4 de
7 activación muy retardada), es un miembro de la familia integral beta-1 y
8 comprende subunidades alfa-4 y beta-1. La VLA4 interactúa con dos ligantes
9 específicos - la molécula vascular de adhesión celular (VCAM-1) y la región CS1
10 de la conexión fibrosa de proteína. La adhesión asistida por la VLA4 es de gran
11 importancia para el proceso de migración transendotelial de los leucocitos. La
12 ligación de VLA4 es seguida por una redistribución gruesa del citoesqueleto, lo
13 cual conduce a un aplanamiento de las células a lo largo de las paredes de la
14 vena, seguida por la expresión de moléculas específicas que digieren la pared
15 celular del endotelio y el diapédesis. Una vez ubicada en la región extraluminal,
16 las interacciones de VLA4 con la conexión fibrosa extracelular desempeñan una
17 función crucial para la migración de leucocitos hacia el sitio de la inflamación, con
18 la proliferación de células T, expresándose como citocinéticos y mediadores
19 inflamatorios. Además, el enlace de VLA4 proporciona señales co-estimulativas a
20 los leucocitos, lo cual trae como resultado una mejor immuno-reactividad. Por
21 ende, los antagonistas VLA4 —apropiados en teoría — mejorarían la respuesta
22 inmunológica a través de una doble acción—la inhibición del reclutamiento de
23 células T en el sitio de la inflamación y la inhibición de la activación co-estimulante
24 de las células inmunes.

25
26 A este respecto, se ha demostrado que los inhibidores de interacciones
27 VLA4 exhiben efectos terapéuticos benéficos en varios modelos animales de
28 enfermedades inflamatorias y alérgicas, incluyendo el asma alérgica en ovejas
29 (Abraham et al, Revista de investigación clínica *J. Clin. Invest.* 1994;93:776);
30 artritis (Wahl et al, *J. Clin. Invest.* 1994;94:655); encefalomiелitis alérgica
31 experimental (Yednock et al, *Nature (Londres)*, 1992;356:63 y Baron et al, *J. Exp.*
32 *Med.* 1993;177:57); hipersensibilidad al contacto (Chisolm et al, *Eur J. Immunol.*
33 1993;23:682); diabetes tipo I (Yang et al, (Academia Nacional de la ciencia) *Proc.*

1 *Natl. Acad. Sci.* (Estados Unidos) 1993;90:10494); y enfermedad inflamatoria de
2 los intestinos (Podolsky et al, *J. Clin. Invest.* 1993;92:372).

3
4 La región CS1 central de la conexión fibrosa involucrada en la interacción
5 con la VLA4 fue identificada como el tripéptido Leu-Asp-Val (LDV) (Komoriya et al,
6 *Revista de Biología Química (J. Biol. Chem.)* 1991;266:15075). Varios péptidos
7 que contienen la secuencia LDV fueron sintetizados y se demostró que inhibían
8 *in vivo* la interacción de VLA4 a sus ligantes (Ferguson et al, *Proc. Natl. Acad. Sci.*
9 (USA) 1991;88:8072; Wahl et al, *J. Clin. Invest.* 1994;94:655; Nowlin et al, *J. Biol.*
10 *Chem.* 1993;268(27):20352; y publicación WO91/4862 de PCT).

11
12 Pese a estos avances, persiste la necesidad de contar con inhibidores
13 pequeños y específicos para las moléculas de adhesión celular que dependen de
14 la VLA4 . Idóneamente, tales inhibidores serían solubles en agua, contando con
15 eficacia oral. Tales compuestos proporcionarán agentes útiles para el tratamiento,
16 prevención o supresión de varias patologías inflamatorias que cuentan con el
17 enlace de medicación de la VLA4 .

18
19 Por lo general, se conoce que los grupos de isopropilideno y benzilideno
20 son los grupos protectores que más comúnmente se utilizan dentro de la química
21 de carbohidratos. Aunque ambos grupos se introducen en una molécula bajo
22 condiciones similares, la ubicación de la protección puede diferir mucho, y esta
23 diferencia está directamente relacionada con la estabilidad de cada molécula que
24 se protege. Como la protección se produce normalmente bajo condiciones que
25 permiten una reversibilidad, la reacción prosigue hasta que se alcanza un
26 equilibrio. La distribución de productos al punto de equilibrio queda determinada
27 por sus estabilidades termo-dinámicas relativas. En otras palabras, estas
28 reacciones están termodinámicamente controladas. Los grupos de benzilideno
29 prefieren ser parte de anillos acetales de 6 miembros, mientras que los quetales
30 que resultan de la acetona son por lo general anillos de 5 miembros. La
31 diferencia se atribuye al efecto que tienen los sustitutos del metil y fenil sobre la
32 estabilidad de los sistemas particulares de anillos. Estos métodos de bloqueo
33 quedan descritos en las Patentes de los Estados Unidos Nos. 2,715,121,
34 4,056,322, 4,735,934, 4,996,195 y 5,010,058, cuya divulgación forma parte de

este documento por referencia. Otros métodos de bloque también quedan descritos en la revista Química de Carbohidratos (*J. Carbohydr. Chem.* 1985;4:227 y 1984;3:331; Métodos en Química de Carbohidratos. 1962;1:107 y 1962;1:191; Can J. Chem. 1984;62:2728, 1969;47:1195, 1455, y 1970;48:1754, todas las cuales quedan incorporadas a este documento por referencia. Las técnicas anteriores en esta materia revelan que la D-glucosa se bloquea en las posiciones 1,2; 5,6, ya sea con el grupo de bloqueo de isopropilideno o ciclohexilideno, dejando abierta la posición de tres puntos para que se produzca una derivación. La actividad terapéutica de hexosas y sus derivados también quedan divulgadas en las mencionadas técnicas anteriores.

Los compuestos del presente invento fueron revisados con respecto a su actividad inhibitoria dentro del ensayo de adhesión celular con la mediación de la VLA4 y el clásico ensayo de hipersensibilidad al murino en los ratones. Varios compuestos exhibieron una importante actividad inhibitoria en ambas pruebas. Las sales de estos compuestos podrían ser fácilmente disueltas en agua y utilizadas en el tratamiento de desórdenes crónicos, alérgicos, auto-inmunes e inflamatorios en los que media la adhesión celular, tales como asma bronquial y artritis reumática. Parte de la técnica anterior describe el desarrollo de derivados péptidos a manera de antagonistas de la adhesión celular para el tratamiento de estas enfermedades. Sin embargo, debido a que el tratamiento de enfermedades crónicas precisa de la prolongada administración (plazo medio a largo plazo) de medicinas, el desarrollo de inhibidores de adhesión celular que sean específicos e ingeridos oralmente, conllevarían mucho beneficio.

No existe un ejemplo disponible en las técnicas anteriores, en el que los compuestos que contienen un núcleo azucarado combinado con partes de carbamato según el presente invento, se utilicen como terapia para la inhibición, prevención y supresión de la adhesión celular en la que medie la VLA4 y patologías asociadas con tal adhesión.

316324

RESUMEN DEL INVENTO

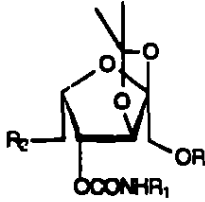
1 Uno de los objetivos del presente invento es el de proporcionar un proceso
2 para sintetizar una nueva clase de compuestos que exhiban importante actividad
3 como antagonistas VLA₄ .
4

5 La mayoría de los compuestos descritos en la Patente de los Estados
6 Unidos No. 5,637,570 han demostrado importantes actividades anti-cancerígenas
7 que estaban desprovistas de cualquier tipo de actividad anti adhesión celular. Por
8 lo tanto, los compuestos del presente invento fueron diseñados y sintetizados de
9 tal manera que afiancen las propiedades celulares anti-adhesivas. Se descubrió
10 que, para que un compuesto sea activo como inhibidor de adhesión celular, es
11 mejor que el azúcar tenga una parte de carbamato, junto con otras funciones.
12

13 Otro de los objetivos de este invento es el de proporcionar un proceso para
14 la preparación de innovadores compuestos basados en carbohidratos que sean
15 solubles en agua y que tengan una importante actividad que pueda utilizarse
16 como antagonista de la adhesión celular.
17

18 Otros objetivos y ventajas del presente invento serán vertidos en la
19 descripción que sigue, los mismos que serán evidentes al momento de
20 describirlos, y también podrán ser aprendidos a través de la aplicación del
21 invento. Los objetivos y ventajas de este invento pueden plasmarse en realidad
22 y obtenerse a través de los mecanismos y combinaciones que se señalan en las
23 reivindicaciones que se anexan.
24

25 A fin de alcanzar los antes mencionados objetivos, y de conformidad con
26 uno de los aspectos del presente invento, se proporciona un proceso para lograr la
27 síntesis de derivados monosacáridos y sus derivados en sí, que tienen la
28 estructura contenida en la Fórmula I:

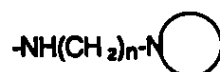


FORMULA I

33 en la que R es C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne (cadena recta o
34 ramificada), aril, aril o alquilaril substituido, R₁ es fenil , o,- m- or p-clorofenil, tolil,

322
317

1 metoxifenil o nitrofenil y R₂ es H, pirrolidinil, piperidinil, morfinil o
2 hexametilenoimina o una radical de la fórmula - NHR₃ en la que R₃ es C₁ con
3 respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada) o una radical de
4 la Fórmula III:



8 **FORMULA III**

9 en la que n constituye un número entero hasta 5 y



13 es un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, que contiene uno o más
14 heteroátomos, y donde preferentemente



18

19 es en parte pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexametilenoimino.

20

21 Los compuestos preferidos son aquellos en los que R₁ y R₂ no son a la vez H. La
22 adición de sales ácidas a los anteriores compuestos también forma parte del
23 invento.

24

25 De acuerdo con otro aspecto del presente invento, se proporciona una lista
26 de compuestos según consta a continuación en la descripción de la sección del
27 invento.

28

29 De acuerdo con otro aspecto del presente invento se han previsto métodos
30 para prevenir, inhibir o suprimir la adhesión celular en un animal (el término animal
31 según se utiliza aquí incluye a humanos o mamíferos), y comprende la
32 administración de los compuestos anteriormente descritos a dicho animal.

33

1 De acuerdo con otro aspecto del presente invento, se ha previsto un
2 método para el tratamiento de un animal que padece de asma bronquial, artritis
3 reumático, esclerosis múltiple, diabetes tipo I, psoriasis, rechazo a injerto
4 alopático, y otros desórdenes inflamatorios y/o de auto inmunidad, y que
5 comprende la administración de los anteriormente compuestos a dicho animal.

6

7 De acuerdo con otro aspecto del presente invento, se ha previsto un
8 método para prevenir, inhibir o suprimir inflamación asociada con la adhesión
9 celular, mediante los compuestos antes descritos en este documento.

10

11 De acuerdo con aún otro aspecto del presente invento, se proporciona un
12 método para prevenir, inhibir o suprimir la adhesión celular asociada con
13 respuestas inmunes o auto inmunes, a través de los compuestos anteriormente
14 descritos.

15

16 De acuerdo con otro aspecto del presente invento, se prevé un método para
17 el tratamiento o prevención de una enfermedad seleccionada de entre el grupo
18 consistente de asma, artritis, psoriasis, rechazo a injerto alopático,
19 arterioesclerosis múltiple, diabetes y enfermedad inflamatoria del intestino,
20 utilizando para ello los compuestos que se han descrito con anterioridad en este
21 documento.

22

23 Los compuestos del presente invento son nuevos y exhiben importante
24 potencia en términos de su actividad, lo que ha sido determinado a través de un
25 ensayo de adhesión celular *in vitro* con mediación de la VLA4 y la prueba *in vivo*
26 de hinchazón de oreja en un ratón. Estos compuestos, que se encontró que eran
27 activos dentro del ensayo *in vitro*, fueron luego comprobados *in vivo*. Se encontró
28 que algunos de los compuestos del presente invento constitulan potentes
29 antagonistas VLA4. Por lo tanto, el presente invento proporciona composiciones
30 farmacéuticas para el posible tratamiento de asma bronquial y otros desórdenes
31 inflamatorios y auto inmunes. Además, los compuestos del anterior invento
32 pueden ser administrados oralmente o intravenosamente.

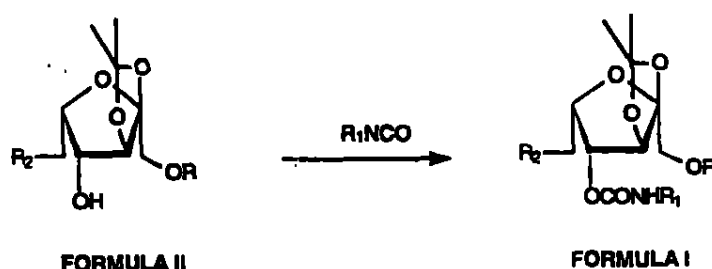
33

34

DESCRIPCION DETALLADA DEL INVENTO

Los compuestos del presente invento pueden ser preparados a través de técnicas bien conocidas en el campo y que les son familiares al químico sintético u orgánico común. Además, los compuestos del presente invento pueden ser preparados a través de la siguiente secuencia de reacción que resulta nueva e inventiva, que también ha demostrado ser preferida por los grupos R, R₁ y R₂.

ESQUEMA I



Los compuestos 2,3-O-Isopropil-1-O-alkil o arilalkil-6-deoxi-6-aminosustituido-L-xilo-2-hexulofuranosa de la Fórmula II, según consta en el Esquema I, se preparan de conformidad con el método que consta descrito en la Patente de los Estados Unidos No. 5,637,570 y son los intermediarios para la síntesis de los compuestos de la Fórmula I del presente invento. Por ende, los siguientes intermediarios fueron preparados siguiendo el proceso descrito en la Patente de los Estados Unidos No. 5,637,570:

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-hexametilenoimino-1-O-dodecil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-hexametilenoimino-1-O-decil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-hexametilenoimino-1-O-heptil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-pirrolidinil-1-O-dodecil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-pirrolidinil-1-O-decil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-pirrolidinil-1-O-heptil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-morfilinil-1-O-dodecil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-morfilinil-1-O-decil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

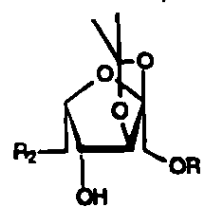
2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-morfilinil-1-O-heptil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-piperidinil-1-O-dodecil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

- 1 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-piperidinil-1-O-decil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 2 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-piperidinil-1-O-heptil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-etilpirrolidinil-1-O-dodecil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 4 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-etilpirrolidinil-1-O-decil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-etilpirrolidinil-1-O-heptil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 6 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-etilmorfolinil-1-O-dodecil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-etilmorfolinil-1-O-decil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 8 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-6-etilmorfolinil-1-O-heptil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

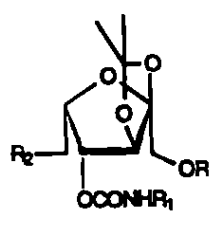
9
10
11
12
13
14
15
16
17
18
19
20
21
22
23
24
25
26
27
28
29
30
31
32
33

Por ende, el compuesto de la Fórmula II, es decir,



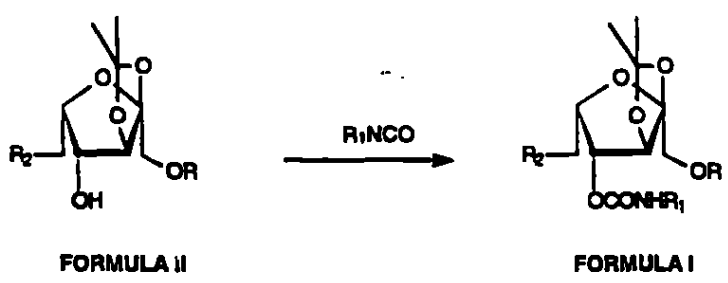
FORMULA II

se trata con un isocianato apropiado, en un disolvente idóneo a baja temperatura, preferentemente a 0-10° C para lograr los compuestos de la Fórmula I, es decir,



FORMULA I

del presente invento. Una lista ilustrativa de compuestos específicos de acuerdo con el invento y capaces de ser producidos según el Esquema I, es decir,



incluye:

326
321

Compuesto No.		Nombre Químico
1	01.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
2		xilo-2-hexulofuranosa
3	02.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -
4		L-xilo-2-hexulofuranosa
5	03.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -
6		L-xilo-2-hexulofuranosa
7	04.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
8		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
9	05.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil-
10		α -L-xilo-2-hexulofuranosa
11	06.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
12		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
13	07.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
14		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
15	08.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
16		xilo-2-hexulofuranosa
17	09.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
18		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
19	10.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
20		xilo-2-hexulofuranosa
21	11.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
22		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
23	12.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
24		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
25	13.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
26		xilo-2-hexulofuranosa
27	14.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
28		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
29	15.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -
30		L-xilo-2-hexulofuranosa
31	16.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
32		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
33	17.	2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
34		pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

322
322

- 1 18. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -
2 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 19. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
4 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 20. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -
6 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 21. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
8 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 22. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
10 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 23. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
12 xilo-2-hexulofuranosa
- 13 24. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
14 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 25. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
16 xilo-2-hexulofuranosa
- 17 26. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
18 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 27. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
20 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 28. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
22 xilo-2-hexulofuranosa
- 23 29. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
24 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 30. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
26 xilo-2-hexulofuranosa
- 27 31. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
28 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 32. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
30 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 33. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -
32 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 34. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
34 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

- 1 35. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil-
2 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 36. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
4 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 37. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
6 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 38. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
8 xilo-2-hexulofuranosa
- 9 39. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
10 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 40. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -
12 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 41. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
14 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 42. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
16 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 43. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
18 xilo-2-hexulofuranosa
- 19 44. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
20 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 45. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -
22 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 46. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
24 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 47. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
26 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 48. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-
28 hexametilenoinmino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 49. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
30 hexametilenoinmino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 50. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-
32 hexametilenoinmino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 51. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
34 hexametilenoinmino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

324
324

- 1 52. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 2 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 53. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 4 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 54. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 6 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 55. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 8 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 56. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 10 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 57. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 12 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 58. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 14 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 59. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 16 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 60. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 18 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 61. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 20 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 62. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 22 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 63. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 24 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 64. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 26 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 65. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 28 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 66. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 30 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 67. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 32 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 68. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 34 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

328
325

- 1 69. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
2 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 70. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
4 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 71. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
6 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 72. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
8 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 73. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
10 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 74. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
12 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 75. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
14 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 76. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
16 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 77. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
18 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 78. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
20 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 79. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
22 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 80. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
24 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 81. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
26 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 82. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
28 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 83. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
30 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 84. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
32 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 85. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
34 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

331
326

- 1 86. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
2 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 87. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
4 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 88. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
6 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 89. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
8 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 90. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
10 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 91. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
12 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 92. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
14 etilpiperidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 93. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
16 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 94. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
18 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 95. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
20 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 96. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
22 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 97. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
24 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 98. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-etilmorfilinil)-
26 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 99. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
28 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 100. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
30 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 101. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
32 etilmorgilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 102. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
34 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

- 1 103. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
2 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 104. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
4 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 105. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
6 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 106. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
8 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 107. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
10 etilmorfilinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 108. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-
12 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 109. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -
14 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 110. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -
16 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 111. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
18 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 112. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
20 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 113. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
22 xilo-2-hexulofuranosa
- 23 114. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-
24 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 115. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
26 xilo-2-hexulofuranosa
- 27 116. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
28 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 117. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
30 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 118. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-pirrolidinil- α -L-
32 xilo-2-hexulofuranosa
- 33 119. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
34 xilo-2-hexulofuranosa

338
328

- 1 120. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 2 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 121. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-
- 4 xilo-2-hexulofuranosa
- 5 122. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 6 etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 123. 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
- 8 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

9

10 Los derivados del azúcar dentro del presente invento exhiben varias

11 propiedades farmacéuticas que resultan útiles para el tratamiento de animales,

12 siendo el término animal tal y como aquí se lo incluye, aplicado a humanos o

13 mamíferos que padecen de varios desórdenes inflamatorios y auto inmunes tales

14 como asma bronquial, artritis reumática, diabetes tipo I, esclerosis múltiple,

15 rechazo a injertos alopáticos y psoriasis.

16

17 Los compuestos de aminos liberados dentro del presente invento son

18 básicos y forman sales ácidas orgánicas e inorgánicas. Las sales resultantes son

19 útiles para sí mismas y dentro de la composición terapéutica y método de

20 utilización. Tales sales pueden prepararse siguiendo las mismas técnicas

21 conocidas en el campo, tales como la suspensión del compuesto en agua y luego

22 la adición de un equivalente del ácido orgánico o mineral que se desee. Ejemplos

23 de los ácidos preferidos incluyen al ácido hidrocórico, sulfúrico, nítrico, maléico,

24 benzóico, tartárico, acético, p-aminobenzóico, oxálico, succínico y glucorónico.

25

26 La solución neutral de las sales resultantes se sujeta a evaporación rotativa

27 bajo presión reducida al volumen necesario a fin de asegurar la precipitación de

28 las sales luego de su enfriamiento, las mismas que entonces son filtradas y

29 secadas. Las sales del presente invento podrían también prepararse bajo

30 condiciones estrictamente no-acuosas. Por ejemplo, disolviendo los aminos

31 liberados en un disolvente orgánico idóneo, añadiendo exactamente un

32 equivalente del ácido deseado al mismo disolvente y agitando la solución a 0-5° C

33 lo que ocasiona la precipitación de las sales de amino, que son luego filtradas,

34 lavadas con disolvente y secadas. A menudo se prefieren las sales amino dentro

1 de la formulación de los compuestos terapéuticos ya que son cristalinas y
2 relativamente más estables y no-hidroscópicas. Las sales de amino también se
3 adaptan mejor para inyección intramuscular que los amino libres.

4

5 Debido a sus valiosas propiedades farmacéuticas, los compuestos del
6 presente invento podrían ser administrados a un animal mediante tratamiento oral,
7 tópico, rectal, intranasal o por la ruta parenteral. Cuando la composición
8 terapéutica deba administrarse oralmente, es preferible que los compuestos del
9 presente invento se añadan y mezclen con un agente de complemento y/o ligante,
10 como podría ser un almidón y un desintegrador. La mezcla añadida podría
11 convertirse en una tableta de tamaño conveniente para ser ingerida oralmente.
12 También podrían llenarse cápsulas con el compuesto terapéutico en polvo para
13 administración oral. Como alternativa podría mezclarse por adición una solución
14 en agua de las sales de amino o suspensión del compuesto terapéutico con un
15 jarabe saborizado que se pueda ser administrado oralmente. Usualmente es
16 preferible utilizar una sal del ácido liberado cuando el compuesto se administra por
17 ruta parenteral.

18

19 Los compuestos farmacéuticos del presente invento se producen y
20 administran, preferentemente, en unidades dosificadas, siendo que cada unidad
21 contiene una cierta cantidad de por lo menos un compuesto del invento y/o la
22 adición de por lo menos una base de sal que sea fisiológicamente aceptable. La
23 dosificación puede variar, con límites extremadamente amplios, ya que los
24 compuestos son eficaces a bajos niveles de dosificación y relativamente libres de
25 efectos tóxicos. Los compuestos pueden administrarse en bajas concentraciones
26 micro-molares, siendo terapéuticamente eficaces, y la dosificación puede
27 incrementar según se desee hasta alcanzar la máxima dosis tolerada por el
28 paciente.

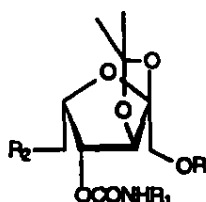
29

30 El presente invento también incluye dentro de su alcance pro-
31 medicamentos de los compuestos de la Fórmula I, es decir,

32

33

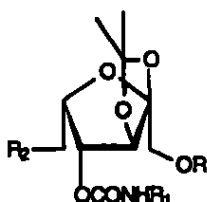
34



935
330

En general, tales pro-medicamentos constituirán derivados funcionales de estos compuestos, que en condiciones *in vivo* se convierten fácilmente en los compuestos definidos. Los procedimientos convencionales para la selección y preparación de pro-medicamentos idóneos son bien conocidos.

El presente invento también incluye enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, polimorfos y sales farmacéuticamente aceptables de tales compuestos, así como metabólicos que tienen el mismo tipo de actividad. Este invento incluye además compuestos farmacéuticos que comprenden las moléculas de la Fórmula I, es decir,



FORMULA I

o pro-medicamentos, enantiómeros metabólicos, diastereómeros, N-óxidos, polimorfos o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, en combinación con vehículos que sean farmacológicamente aceptables y excipientes que pueden incluirse opcionalmente.

Los ejemplos que se mencionan a continuación demuestran el procedimiento sintético general así como la preparación específica de los compuestos preferidos. Los ejemplos que se dan tienen el propósito de ilustrar los detalles del invento y no deberán considerarse como una limitación del alcance del presente invento.

DETALLES EXPERIMENTALES

Varios disolventes, tales como acetona, metanol, piridina, éter, tetrahydrofurán, hexano y diclorometano, fueron secados utilizando varios agentes secadores según el procedimiento descrito en la literatura de ese campo. Los disolventes húmedos rindieron bajos rendimientos de los productos y sus intermediarios. Se registraron espectros IR tales como muselina suave 'nujol' o una delgada película sobre un instrumento Perkin Elmer paragon. Se registraron datos de Resonancia Nuclear Magnética(NMR), (H, C) utilizando un instrumento

331
336

1 Varian XL-300, utilizando para ello tetrametilsilano a manera de norma interna. El
2 Espectro Masivo de Ionización Química (CIMS) fue obtenido utilizando un
3 espectrómetro Finnigan MAT-4510 con un sistema de datos INCOS. En general,
4 se emplearon: una sonda de exposición directa y metano como gas de reacción
5 (0.33 mmHg, fuente de temperatura de 120° C).

6

7

EJEMPLO 1

8 **Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-**
9 **6-hexa-metilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.**

10 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-hexametilenoimino- α -L-xilo-2-
11 hexulofuranosa (preparado de acuerdo al método descrito en la Patente de los
12 Estados Unidos No. 5,637,570) (2.0 gm) fue disuelto en cloruro de metileno seco
13 (20 ml). A esta solución se añadió isocianato de fenil (0.64 gm), gota a gota, a una
14 temperatura de 0-10°C, y la mezcla de reacción fue agitada a la misma
15 temperatura durante 2 horas. Luego fue lavada con agua (2 veces con 5 ml) y
16 salmuera (2 veces en 5 ml). La capa orgánica fue secada y el disolvente retirado.
17 El producto crudo así obtenido fue purificado mediante columna de cromatografía
18 y levigado con 50% de etilacetato en hexano. El rendimiento del producto puro
19 corresponde al 61%.

20

21 Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al generar
22 una reacción con 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-hexametilenoimino-
23 α -L-xilo-2-hexulofuranosa con un isocianato idóneo:

24 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-

25 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

26 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-

27 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

28 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-

29 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

30 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-

31 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

32 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino-

33 α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

34

EJEMPLO 2

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa (preparado según se describe en el Ejemplo 1, al reemplazar el grupo de hexametilenoimino con pirrolidina en la posición 6) (1.9 gm) habiéndosela disuelto en cloruro de metileno (20 ml). A esta solución se añadió, gota a gota, y a una temperatura de 0-10° C isocianato de fenil (0.56 gm), habiendo sido la mezcla de reacción agitada a la misma temperatura durante 2 horas. La capa orgánica fue lavada con agua (2 veces en 10 ml), seguida por una solución saturada de cloruro de sodio (2 veces en 10 ml), secada sobre sulfato anhidroso de sodio y filtrada. El disolvente fue retirado mediante evaporación rotativa. El producto crudo así obtenido fue purificado por cromatógrafo utilizando gel de sílice, para ser luego levigado con 30% de etilacetato en hexano. El rendimiento del producto puro es del 53.80% (1.0 gm).

Los siguientes compuestos fueron igualmente sintetizados al generar una reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con un isocianato idóneo:

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 3

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa (preparado según se describe en el Ejemplo 1; al reemplazar el grupo de hexametilenoimino con el grupo de morfolina en la posición 6) (2.0 gm) se lo disolvió en cloruro de metileno (20 ml). A esta solución se añadió isocianato de fenil, (1.0 ml), gota a gota, a razón de 0–10° C y luego la mezcla de reacción fue agitada a la misma temperatura durante 2 horas. Luego la capa orgánica fue lavada con agua (2 veces en 10 ml), seguida por una solución saturada de cloruro de sodio (2 veces en 10 ml), secada sobre sulfato anhidroso de sodio y filtrado. El disolvente fue retirado mediante evaporación rotativa. El producto crudo así obtenido fue purificado mediante cromatógrafo utilizando gel de sílice y levigado con 30% de etilacetato en hexano. El rendimiento del producto puro corresponde al 54.6% (1.20 gm).

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al desencadenar una reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con un isocianato idóneo:

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolylcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 4

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa (preparado según se describe en el Ejemplo 1 al reemplazar el grupo de hexametilenoimino con el grupo de piperidina en la posición 6) (2.0 gm) habiéndosela disuelto en cloruro de metileno (20 ml). A esta solución se añadió

isocianato de fenil (0.58 gm), gota a gota, a una temperatura de 0–10° C y la mezcla de reacción fue agitada a la misma temperatura durante 2 horas. La reacción fue controlada mediante cromatografía de fina capa (TLC). La capa orgánica fue lavada con agua (2 veces en 10 ml), seguida por una solución saturada de cloruro de sodio (2 veces en 10 ml), secada sobre sulfato anhidroso de sodio, y filtrada. El disolvente fue retirado mediante evaporación rotativa. El producto crudo así obtenido fue purificado mediante cromatografía utilizando gel de sílice y levigado en 30% de etilacetato en hexano. El rendimiento del producto puro corresponde al 35.1% (0.90 gm).

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al generar una reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con un isocianato idóneo:

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinol- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 5

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa (preparado según se describe en el Ejemplo 1 al reemplazar el grupo de hexametilenoimino por el grupo de 2-etilpirrolidinil en la posición 6) (1.5 gm) siendo disuelta en cloruro de metileno (20 ml). A esta solución se añadió isocianato de fenil (1.0 ml), gota a gota, a razón de 0–10° C y la mezcla de reacción fue agitada a la misma temperatura durante 2 horas. La reacción fue controlada con TLC. La capa orgánica fue lavada con agua (2 veces 10 ml),

340
335

seguida por una solución saturada de cloruro de sodio (2 veces en 10 ml), secada sobre sulfato anhidroso de sodio y filtrada. El disolvente fue retirado mediante evaporación rotativa. El producto crudo así obtenido fue purificado mediante cromatógrafo con gel de sílice y levigado con 30% de etilacetato en hexano. El rendimiento del producto puro corresponde a 60.2% (1.1 gm).

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al generar una reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con un isocianato idóneo:

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpyrroldinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 6

Preparación de 2,3,O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa (preparado según se describe en el Ejemplo 1 al reemplazar el grupo de hexametilenoimino con el grupo de 2-etilmorpholino en la posición 6) (2.0 gm) habiéndosela disuelto en cloruro de metileno (20 ml). A esta solución se le añadió isocianato de fenil (0.56 gm), gota a gota, a una temperatura de 0–10° C y la mezcla de reacción fue agitada a la misma temperatura durante 2 horas. La reacción fue controlada con TLC. La capa orgánica fue lavada con agua (2 veces en 10 ml), seguida por una solución saturada de cloruro de sodio (2 veces en 10 ml), secada sobre sulfato anhidroso de sodio, y filtrada. El disolvente fue retirado mediante evaporación rotativa. El producto crudo así obtenido fue purificado mediante cromatografía, utilizando para ello gel de sílice y levigado con 30% de

241
336

etilacetato en hexano. El rendimiento del producto puro corresponde al 30.4% (0.75 gm).

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar, al generar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con un isocianato idóneo:

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 7

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 2 al generar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a una temperatura de 0–10° C. El rendimiento del producto puro corresponde al 58%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al generar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

342
337

2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -
L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-
2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 8

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 3, al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a una temperatura de 0–10° C. El rendimiento del producto puro corresponde al 61%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al generar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbámato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 9

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 1 al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-6-deoxi-6 exametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil

a temperatura de 0–10° C. El rendimiento del producto puro corresponde al 69%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-

hexametilenioimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino-

α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-

hexametilenioimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-

hexametilenioimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino-

α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 10

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 3, al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a una temperatura de 0–10° C. Rendimiento del producto puro: 74%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-

xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-

hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -

L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 11

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 3, al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil, a 0–10° C. Rendimiento del producto puro: 74%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 12

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

1 Este compuesto se preparó de conformidad con el método descrito en el
2 Ejemplo 3 propiciando la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-(2-
3 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a una temperatura
4 de 0–10° C. Rendimiento del producto puro: 72%.

5
6 Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al
7 propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)-
8 α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

9 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
10 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

11 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-
12 xilo-2-hexulofuranosa

13 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
14 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

15 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-
16 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

17 2,3-O-isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-
18 xilo-2-hexulofuranosa.

20 EJEMPLO 13

21 **Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-**
22 **pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.**

23 Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el
24 Ejemplo 2 al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-
25 pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil, a una temperatura de
26 0–10° C. Rendimiento del producto puro: 85.4%

27
28 Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al
29 propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
30 xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

31 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
32 xilo-2-hexulofuranosa

33 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-
34 hexulofuranosa

1 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -
2 L-xilo-2-hexulofuranosa

3 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-
4 xilo-2-hexulofuranosa

5 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-
6 hexulofuranosa.

8 EJEMPLO 14

9 **Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-**
10 **morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.**

11 Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el
12 Ejemplo 3, al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-
13 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a 0-10° C.
14 Rendimiento del producto puro: 79%.

15
16 Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar
17 propiciando la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-decil-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-
18 xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

19 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-
20 xilo-2-hexulofuranosa

21 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-
22 hexulofuranosa

23 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -
24 L-xilo-2-hexulofuranosa

25 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-
26 xilo-2-hexulofuranosa

27 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-
28 hexulofuranosa.

30 EJEMPLO 15

31 **Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-**
32 **hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.**

33 Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el
34 Ejemplo 3 al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-

1 hexametileno-imino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a 0–10° C.
 2 Rendimiento de producto puro: 91%.

3
 4 Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al
 5 propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-
 6 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:
 7 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
 8 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
 9 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino-
 10 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
 11 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
 12 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
 13 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
 14 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
 15 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino-
 16 α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

17
 18 **EJEMPLO 16**
 19 **Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-**
 20 **piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.**

21 Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el
 22 Ejemplo 3 al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-
 23 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil a temperaturas de 0–
 24 10° C. Rendimiento del producto puro: 47.6%.

25
 26 Los siguientes compuestos fueron sintetizadosd e manera similar al
 27 propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-
 28 xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:
 29 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-
 30 xilo-2-hexulofuranosa
 31 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-
 32 hexulofuranosa
 33 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -
 34 L-xilo-2-hexulofuranosa

345
343

2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 17

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 3, al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil, a temperatura de 0–10° C. Rendimiento del producto puro 68%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

EJEMPLO 18

Preparación de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Este compuesto fue preparado de manera similar de conformidad con el método descrito en el Ejemplo 3, al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-

O-heptil-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con isocianato de fenil, a temperaturas de 0–10° C. Rendimiento del producto puro: 75.8%.

Los siguientes compuestos fueron sintetizados de manera similar al propiciar la reacción de 2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa con el isocianato deseado:

2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolylcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

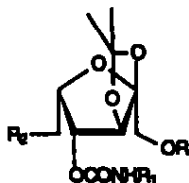
2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

Si bien el presente invento ha sido descrito en términos de sus distintas y específicas presentaciones, ciertas modificaciones y equivalencias serán evidentes para quienes son expertos en este campo, por ende tiene intención de dejar a tales modificaciones y equivalencias incluidas dentro del alcance de este invento, y que se limitarán únicamente por el alcance de las reivindicaciones que se anexan.

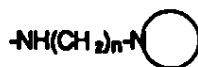
REIVINDICACIONES

1. Compuestos que tengan la estructura de la Fórmula I:



FORMULA I

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas, pro-medicamentos, metabólicos o poliformos que sean farmacológicamente aceptables, en los que R sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne (cadena recta o ramificada), aril, substitución de aril o álciliaril y R₁ sea fenil *o*-, *m*- or *p*-clorofenil, tolil, metoxifenil o nitrofenil y R₂ sea H, pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexametilenoimino o una radical de la fórmula NHR₃, en la que R₃ sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada) o una radical de la Fórmula III:



FORMULA III

en la que n es un número entero hasta 5 y



es un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que contengan uno o más heteroátomos.

2. Los compuestos de la reivindicación 1, en la que N sea pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexa-metilenoimino.

35+
346

3. Compuestos de conformidad con la reivindicación 1, seleccionados del grupo consistente de:

2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

252
347

- 1 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 2 pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil-
- 4 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil- α -L-
- 6 xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 8 morfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil- α -L-
- 10 xilo-2-hexulofuranosa
- 11 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 12 morfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 14 morfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil- α -L-xilo-
- 16 2-hexulofuranosa
- 17 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil-
- 18 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-
- 20 xilo-2-hexulofuranosa
- 21 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 22 morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil-
- 24 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil- α -L-
- 26 xilo-2-hexulofuranosa
- 27 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil-
- 28 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil- α -L-
- 30 xilo-2-hexulofuranosa
- 31 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 32 morfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-morfilinil-
- 34 α -L-xilo-2-hexulofuranosa

353
348

- 1 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 2 xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 4 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -
- 6 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 8 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 10 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 12 xilo-2-hexulofuranosa
- 13 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 14 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 16 xilo-2-hexulofuranosa
- 17 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 18 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decyl-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil-
- 20 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 22 xilo-2-hexulofuranosa
- 23 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 24 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa)
- 25 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 26 xilo-2-hexulofuranosa
- 27 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 28 piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil-
- 30 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 32 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 34 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

50
354
349

- 1 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 2 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 4 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 6 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 8 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 10 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 12 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 14 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 16 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 18 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 20 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 22 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 24 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 26 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpirrolidinil-
- 28 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 30 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpirrolidinil-
- 32 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 34 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

- 1 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 2 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpirrolidinil- α -L-
- 4 xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 6 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpirrolidinil- α -
- 8 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 10 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 12 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpirrolidinil- α -
- 14 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 16 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolylcarbamato)-6-deoxi-6-etilpirrolidinil-
- 18 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 20 etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi
- 22 -6-etilpirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpiperidinil-
- 24 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 26 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolylcarbamato)-6-deoxi-6-etilpiperidinil-
- 28 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 30 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 31 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 32 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpiperidinil- α -L-
- 34 xilo-2-hexulofuranosa

- 1 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 2 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpiperidinil- α -
- 4 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 6 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 8 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpiperidinil- α -
- 10 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 12 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-etilpiperidinil-
- 14 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 16 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 18 etilpiperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 19 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilmorfilinil- α -
- 20 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 21 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 22 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-etilmorfilinil-
- 24 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 26 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 27 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 28 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(fenilcarbamato)-6-deoxi-6-etilmorfilinil- α -L-
- 30 xilo-2-hexulofuranosa
- 31 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoxi-6-
- 32 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoxi-6-etilmorfilinil- α -L-
- 34 xilo-2-hexulofuranosa

357
352

- 1 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 2 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 3 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 4 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 5 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(fenilcarbamato)-6-deoksi-6-etilmorfilinil- α -L-
- 6 xilo-2-hexulofuranosa
- 7 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-clorofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 8 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 9 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-tolilcarbamato)-6-deoksi-6-etilmorfilinil- α -
- 10 L-xilo-2-hexulofuranosa
- 11 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-metoxifenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 12 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 13 2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(p-nitrofenilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 14 etilmorfilinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 15 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 16 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 17 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
- 18 xilo-2-hexulofuranosa
- 19 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 20 xilo-2-hexulofuranosa
- 21 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
- 22 etilpyrrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 23 2,3-O-Isopropilideno-1-O-dodecil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-
- 24 etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 25 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-morfolinil- α -L-
- 26 xilo-2-hexulofuranosa
- 27 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-
- 28 hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 29 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-piperidinil- α -L-
- 30 xilo-2-hexulofuranosa
- 31 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-etilpirrolidinil)-
- 32 α -L-xilo-2-hexulofuranosa
- 33 2,3-O-Isopropilideno-1-O-decil-4-(metilcarbamato)-6-deoksi-6-(2-etilmorfolinil)-
- 34 α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-pirrolidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-morfolinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-hexametilenoimino- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-piperidinil- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

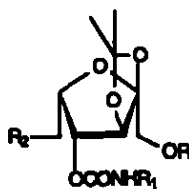
2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilpirrolidinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa

2,3-O-Isopropilideno-1-O-heptil-4-(metilcarbamato)-6-deoxi-6-(2-etilmorfolinil)- α -L-xilo-2-hexulofuranosa.

4. Una composición farmacéutica que comprenda una cantidad farmacéuticamente eficaz de un compuesto tal y como se lo ha definido en las reivindicaciones 1, 2 ó 3 y un vehículo que sea farmacéuticamente aceptable.

folios 386 y 387

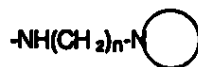
5. Un proceso, según la reivindicación 1, para la preparación de compuestos de la Fórmula I:



FORMULA I

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas, pro-medicamentos, metabólicos o polimorfos, en los que R sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne (cadena recta o ramificada), aril, aril o alquilaril sustituido y R₁ sea fenil o-, m- o p-clorofenil, tolil, metoxifenil o nitrofenil y R₂ sea H, pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexametilenioimino o una radical de la fórmula NHR₃, en la que R₃ sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada) o una radical de la Fórmula III:

359
354

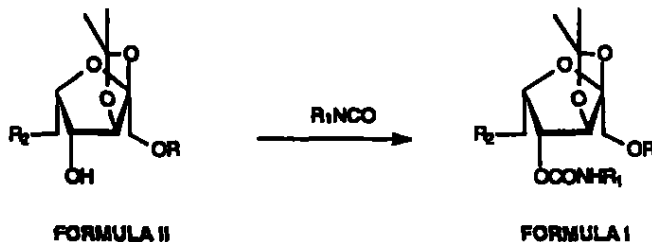


FORMULA III

en la que n es un número entero hasta 5 y



sea un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, que contenga uno o más heteroátomos, al tratar el compuesto de la Fórmula II con un isocianato idóneo y dentro de un disolvente idóneo, a baja temperatura, como sigue:

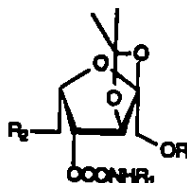


6. Un proceso según la reivindicación 5, en el que



corresponda a pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexametilenoimino.

7. El método para evitar, inhibir o suprimir la adhesión celular en un animal, que comprenda de la administración a dicho animal, de un compuesto que tenga la estructura de la Fórmula I:

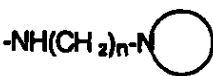


FORMULA I

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas, pro-medicamentos, metabólicos o polimorfos farmacéuticamente aceptables, en los que R sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne (cadena recta o ramificada), aril, substitución de aril o alquilaril y R₁ sea

360
355

fenil, o.- m- or p-clorofenil, tolil, metoxifenil o nitrofenil y R₂ sea H, pirrolidinil, piperidinil, morfilinil or hexametilenoimino o una radical de la fórmula NHR₃, en la que R₃ sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada) o una radical de la Fórmula III:



FORMULA III

en la que n es un número entero hasta 5 y



sea un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, que contenga uno o más heteroátomos.

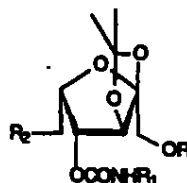
8. El método de la reivindicación 7, en el que



sea pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o contenga partes de hexametilenoimino.

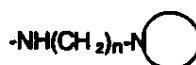
9. Un método para tratar a un animal que adolezca de asma bronquial, artritis reumática, esclerosis múltiple, diabetes tipo I, psoriasis, rechazo a injertos alopáticos, y otros desórdenes inflamatorios y/o auto inmunes y que comprenda de la administración a dicho animal de un compuesto de la estructura de la Fórmula I:

861
356



FORMULA I

en la que R es C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne (cadena recta o ramificada), aril, o alquilaril sustituido y R₁ sea fenil, o-, m- ó p-clorofenil, toliil, metoxifenil o nitrofenil y R₂ sea H, pirrolidinil, piperidinil, morfilinil o hexametilenoimino o una radical de la fórmula NHR₃, en la que R₃ sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada) o una radical de la Fórmula III:



FORMULA III

en la que n sea un número entero hasta 5 y



sea un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que contenga uno o más heteroátomos.

10. El método de la reivindicación 9, en la que



sea pirrolidinil, piperidinil, morfolinil o hexametilenoimino.

11. El método para prevenir, inhibir o suprimir la adhesión celular en un animal, y que comprenda el paso de administrar a dicho animal un compuesto farmacéutico que corresponda al contemplado en la reivindicación 4.

262
357

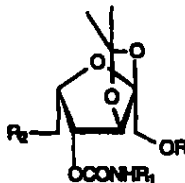
12. El método según la reivindicación 7 en la que el método es empleado para la prevención, inhibición o supresión de inflamación asociada con la adhesión celular.

13. El método según la reivindicación 7 en la cual dicho método se utiliza para prevenir, inhibir o suprimir una respuesta inmune o auto-inmune asociada con la adhesión celular.

14. El método según la reivindicación 7 o reivindicación 9 en las que tal método se emplea para tratar o prevenir una enfermedad seleccionada de entre el grupo comprendido por asma, artritis, psoriasis, rechazo a injerto alopático, esclerosis múltiple, diabetes y enfermedad inflamatoria de los intestinos.

EXTRACTO

Este invento se relaciona en general a compuestos por ejemplo el contenido en la estructura de la Fórmula I:



FORMULA I

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas, pro-
medicamentos, metabólicos o poliformos que sean farmacológicamente
aceptables, en los que R sea C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene, alkyne
(cadena recta o ramificada), aril, sustitución de aril o álciliaril y R₁ sea fenil *o*-,
m- or *p*-clorofenil, tolil, metoxifenil o nitrofenil y R₂ sea H, pirrolidinil, piperidinil,
morfolinil o hexametilenoimino o una radical de la fórmula NHR₃, en la que R₃ sea
C₁ con respecto a C₁₅ alquil, alkene o alkyne (cadena recta o ramificada), y
procesos para sintetizar derivados del ácido hexulofuranosónico 2-3-*O*-
isopropilideno- α -L-xilo-2. Los compuestos de este invento son útiles, entre otras
aplicaciones, para la inhibición y prevención de la adhesión celular y patologías
en las que interviene la adhesión celular, que incluyen enfermedades
inflamatorias y auto-inmunes, tales como asma bronquial, artritis reumática,
diabetes tipo I, esclerosis múltiple, rechazo a injertos alopáticos y psoriasis. Este
invento también se relaciona con los compuestos farmacológicos que contienen
derivados de ácido hexulofuranosónico 2-3-*O*-isopropilideno- α -L-xilo-2 y los
métodos para tratar las patologías que se han anotado anteriormente.