

A una solución de 5(R)-3-(3-fluoro-4-iodofenil)-5-hidroximetiloxazolidin-2-ona (2,00 g) en diclorometano (30 mL) se agregó trietilamina (1,24 mL) y cloruro de metanosulfonil (551 μ L) a 0 °C, el precipitado se mezcló a la misma temperatura durante 30 minutos. La mezcla se lavó con agua helada, se secó sobre anhídrido de sulfato de magnesio, se filtró, y luego se concentró al vacío. La mezcla del residuo y azida sódica (964 mg) en N,N-dimetilformamida (30 mL) se mezcló a 80 °C durante 2 horas y se concentró al vacío. Luego de diluir el residuo con agua, la mezcla se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se secaron sobre anhídrido de sulfato de magnesio, se filtraron, y luego se concentraron al vacío para proporcionar 5(R)-azidometil-3-(3-fluoro-4-iodofenil)oxazolidin-2-ona (2,18 g).

MS (EI⁺) m/z : 361 (M⁺).

HRMS (EI⁺) para C₁₀H₈FIN₄O₂ (M⁺): calculado, 361,9676; encontrado, 361,9698.

Paso 5

1-[5(R)-3-(3-Fluoro-4-iodofenil)-2-oxooxazolidin-5-ilmetil]-
1,2,3-triazol.

La mezcla de 5(R)-azidometil-3-(3-fluoro-4-iodofenil)oxazolidin-2-ona (2,18 g) y 2,5-norbornadieno (6,40 mL) en dioxano (45,6 mL) se mezcló a 80 °C durante 2 horas, 110 °C durante 4 horas, y luego se concentró al vacío para proporcionar el EJEMPLO DE REFERENCIA 13 (1,70 g).

MS (EI⁺) m/z: 388 (M⁺).

HRMS (EI⁺) para C₁₂H₁₀FIN₄O₂ (M⁺): calculado, 387,9833; encontrado, 387,9835.

EJEMPLO DE REFERENCIA 14

5(R)-Azidometil-3-(4-iodofenil)oxazolidin-2-ona.

El EJEMPLO DE REFERENCIA 14 (75,3 g) fue preparado desde 5(R)-3-(4-iodofenil)-5-hidroximetiloxazolidin-2-ona (70,0 g) de la misma manera que se describió en el EJEMPLO DE REFERENCIA 13.