

REIVINDICACIONES

1. Método para la preparación de un compuesto de fórmula química (2) que comprende,

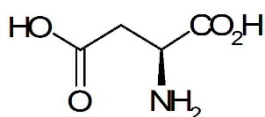
1) una etapa de introducir un grupo protector P_1 en el grupo amina de un compuesto de fórmula química 6 para obtener un compuesto de fórmula química 5 en el que el grupo amina está protegido;

2) una etapa de obtener un compuesto de fórmula química 4 mediante ciclación a través de una reacción de condensación del compuesto de fórmula química 5 producido en la etapa 1) con un catalizador ácido;

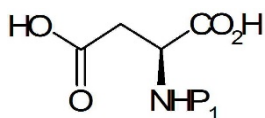
3) una etapa de introducir un grupo protector P_2 en el grupo ácido carboxílico del compuesto de fórmula química 4 producido en la etapa 2) y convertir el grupo ácido carboxílico en un grupo éster para obtener un compuesto de fórmula química 3; y

4) una etapa de hacer reaccionar con una fuente de nitrógeno el compuesto de la fórmula química 3 producido en la etapa 3) para obtener un compuesto de amida de fórmula química 2 a través de desciclación de oxazolidinona:

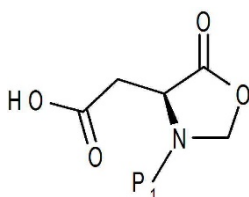
[Fórmula química 6]



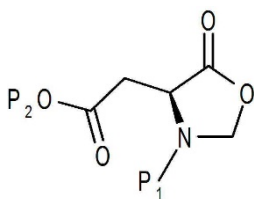
[Fórmula química 5]



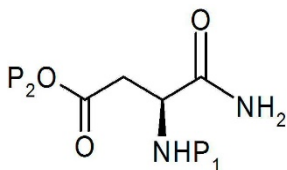
[Fórmula química 4]



[Fórmula química 3]



[Fórmula química 2]



donde,

P_1 es un grupo carbonilo, un grupo acilo, un grupo sulfonilo, un grupo acetilo o un grupo bencilo como grupo protector de amina,
y P_2 es un grupo protector de ácido carboxílico.

2. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que P_1 es Boc (butiloxycarbonilo), Cbz (benciloxycarbonilo) o Fmoc (9-fluorenilmetiloxycarbonilo).

3. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que P_2 es un grupo bencilo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo i-propilo o un grupo i-butilo.

4. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 1) usa una o más clases de bases de reacción seleccionadas de trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, t-butoxido de litio, t-butoxido de potasio, t-butoxido de sodio e hidróxido de sodio.

5. Método para la preparación según la reivindicación 4, en el que la base de reacción se usa en una cantidad de 2 equivalentes a 3 equivalentes en base

al compuesto de fórmula química 6.

6. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 1) usa un disolvente de reacción, de una o más clases de disolventes orgánicos seleccionados del grupo que consiste en alcohol isopropílico, alcohol etílico, dicloroetano, diclorometano, tetrahidrofurano y dioxano o un disolvente mixto del disolvente orgánico y agua.

7. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 2) se lleva a cabo mediante una reacción de condensación haciendo reaccionar paraformaldehído y el compuesto de fórmula química 5 con un catalizador ácido.

8. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 2) se caracteriza por,

(1) usar paraformaldehído; ácido paratoluenosulfónico (p-TsOH)-H₂O como catalizador ácido; y tolueno o acetato de etilo-benceno como disolvente de reacción, o

(2) usar paraformaldehído; *p*-toluenosulfonato de piridinio (PPTS) como catalizador ácido; y tolueno-acetato de etilo como disolvente de reacción.

9. Método para la preparación según la reivindicación 1, que comprende además recrystalizar en un disolvente mixto de acetato de etilo y tolueno para obtener el compuesto sólido de fórmula química 4, después de completarse la reacción en la etapa 2).

10. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 3) usa un único disolvente de alcohol t-butílico, alcohol isopropílico, alcohol etílico, alcohol metílico o tetrahidrofurano, o un disolvente mixto que mezcla 2 o más de los disolventes, como disolvente de reacción.

11. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la

etapa 3) usa 4-dimetilaminopiridina (DMAP) como catalizador.

12. Método para la preparación según la reivindicación 11, en el que el catalizador se usa en una cantidad de 0,05 a 0,2 equivalentes en base al compuesto de fórmula química 4.

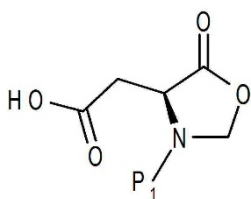
13. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 3) se realiza a una temperatura de reacción de temperatura ambiente a 60°C.

14. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 4) usa una o más clases de disolventes de reacción seleccionados del grupo que consiste en alcohol t-butílico, alcohol metílico, alcohol etílico, alcohol n-butílico, n-propanol e i-propanol.

15. Método para la preparación según la reivindicación 1, en el que la etapa 4) se realiza a una temperatura de reacción en el intervalo de 60 a 80°C.

16. Compuesto de la siguiente fórmula química 4:

[Fórmula química 4]

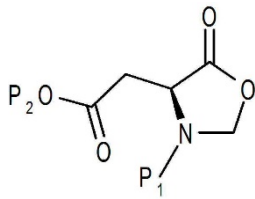


en la que,

P₁ representa un grupo carbonilo, un grupo acilo, un grupo sulfonilo, un grupo acetilo o un grupo bencilo.

17. Compuesto de la siguiente fórmula química 3:

[Fórmula química 3]



en la que,

P_1 es un grupo carbonilo, un grupo acilo, un grupo sulfonilo, un grupo acetilo o un grupo bencilo; y

P_2 representa un grupo bencilo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo i-propilo o un grupo t-butilo.