

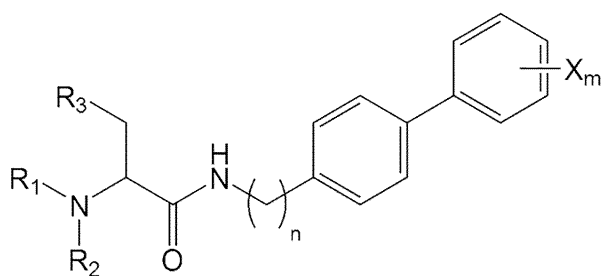
Descripción

Reivindicaciones

Reivindicación 1

Un compuesto representado por la siguiente Fórmula 1, un estereoisómero del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:

[Fórmula 1]



en la Fórmula 1,

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5,

R₁, R₂, y R₃ son cada uno independientemente iguales o diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno, un alquilo C₁₋₇, un alquilo C₃₋₆, hidroxilo, un halógeno, un alquilo C₁₋₇ halogenado, un alquilo C₁₋₇ y un alquilo C₁₋₇ halogenado, y

X es m sustituyentes (m es un número entero de 1 a 5) que son iguales o diferentes entre sí, seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C₁₋₇ halogenado y un grupo alcoxi C₁₋₇ halogenado.

Reivindicación 2

El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 1, donde R₁ y R₂ son cada uno independientemente H o metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, ciclobutilo, n-pentilo, ciclopentilo, n-hexilo o ciclohexilo, y

R₃ es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo o terc-butilo.

Reivindicación 3

El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 1, en el que X es uno o dos sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados del grupo que consiste en flúor, cloro, trifluorometilo y trifluorometoxi.

Reivindicación 4

El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 3, en el que X es p-fluoro, m-fluoro, p,m-difluoro, p-cloro, m-cloro, p,m-dicloro, p-trifluorometilo o p-trifluorometoxi.

Reivindicación 5

El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 1, en el que el compuesto es

- 1) 2-amino-N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)butanamida;
- 2) 2-amino-N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)pentanamida;
- 3) 2-amino-N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)hexanamida;
- 4) 2-amino-N-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)pentanamida;
- 5) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(metilamino)butanamida;
- 6) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(metilamino)pentanamida;
- 7) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(metilamino)hexanamida;
- 8) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(dimetilamino)pentanamida;
- 9) 2-amino-N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 10) 2-amino-N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)hexanamida;
- 11) 2-amino-N-((4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 12) 2-amino-N-((4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)hexanamida;
- 13) 2-amino-N-((4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 14) 2-amino-N-((4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)hexanamida;

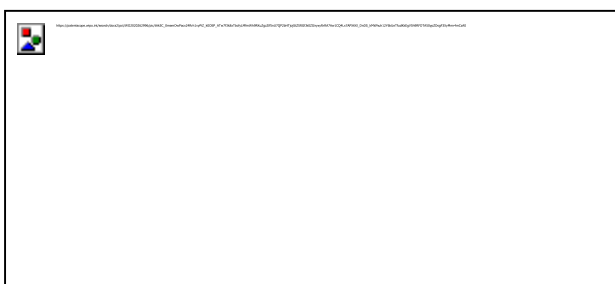
- 15) N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)pentanamida;
- 16) 2-(metilamino)-N-((4'-(triflorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 17) N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(dimetilamino)pentanamida;
- 18) 2-amino-N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 19) 2-amino-N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 20) 2-amino-N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 21) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 22) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 23) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 24) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 25) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 26) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 27) 2-amino-N-(2-(3',4'-difluoro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 28) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)butanamida;
- 29) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)pentanamida;
- 30) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)hexanamida;
- 31) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 32) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 33) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 34) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 35) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 36) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida; o
- 37) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(dimetilamino)pentanamida.

Reivindicación 6

Un método para preparar el compuesto, el estereoisómero del mismo, o la sal

farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, el método comprendiendo un primer paso para formar un enlace peptídico haciendo reaccionar un compuesto derivado del ácido aminoalcanoico protegido por un grupo protector butoxicarbonilo (Boc), que está representado por la siguiente Fórmula 2, con un compuesto derivado de bifenilo que contiene un grupo amina primaria, que está representado por la siguiente Fórmula 3; y un segundo paso para eliminar el grupo protector Boc haciendo reaccionar el compuesto obtenido en el primer paso con un ácido:

[Fórmula 1]



[Fórmula 2]



[Fórmula 3]



en las fórmulas,

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5,

R₁, R₂ y R₃ son cada uno independientemente iguales o diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno, un alquilo C₁₋₇, hidroxilo, un halógeno, un

alquilo C₁₋₇ halogenado, un alquilo C₁₋₇ y un alquilo C₁₋₇ halogenado, y

X es m sustituyentes (m es un número entero de 1 a 5) que son iguales o diferentes entre sí, seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C₁₋₇ halogenado y un grupo alcoxi C₁₋₇ halogenado.

Reivindicación 7

El método de la reivindicación 6, en el que el compuesto derivado del ácido aminoalcanoico protegido por el grupo protector Boc, que está representado por la Fórmula 2, se prepara haciendo reaccionar un derivado de aminoácido representado por la siguiente Fórmula 4 con dicarbonato de di-terc-butilo (anhídrido Boc):

[Fórmula 4]



en la fórmula,

R₁', R₂ y R₃ son cada uno independientemente iguales o diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno, un alquilo C₁₋₇, hidroxilo, un halógeno, un alquilo C₁₋₇ halogenado, un alquilo C₁₋₇ y un alquilo C₁₋₇ halogenado.

Reivindicación 8

El método de la reivindicación 7, en el que cuando R₂ del compuesto finalmente preparado es un alquilo, se realiza adicionalmente una etapa de alquilación del compuesto haciendo reaccionar el compuesto con un haloalcano en presencia de una base después de la reacción anterior.

Reivindicación 9

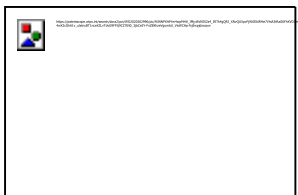
El método de la reivindicación 6, en el que un compuesto derivado de bifenilo que comprende

un grupo amina primaria, que está representado por la Fórmula 3, se prepara haciendo reaccionar un derivado de alquilamina C_{0-2} en el que un grupo halofenilo en un extremo está sustituido, el cual está representado por la siguiente Fórmula 5, con dicarbonato de di-terc-butilo para introducir un grupo protector Boc en un grupo amina, luego haciendo reaccionar el derivado de alquilamina resultante con un derivado de ácido fenilborónico representado por la siguiente Fórmula 6, y luego haciendo reaccionar los reactivos con un ácido para eliminar el Grupo protector Boc:

[Fórmula 5]



[Fórmula 6]



en las fórmulas,

X' es un halógeno, y

X es m sustituyentes (m es un número entero de 1 a 5) que son iguales o diferentes entre sí, seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C_{1-7} halogenado y un grupo alcoxi C_{1-7} halogenado.

Reivindicación 10

El método de la reivindicación 9, en el que la reacción con el derivado del ácido fenilborónico se logra mediante una reacción de acoplamiento cruzado usando un catalizador metálico en presencia de una base.

Reivindicación 11

El método de la reivindicación 6, en el que el primer paso se logra mediante una reacción de acoplamiento de anhídrido realizada en un disolvente orgánico en presencia de N-metilmorfolina (NMM) y cloroformiato de isobutilo (IBCF)

Reivindicación 12

El método de la reivindicación 6, que comprende además un tercer paso de formar una amina secundaria alquilando la amina después del segundo paso cuando tanto R₁ como R₂ del compuesto finalmente preparado son un alquilo.

Reivindicación 13

Una composición antifúngica que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

Reivindicación 14

La composición antifúngica de la reivindicación 13, en la que la composición antifúngica exhibe actividad antifúngica contra *Cryptococcus neoformans*, *Candida albicans*, *Candida glabrata*, o *Aspergillus fumigatus*.

Reivindicación 15

Una composición farmacéutica para tratar o prevenir una enfermedad infecciosa fúngica, que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

Reivindicación 16

La composición farmacéutica de la reivindicación 15, en la que la enfermedad infecciosa fúngica es causada por infecciones de *Cryptococcus neoformans*, *Candida albicans*, *Candida glabrata*, o *Aspergillus fumigatus*.

Reivindicación 17

La composición farmacéutica de la reivindicación 15, que comprende además un vehículo, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable.

Reivindicación 18

Una composición antibacteriana que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

Reivindicación 19

La composición antibacteriana de la reivindicación 18, en la que la composición antibacteriana exhibe actividad antibacteriana contra bacterias Gram negativas, bacterias Gram positivas o bacterias resistentes a múltiples fármacos.

Reivindicación 20

Una composición farmacéutica para tratar o prevenir una enfermedad infecciosa bacteriana, que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

Reivindicación 21

Una composición farmacéutica para tratar o prevenir una enfermedad antiinflamatoria, que comprende el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, y un vehículo, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable.