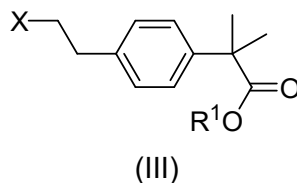


REIVINDICACIONES

1. Procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (III)

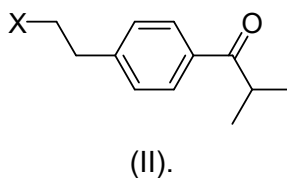


5 o un solvato del mismo, en la que

X es un grupo saliente; y

R¹ es alquilo C₁-C₆;

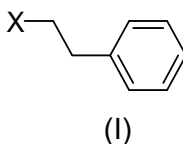
que comprende la transposición oxidativa de un compuesto de fórmula (II) o un solvato del mismo



10

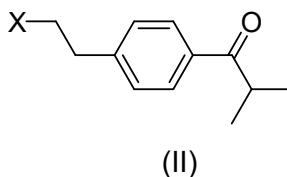
2. Procedimiento según la reivindicación 1, que comprende:

(a) acilación de un compuesto de fórmula (I)



15

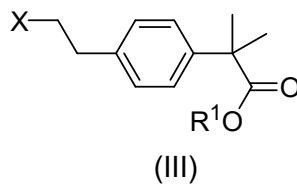
o un solvato del mismo, en la que X es un grupo saliente, para proporcionar un compuesto de fórmula (II)



20

o un solvato del mismo, y

(b) transposición oxidativa de un compuesto de fórmula (II), o un solvato del mismo, para proporcionar un compuesto de fórmula (III)

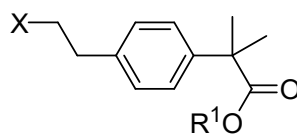


25

o un solvato del mismo, en la que R¹ es alquilo C₁-C₆.

3. Procedimiento según la reivindicación 1, en el que X se selecciona de Cl, Br, I, OMs, OTs y OTf.
4. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que la transposición oxidativa se lleva a cabo en presencia de un ortoéster de trialquilo C₁-C₆, un alcohol C₁-C₆ o una mezcla de los mismos, un agente oxidante y un catalizador ácido.
5. Procedimiento según la reivindicación 4, en el que el agente oxidante es un agente oxidante de yodo, tal como I₂, ICl, ICl₃, HIO₃, PhI(OAc)₂, PhI(OCOCF₃)₂, PhI(OTf)₂, PhI(OH)OTs, PhIO, NIS, IBX o DMP.
6. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 4 ó 5, en el que el catalizador ácido se selecciona de ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido fosfórico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido alcanforsulfónico, ácido p-toluenosulfónico, ácido metanosulfónico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido cítrico, ácido oxálico, ácido succínico, ácido tartárico y ácido málico.
7. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 2 a 6, en el que la acilación se lleva a cabo en presencia de un agente acilante seleccionado de (iPrCO)₂O y un compuesto de fórmula iPrCO-Z, en la que Z se selecciona de OH, Cl, Br e I.
8. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 2 a 7, en el que la acilación se lleva a cabo en presencia de un ácido prótico y/o un ácido de Lewis.
9. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, que comprende convertir el compuesto de fórmula (III), o un solvato del mismo, en bilastina, o una sal o un solvato de la misma.
10. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, que comprende además:
 - (c) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (III)

26



(III)

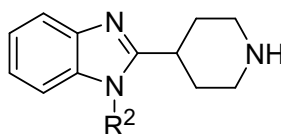
o un solvato del mismo, en la que

X es un grupo saliente; y

5

R¹ es alquilo C₁-C₆;

con un compuesto de fórmula (IV)

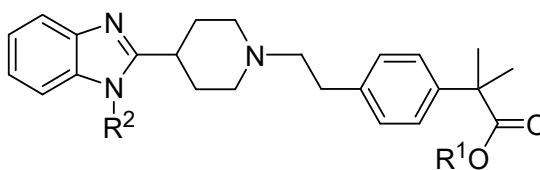


(IV)

o una sal o un solvato del mismo, en la que R² se selecciona de H y
-CH₂CH₂OEt;

10

para proporcionar un compuesto de fórmula (V)



(V)

o una sal o un solvato del mismo; y

15

(d) convertir el compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, en bilastina, o una sal o un solvato de la misma.

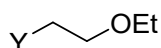
11. Procedimiento según la reivindicación 10, en el que R² en los compuestos de fórmula (IV) y (V) es -CH₂CH₂OEt y la etapa (d) comprende la hidrólisis del grupo éster en el compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, para proporcionar bilastina, o una sal o un solvato de la misma.

20

12. Procedimiento según la reivindicación 10, en el que R² en los compuestos de fórmula (IV) y (V) es H y la etapa (d) comprende:

25

(d1) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, en la que R² es H, con un compuesto de fórmula (VI)



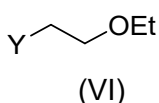
(VI)

en la que Y es un grupo saliente,

para proporcionar un compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, en la que R^2 es $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$; y

- (d2) someter a hidrólisis el grupo éster en el compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, en la que R^2 es $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$, para proporcionar bilastina, o una sal o un solvato de la misma.

13. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 10 ó 12, en el que la etapa (d) comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, en la que R^2 es H, con un compuesto de fórmula (VI)

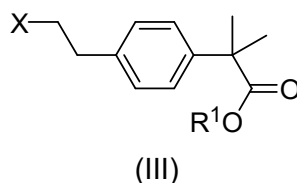


en la que Y es un grupo saliente,

y someter a hidrólisis el grupo éster en un compuesto de fórmula (V), o una sal o un solvato del mismo, para proporcionar bilastina, o una sal o un solvato de la misma, en una sola etapa de reacción.

14. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, que comprende además:

- (c') someter a hidrólisis un compuesto de fórmula (III)

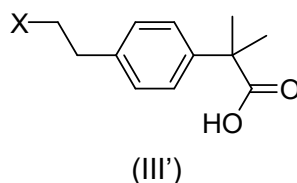


o un solvato del mismo, en la que

X es un grupo saliente; y

R^1 es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$;

para proporcionar un compuesto de fórmula (III')

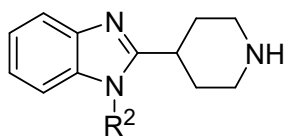


o una sal o un solvato del mismo;

- (d') hacer reaccionar un compuesto de fórmula (III'), o una sal o un solvato del mismo, con un compuesto de fórmula (IV)

30

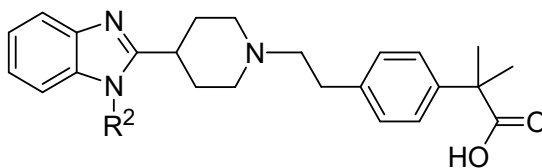
28



(IV)

o una sal o un solvato del mismo, en la que R² se selecciona de H y -CH₂CH₂OEt;

5 para proporcionar un compuesto de fórmula (V')



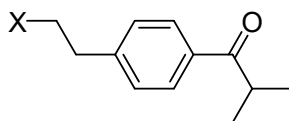
(V')

o una sal o un solvato del mismo; y

(e') si fuese necesario, convertir el compuesto de fórmula (V'), o una sal o un

10 solvato del mismo, en bilastina, o una sal o un solvato de la misma.

15. Compuesto de fórmula (II')



(II')

15 o un solvato del mismo, en la que X se selecciona de Cl, I, OMs, OTs y OTf.