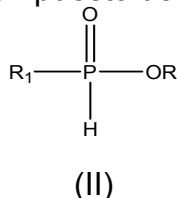


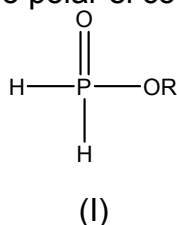
REIVINDICACIONES

1. Un proceso para preparar el compuesto de la fórmula (II)



5 en la que

R es un alquilo C₁-C₆ o bencilo y R₁ es alquilo C₁-C₆, que comprende hacer reaccionar en un disolvente no polar el compuesto de la fórmula (I)

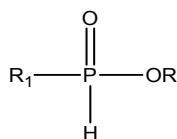


10 en la que

R es alquilo C₁-C₆ o bencilo,

con un agente de alquilación en presencia de una base.

2. El proceso según la reivindicación 1, en el que el compuesto de la fórmula (I) se preparó en el mismo disolvente no polar y sin ser aislado del disolvente
- 15 no polar antes de reaccionar con el agente de alquilación en presencia de una base, o en el que la reacción de alquilación es realizada en el mismo recipiente y en el mismo disolvente no polar que la reacción que preparó el compuesto de la fórmula (I).
3. El proceso según las reivindicaciones 1 o 2, en el que R es metilo o *n*-butilo.
- 20 4. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 1-3, en el que R₁ es metilo.
5. Un proceso para preparar el compuesto de la fórmula (II)



(II)

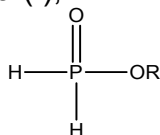
en la que

R es alquilo C₁-C₆ o bencilo, y

5 R₁ es alquilo C₁-C₆,

que comprende los pasos de:

(a) hacer reaccionar ácido hipofosforoso con un alquilo C₁-C₆ o un alcohol bencílico en presencia de un ácido en condiciones de deshidratación para dar el compuesto de la fórmula (I),



10

(I)

en la que

R es alquilo C₁-C₆ o bencilo; y

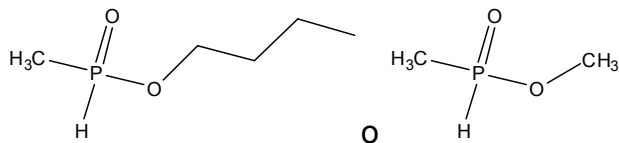
(b) hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (I) obtenido en el paso (a)

15 con un agente de alquilación en presencia de una base,

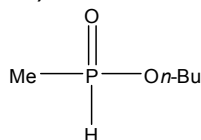
en el que cada paso es realizado en el mismo recipiente en un disolvente no polar, y en el que el producto del paso (a) no es purificado ni aislado antes del paso (b).

6. El proceso según la reivindicación 5, en el que R es metilo o *n*-butilo.
- 20 7. El proceso según la reivindicación 5, en el que R₁ es metilo.
8. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en el que el disolvente no polar es tolueno.

9. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 5-7, en el que el ácido es ácido sulfúrico.
10. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en el que el agente de alquilación es un agente de metilación.
- 5 11. El proceso según la reivindicación 10, en el que el agente de metilación es dimetil sulfato.
12. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en el que la base es una o más seleccionadas del grupo que comprende metóxido de sodio, hidruro de sodio y sal de amida de diisobutilo.
- 10 13. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 5-7, en el que en el paso (a) las condiciones de deshidratación comprenden calentamiento, la presencia de un secuestrante de agua, o ambos; o en el que el paso (a) se realiza bajo reflujo en condiciones Dean-Stark.
14. El proceso según la reivindicación 13, en el que el secuestrante de agua es
15 cloruro de calcio, sulfato de sodio, sulfato de calcio, sulfato de magnesio o cribas moleculares.
15. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 1-14, en el que la alquilación se realiza en presencia de un agente de transferencia de fase y/o un agente quelante.
- 20 16. El proceso según la reivindicación 15, en el que el agente de transferencia de fase es Bu_4NX , MeNBu_3X , Aliquat® 336, Oct_4NX , Oct_3NMeX , Me_4NX o Ph_4PX , en donde $\text{X}=\text{Cl}$, Br , I o HSO_4 , y el agente quelante es 18-corona-6, 15-corona-5, 12-corona-4 o PEG-400.
17. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 1-16, en el que el
25 compuesto producido presenta la estructura



18. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 5-17 para preparar el compuesto de la fórmula (IIa):

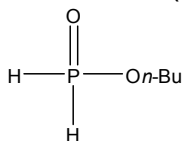


5

(IIa)

que comprende los pasos de:

(a) hacer reaccionar una solución acuosa de ácido hipofosforoso con alcohol n-butilico en presencia de ácido sulfúrico en condiciones de deshidratación para obtener el compuesto de la fórmula (Ia)



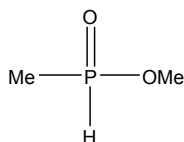
10

(Ia); y

(b) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (a) con dimetil sulfato en presencia de metóxido de sodio,

en donde cada paso es realizado en tolueno, y en donde el producto del paso

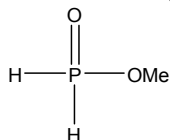
15 (a) no es purificado ni aislado antes del paso (b); o para preparar el compuesto de la fórmula (IIb):



(IIb)

que comprende los pasos de:

(a) hacer reaccionar una solución acuosa de ácido hipofosforoso con alcohol metílico en presencia de ácido sulfúrico en condiciones de deshidratación para obtener el compuesto de la fórmula (Ib)



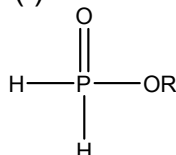
5

(Ib); y

(b) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (a) con dimetil sulfato en presencia de metóxido de sodio, en donde cada paso es realizado en tolueno, y en donde el producto del paso (a) no es purificado ni aislado antes del paso (b).

10

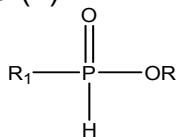
19. En un proceso para preparar glufosinato que comprende convertir el compuesto de la fórmula (I)



(I)

15

en el compuesto de la fórmula (II):

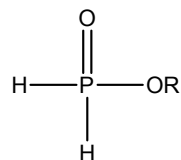


(II)

en donde R es alquilo C₁-C₆ o bencilo y R₁ es metilo, la mejora consiste en convertir el compuesto de la fórmula (I) en el compuesto de la fórmula (II) por medio del proceso de una cualquiera de las reivindicaciones 1-4, 8, 10-12 y 15-17.

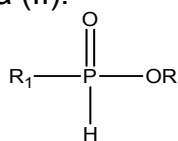
20

20. Un proceso para preparar glufosinato que comprende convertir el compuesto de la fórmula (I)



(I)

5 en el compuesto de la fórmula (II):



(II)

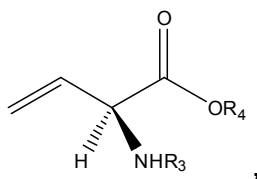
en la que R es alquilo C₁-C₆ o bencilo y R₁ es metilo, por medio del proceso de una cualquiera de las reivindicaciones 1-4, 8, 10-12 y 15-17.

10 21. El proceso según la reivindicación 20, que comprende, además:

(b) convertir el compuesto de la fórmula (II) en glufosinato.

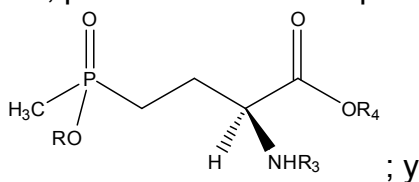
22. El proceso según la reivindicación 20, que comprende, además:

(b) hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (II) con un compuesto que tiene la estructura:



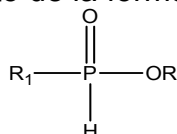
15

en la que R₃ es un grupo de protección amina y R₄ es un grupo de protección de ácido carboxílico, para obtener un compuesto que tiene la estructura:



(c) desproteger el grupo de protección amina R_3 , desproteger el grupo de protección de ácido carboxílico R_4 e hidrolizar el grupo alquilo C_1-C_6 o el grupo bencilo R del compuesto obtenido en el paso (b) para producir glufosinato.

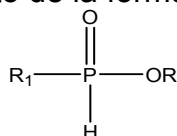
- 5 23. En un proceso para preparar glufosinato que comprende convertir ácido hipofosforoso en el compuesto de la fórmula (II):



(II)

- 10 en la que R es alquilo C_1-C_6 o bencilo y R_1 es metilo, la mejora comprende convertir el ácido hipofosforoso en el compuesto de la fórmula (II) por medio del proceso de una cualquiera de las reivindicaciones 5-17.

24. Un proceso para preparar glufosinato que comprende convertir ácido hipofosforoso en el compuesto de la fórmula (II):



(II)

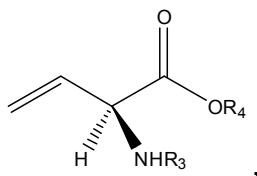
- 15 en la que R es alquilo C_1-C_6 o bencilo y R_1 es metilo, por medio del proceso de una cualquiera de las reivindicaciones 5-17.

25. El proceso según la reivindicación 24, que comprende, además:

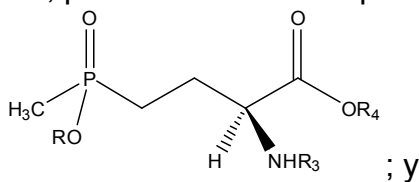
(b) convertir el compuesto de la fórmula (II) en glufosinato.

- 20 26. El proceso según la reivindicación 24, que comprende, además:

(b) hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (II) con un compuesto que tiene la estructura:



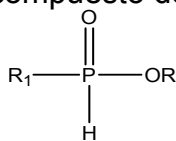
en la que R_3 es un grupo de protección amina y R_4 es un grupo de protección de ácido carboxílico, para obtener un compuesto que tiene la estructura:



- 5 (c) desproteger el grupo de protección amina R_3 , desproteger el grupo de protección de ácido carboxílico R_4 e hidrolizar el grupo alquilo C_1-C_6 o el grupo bencilo R del compuesto obtenido en el paso (b) para producir glufosinato.

27. Un proceso para preparar el compuesto de la fórmula (V)

10



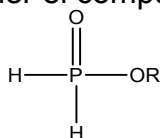
(V)

en la que

R es alquilo C_1-C_6 o bencilo y R_1 es alquilo C_1-C_6 ,

que comprende los pasos de:

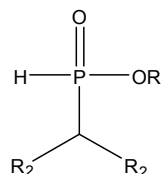
- 15 (a) hacer reaccionar ácido hipofosforoso con un alquilo C_1-C_6 o un alcohol bencilico en presencia de un ácido en condiciones de deshidratación en un disolvente no polar para obtener el compuesto de la fórmula (I)



(I)

en la que R es alquilo C₁-C₆ o bencilo;

(b) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (a) con un ortoformiato de trialquilo para obtener el compuesto de la fórmula (II):

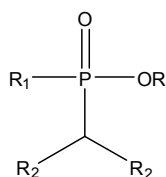


5

(II)

en la que R₂ es O-alquilo;

(c) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (b) con un agente de alquilación en presencia de una base para obtener un compuesto de la fórmula (III):

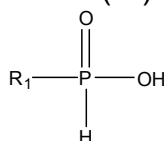


10

(III)

en la que R es alquilo C₁-C₆ o bencilo; R₁ es alquilo C₁-C₆; y R₂ es O-alquilo;

(d) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (c) con un ácido para obtener un compuesto de la fórmula (IV):



15

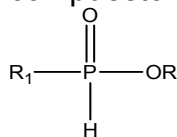
(IV)

en la que R₁ es alquilo C₁-C₆;

(e) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (d) con un alcohol alquílico en presencia de un ácido en condiciones de deshidratación en un disolvente no polar para obtener el compuesto de la fórmula (V).

20

28. Un proceso para preparar un compuesto de la fórmula (IV):



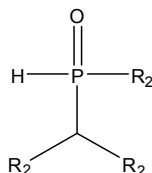
(IV)

en la que

5 R es alquilo C₁-C₆ o bencilo, y R₁ es alquilo C₁-C₆,

que comprende los pasos de:

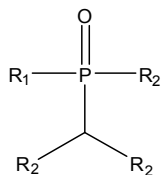
(a) hacer reaccionar ácido hipofosforoso con un ortoformiato de trialquilo para obtener el compuesto de la fórmula (I):



(I)

en la que cada R₂ es O-alquilo;

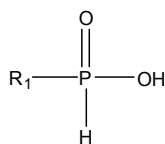
(b) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (a) con un agente de alquilación en presencia de una base para obtener el compuesto de la fórmula (II):



(II)

en el que R₁ es alquilo C₁-C₆ o bencilo; y cada R₂ es O-alquilo;

(c) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (b) con un ácido para obtener el compuesto de la fórmula (III):

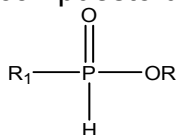


(III)

en la que R_1 es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$;

- (d) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (c) con un alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ alcohol o un alcohol bencílico en presencia de un ácido en condiciones de deshidratación en un disolvente no polar para obtener el compuesto de la fórmula (IV).

29. Un proceso para preparar el compuesto de la fórmula (II)



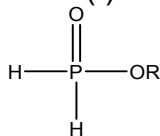
(II)

en la que

R es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o bencilo y R_1 es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$,

que comprende los pasos de:

- (a) hacer reaccionar ácido hipofosforoso con un alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o un alcohol bencílico en presencia de un ácido en condiciones de deshidratación para obtener el compuesto de la fórmula (I)



(I)

en la que

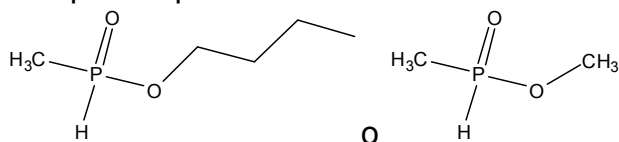
R es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o bencilo; y

(b) hacer reaccionar el compuesto obtenido en el paso (a) con un agente de alquilación en presencia de una base para dar el compuesto de la fórmula (II).

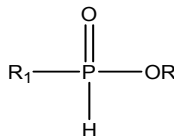
30. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 27-29, en el que R es metilo o *n*-butilo.

31. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 27-29, en el que R₁ es metilo.

32. El proceso según una cualquiera de las reivindicaciones 27-31, en el que el compuesto producido tiene la estructura

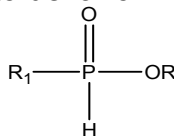


33. En un proceso para preparar glufosinato que comprende convertir ácido hipofosforoso en el compuesto de la fórmula (II):



en la que R es alquilo C₁-C₆ o bencilo y R₁ es metilo, la mejora comprende convertir el ácido hipofosforoso en el compuesto de la fórmula (II) por medio del proceso de una cualquiera de las reivindicaciones 27-32.

34. Un proceso para preparar glufosinato que comprende convertir ácido hipofosforoso en el compuesto de la fórmula (II):



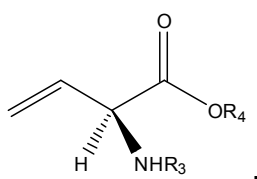
en el que R es alquilo C₁-C₆ o bencilo; y R₁ es metilo, por medio del proceso de una cualquiera de las reivindicaciones 27-32.

35. El proceso según la reivindicación 34, que comprende, además:

(b) convertir el compuesto de la fórmula (II) en glufosinato.

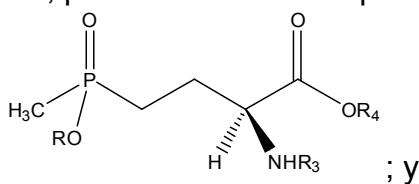
5 36. El proceso según la reivindicación 34, que comprende, además:

(b) hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (II) con un compuesto que tiene la estructura:



en la que R₃ es un grupo de protección amina y R₄ es un grupo de protección de ácido carboxílico, para obtener un compuesto que tiene la estructura:

10



(c) desproteger el grupo de protección amina R₃, desproteger el grupo de protección de ácido carboxílico R₄ e hidrolizar el grupo alquilo C₁-C₆ o bencilo R para producir glufosinato.