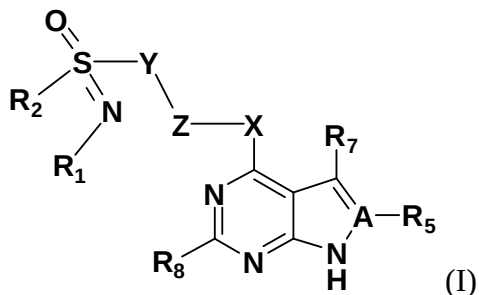


Reivindicaciones

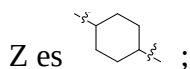
1. Un compuesto representado por una fórmula general I o una sal farmacéuticamente aceptable, estereoisómero, éster o metabolito, del mismo:



En donde A se selecciona de C o N; cuando A es N, R₅ está ausente; cuando A es C, R₅ se selecciona de: H, alquilo C₁₋₃ y -Oalquilo C₀₋₂;

X se selecciona de: $\begin{array}{c} \text{R} \\ | \\ \text{---N---} \\ | \end{array}$; R se selecciona de: alquilo C₁₋₆ lineal; H en el átomo de carbono se puede sustituir por los siguientes grupos: deuterio, hidroxilo, -CN, -OCH₂F, -OCHF₂, -OCF₃, alquilo C₁₋₃ lineal o , cicloalquilo C₃₋₆;

Y se selecciona de: $\begin{array}{c} \text{R}_3 \\ | \\ \text{---(C)}_m\text{---} \\ | \\ \text{R}_4 \end{array}$; R₃ y R₄ se seleccionan independientemente de: H, halógeno, -CN, alquilo C₁₋₆ lineal, cicloalquilo C₃₋₆; el alquilo puede estar opcionalmente sustituido por uno o más de los siguientes grupos: hidroxilo, -O alquilo C₁₋₁₀, -N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), arilo C₆₋₁₈, heterocicloalquilo o heterocicloarilo, m se selecciona entre 0, 1, 2, 3 o 4;



R₁ y R₂ se seleccionan independientemente de: H, halógeno, -CN, -OCH₂F, -OCHF₂, -OCF₃, alquilo C₁₋₁₀ lineal o ramificado, cicloalquilo C₃₋₁₀, alquilo -OC₀₋₁₀, -N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), -O heterocicloalquilo, -N heterocicloalquilo , -S heterocicloalquilo, fenilo, -N heterocicloarilo, -S heterocicloarilo o -O heterocicloarilo, en donde, H en el átomo de carbono o nitrógeno se puede sustituir por los grupos siguientes: deuterio, hidroxilo, halógeno, -CN, -OCH₂F, -OCHF₂, -OCF₃, alquilo C₁₋₆ lineal,

-N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), alquilo -OC₀₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₁₀, -O heterocicloalquilo, -N heterocicloalquilo, -S heterocicloalquilo, fenilo, -N heterocicloarilo, -O heterocicloarilo o -S heterocicloarilo; en donde H en el fenilo o heterocicloarilo se puede sustituir por uno o más de los siguientes grupos: halógeno, alquilo C₁₋₄ lineal, -N(alquilo C₀₋₁₀)SO₂(alquilo C₀₋₁₀), -CON(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), -N(alquilo C₀₋₁₀)CO(alquilo C₀₋₁₀), -N(alquilo C₀₋₁₀)COO(alquilo C₀₋₁₀), -OCON(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), -CN, -OCH₂F, -OCHF₂, -OCF₃, -N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), alquilo -OC₀₋₁₀, -N heterocicloarilo, -O heterocicloarilo o -S heterocicloarilo,;

R₇ and R₈ se seleccionan independientemente de: H, halógeno, alquilo C₁₋₃ y -Oalquilo C₀₋₂.

2. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable, estereoisómero, éster o metabolito del mismo según la reivindicación 1, caracterizado porque

R₁ se selecciona de: H, alquilo C₁₋₆ lineal, y cicloalquilo C₃₋₆; y H en el átomo de carbono se puede sustituir por los siguientes grupos: deuterio, hidroxilo, halógeno, -CN, -OCF₃, -N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), alquilo -OC₀₋₄, cicloalquilo C₃₋₁₀, -O heterocicloalquilo, -N heterocicloalquilo, y fenilo;

R₂ se selecciona de: Alquilo C₁₋₆ lineal, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalcoxi C₃₋₈, -N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), fenilo, y -N heterocicloarilo; H en el átomo de carbono o nitrógeno se puede sustituir por uno o más de los siguientes grupos: deuterio, hidroxilo, halógeno, -CN, OCH₂F, -OCHF₂, -OCF₃, alquilo C₁₋₃ lineal, -N(alquilo C₀₋₁₀)(alquilo C₀₋₁₀), alquilo -OC₀₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₁₀, -O heterocicloalquilo, -N heterocicloalquilo, fenilo, -N heterocicloarilo, -O heterocicloarilo o -S heterocicloarilo.

3. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable, estereoisómero, éster o metabolito deuterado del mismo según la reivindicación 2, caracterizado porque cuando A es C, el R₅ se selecciona de: H, y -CH₃;

R₃ y R₄ se seleccionan independientemente de: H; m se selecciona de 0, 1, o 2;

R₇ y R₈ se seleccionan independientemente de: H, y -CH₃.

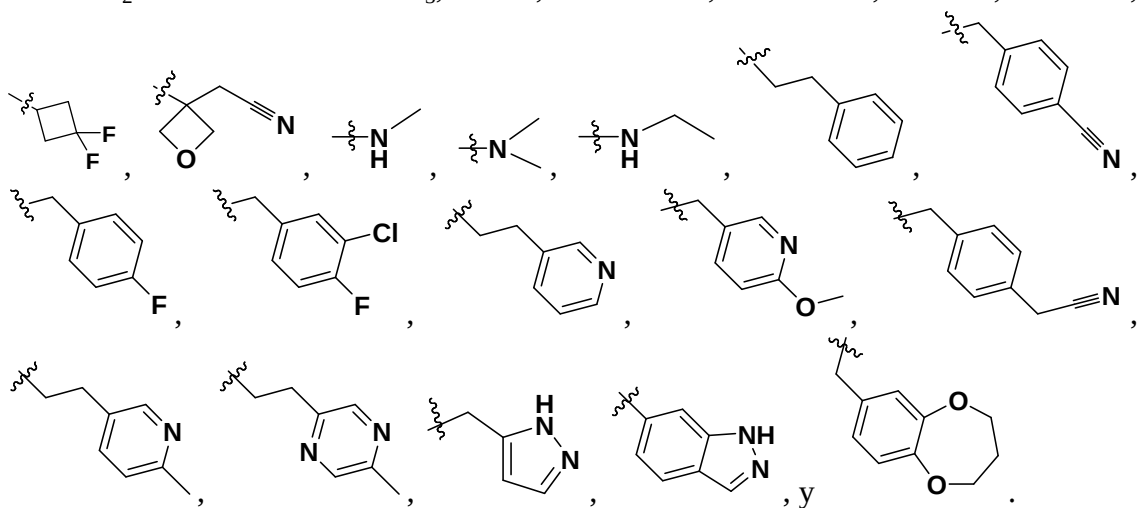
siguiente fórmula estructural:



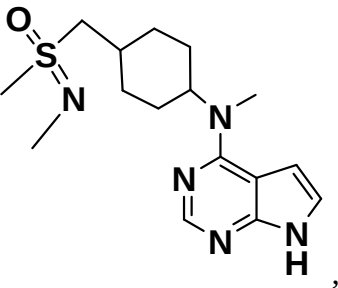
En donde,

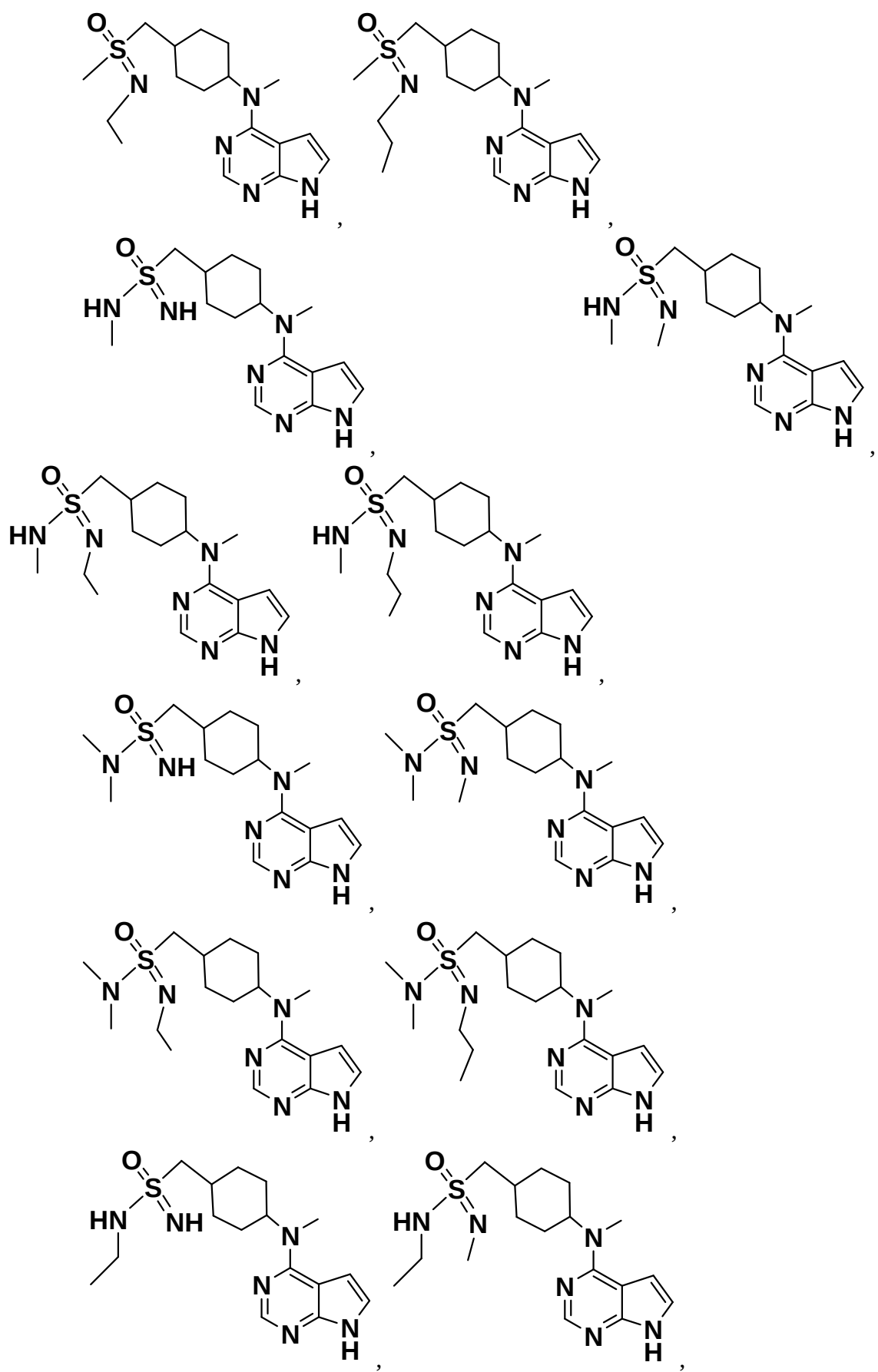
R₁ se selecciona de: H, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂OCH₃, y ;

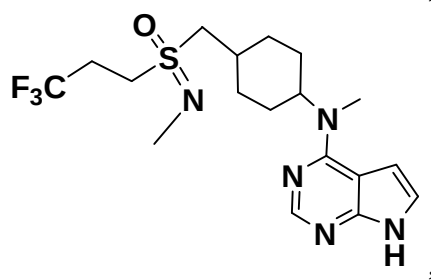
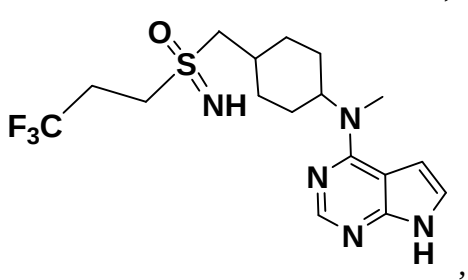
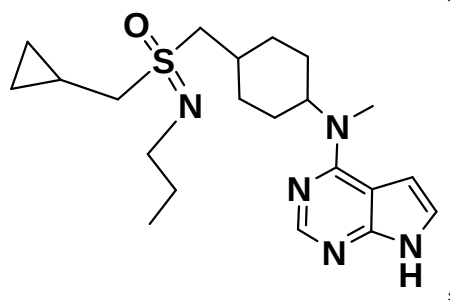
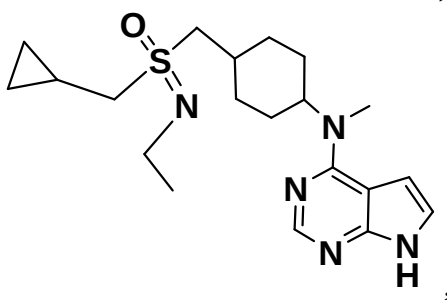
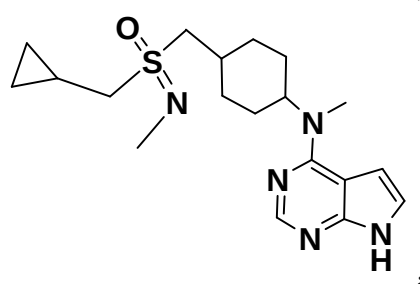
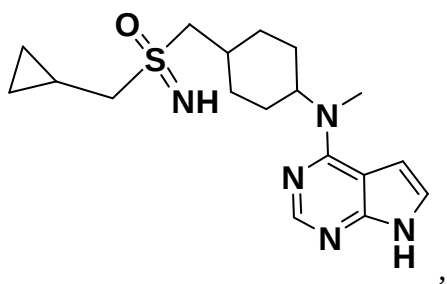
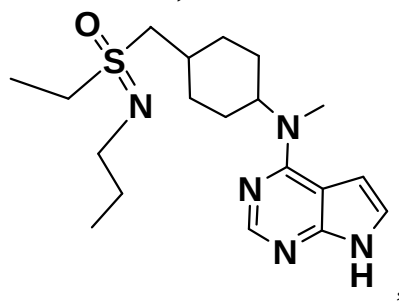
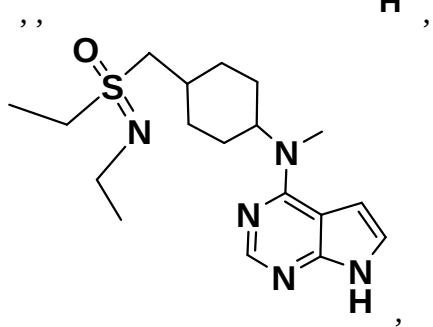
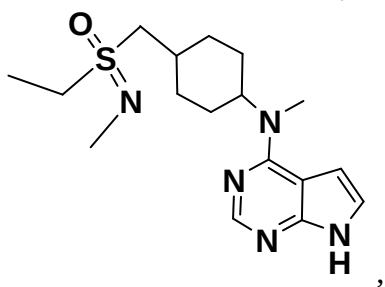
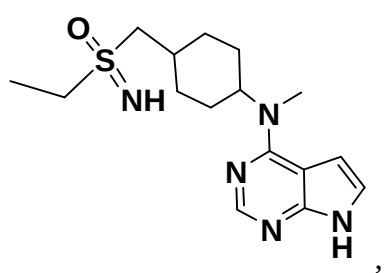
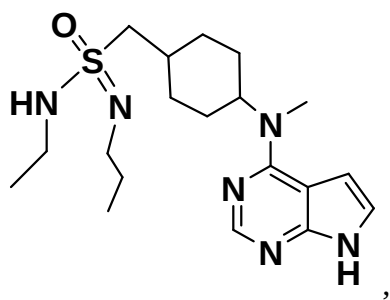
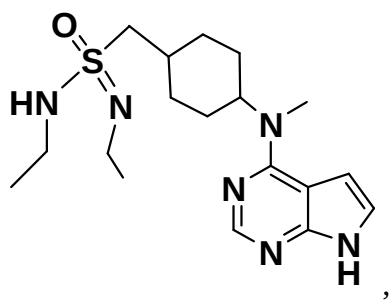
R₂ se selecciona de: -CH₃, , CF₃, O, O, .

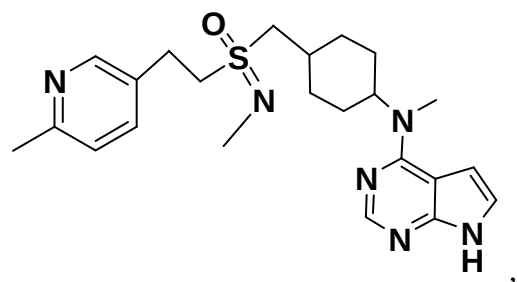
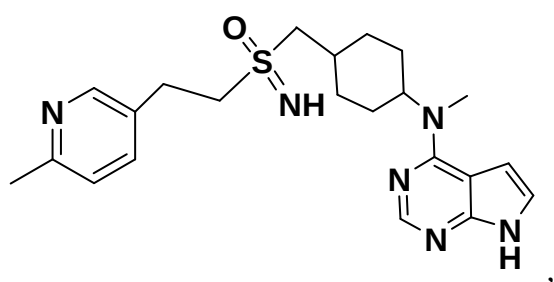
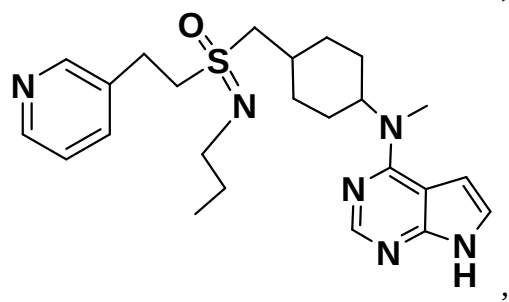
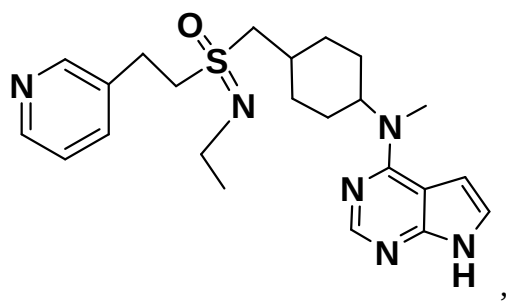
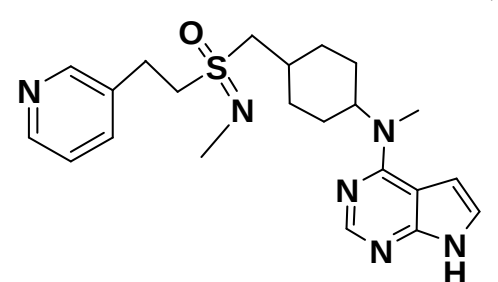
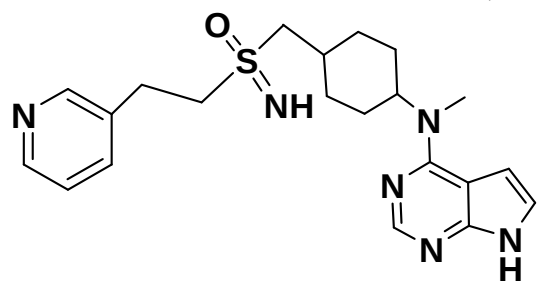
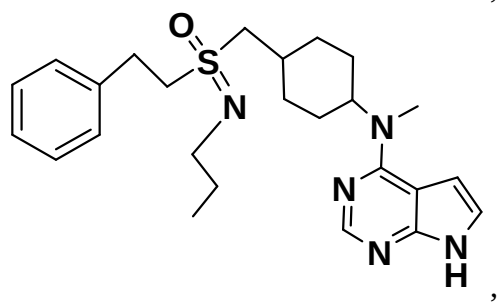
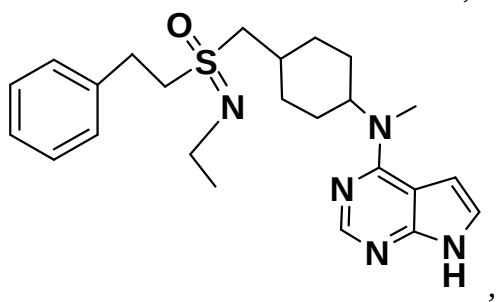
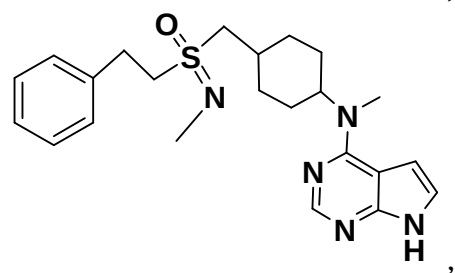
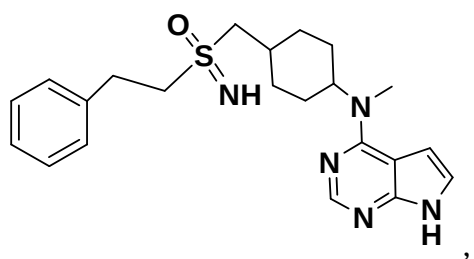
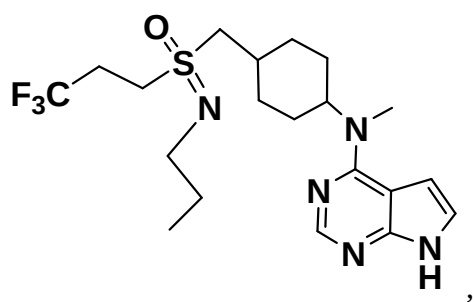
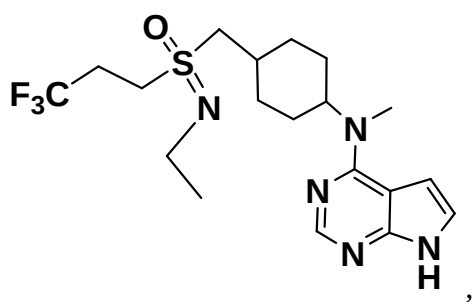


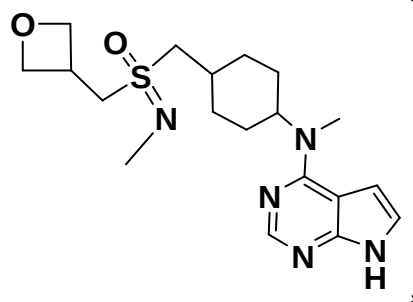
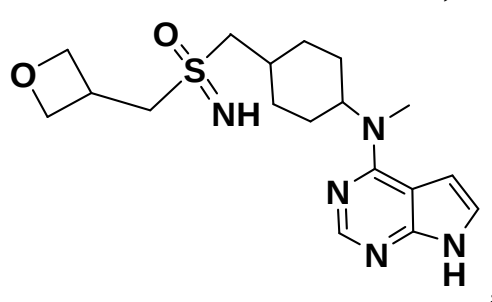
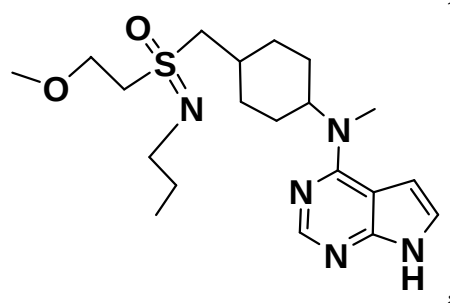
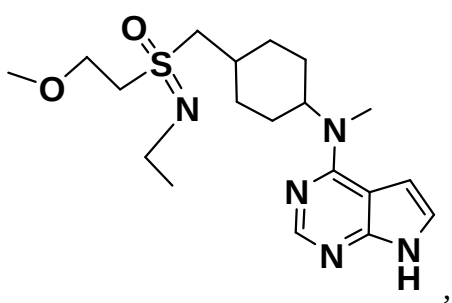
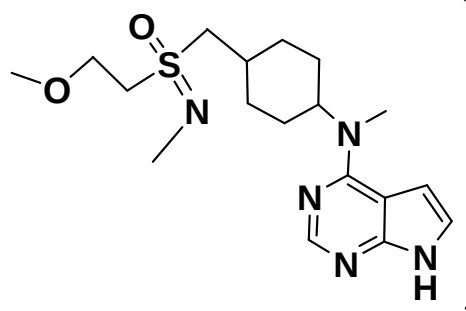
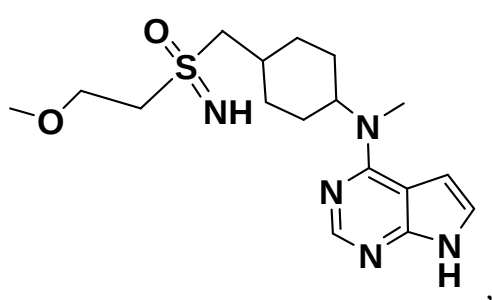
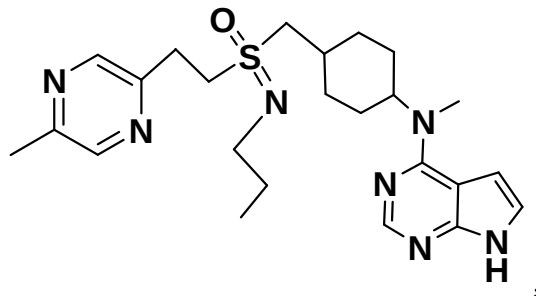
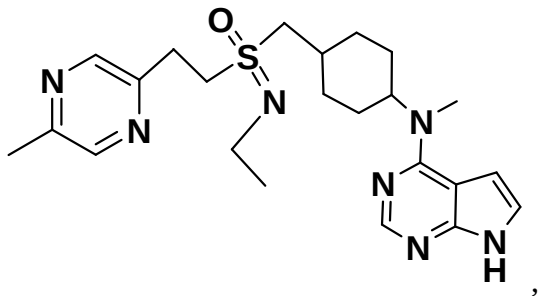
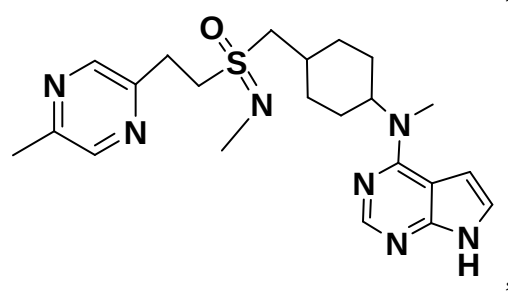
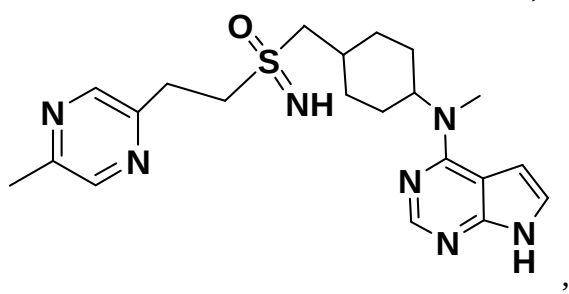
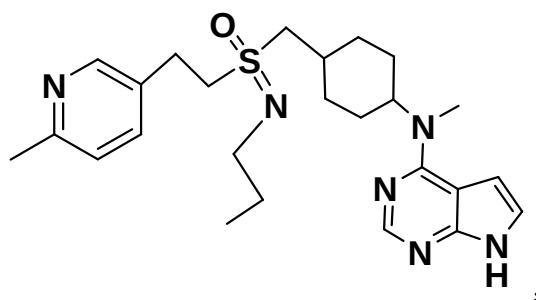
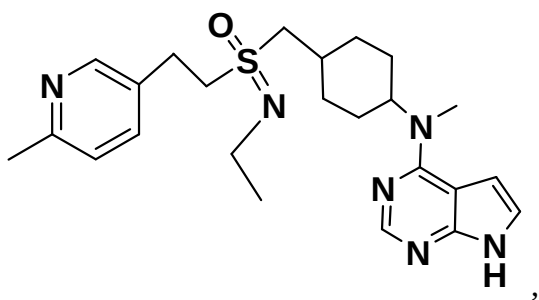
fórmula estructural específica:

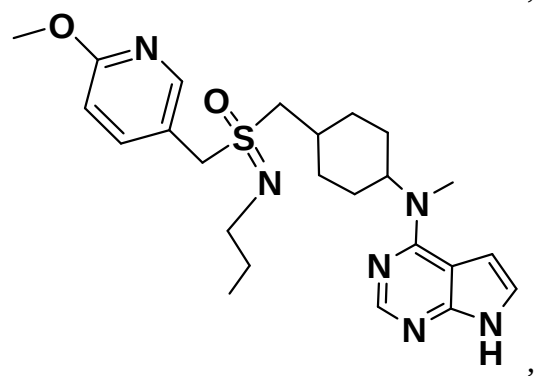
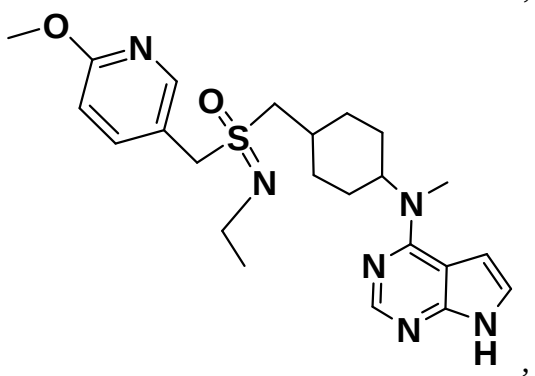
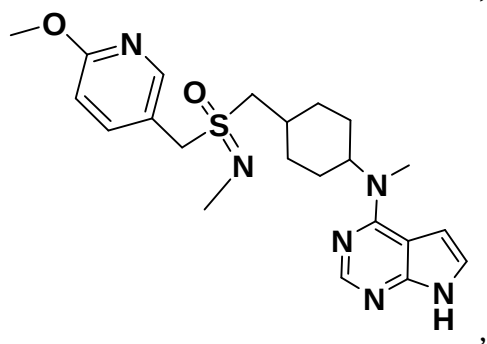
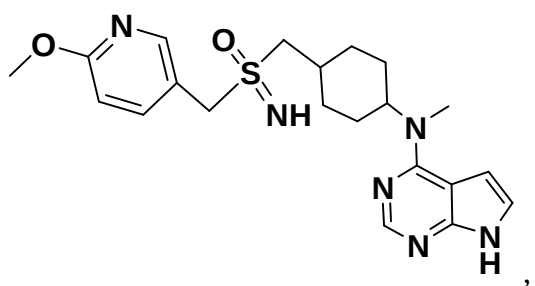
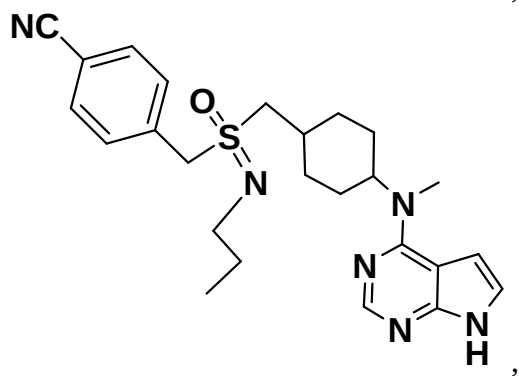
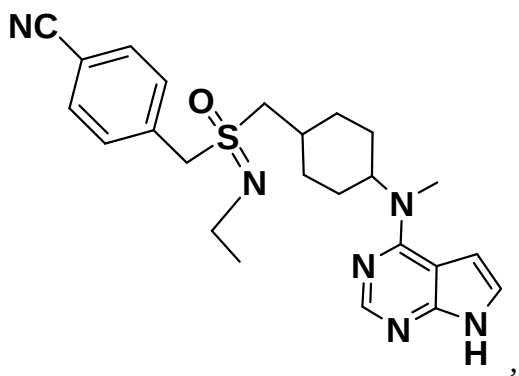
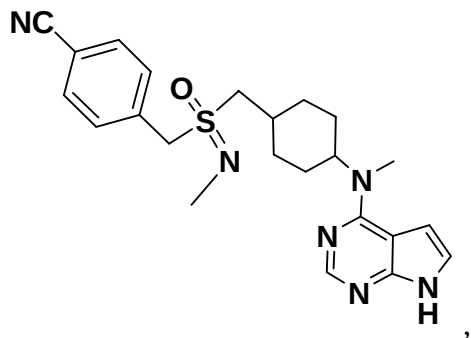
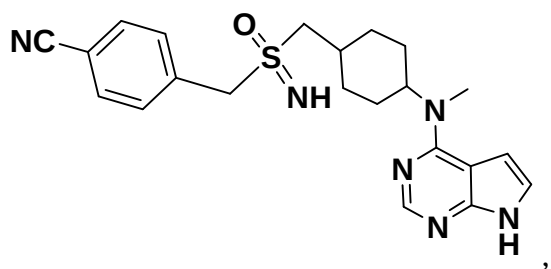
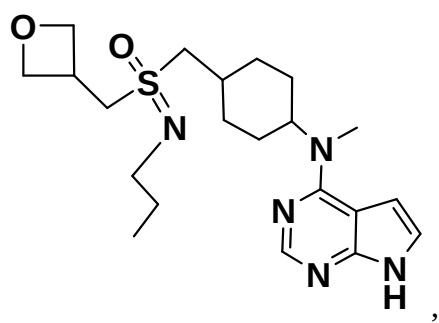
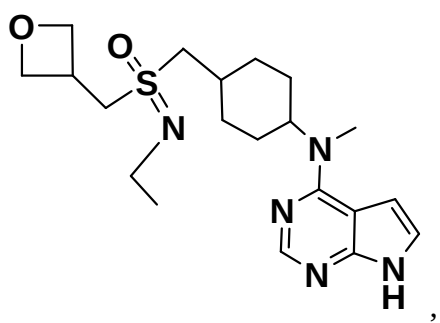


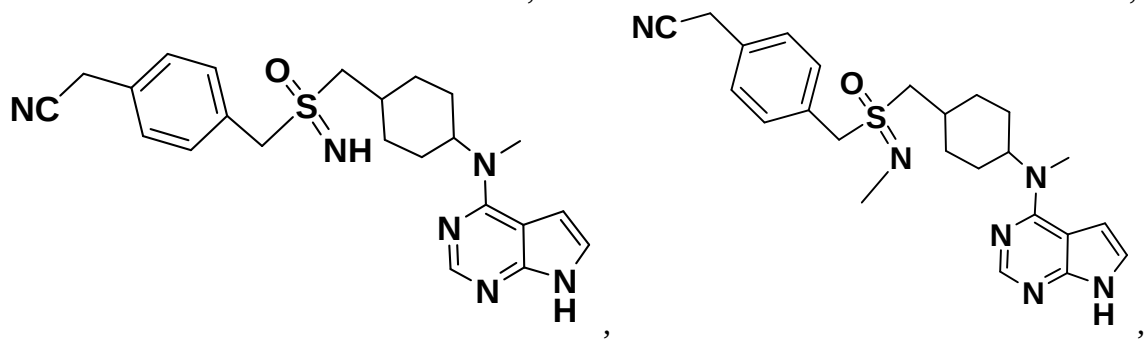
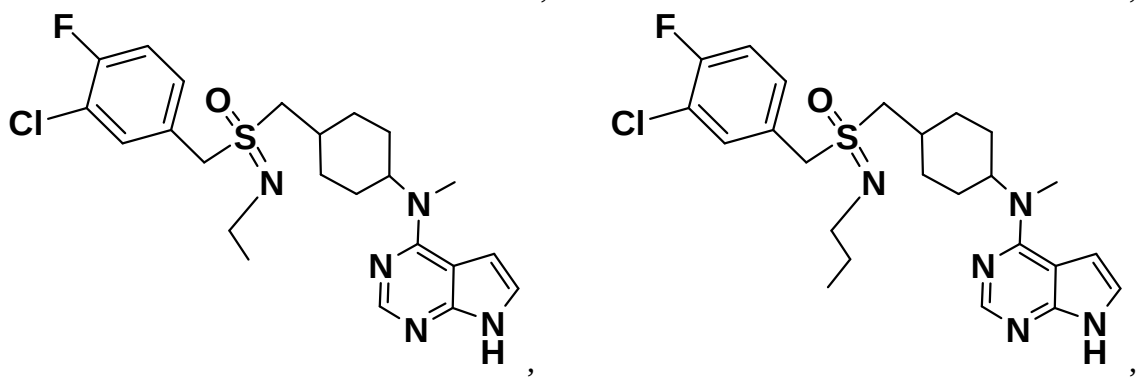
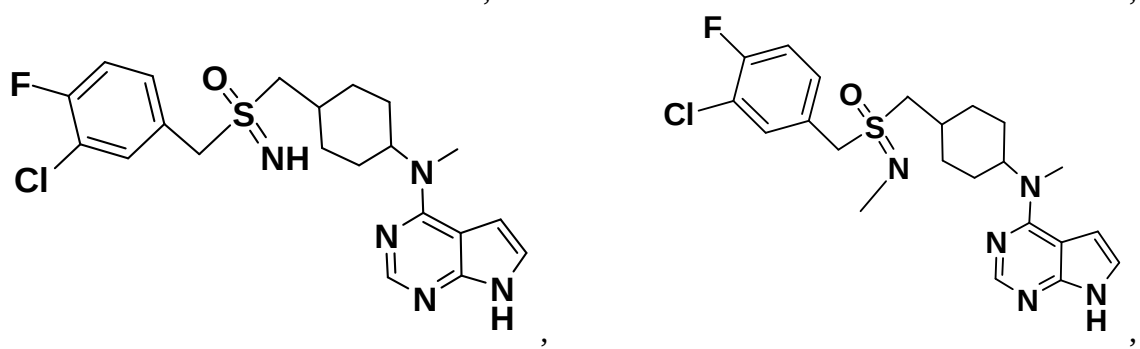
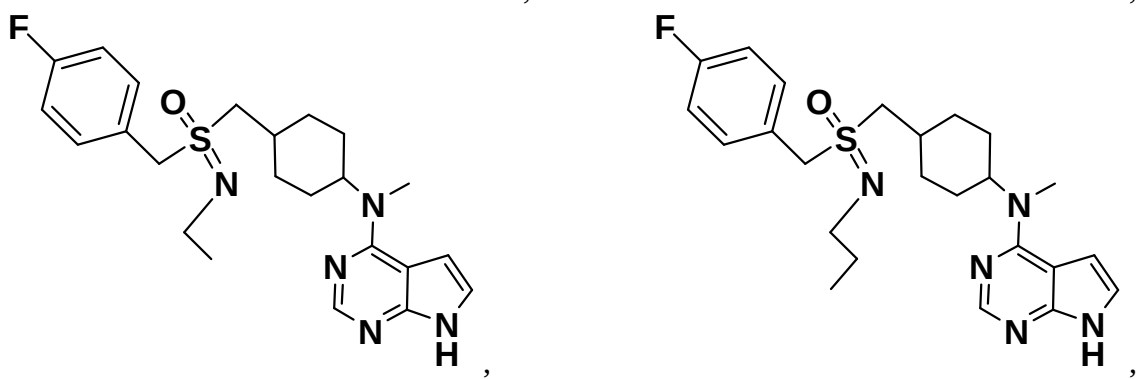
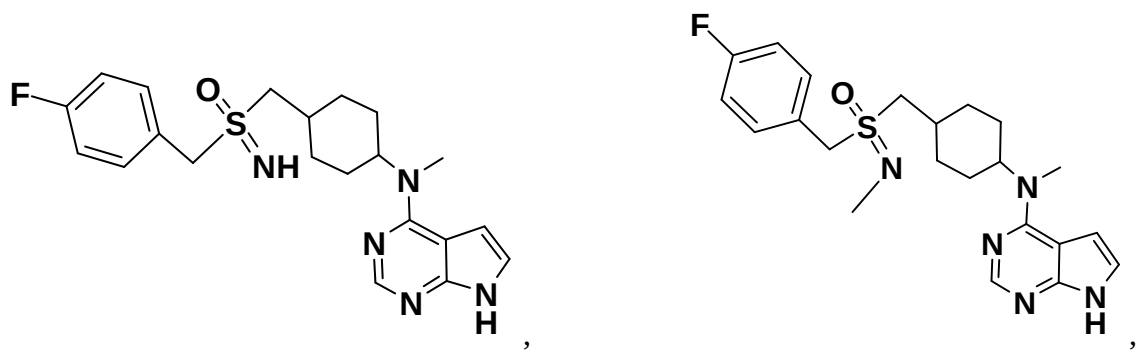


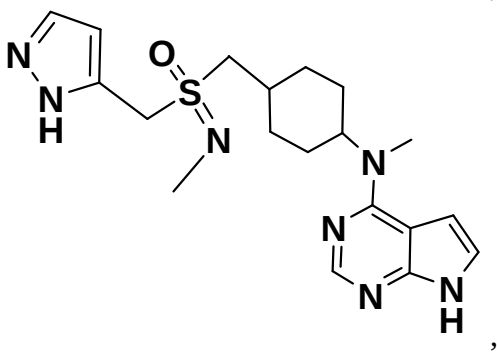
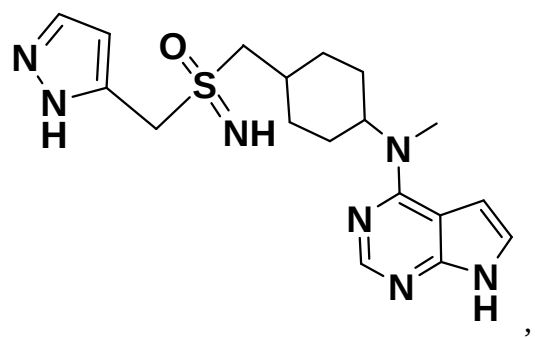
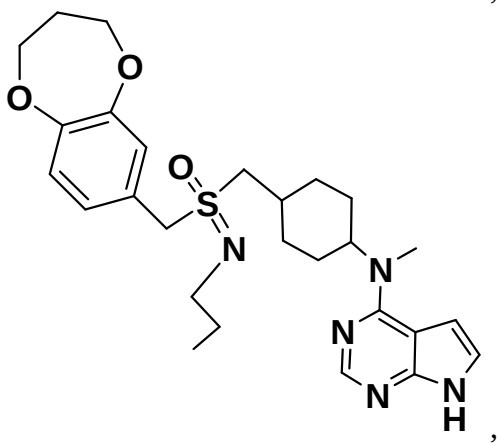
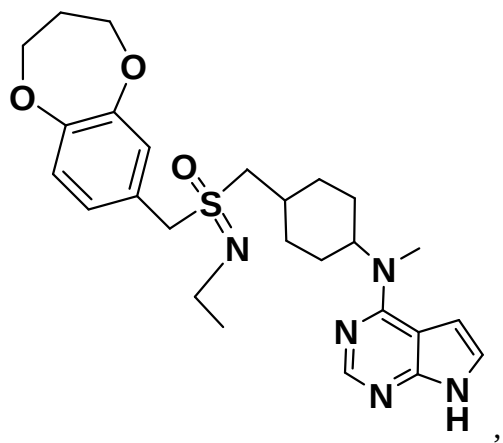
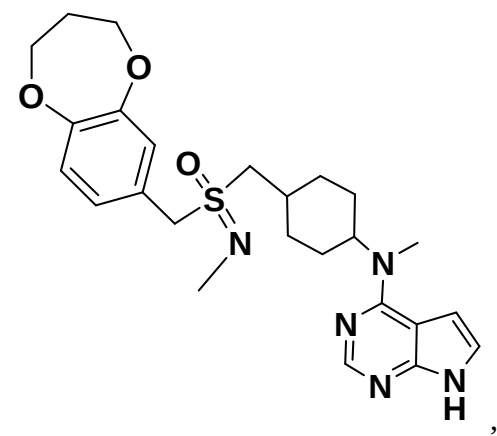
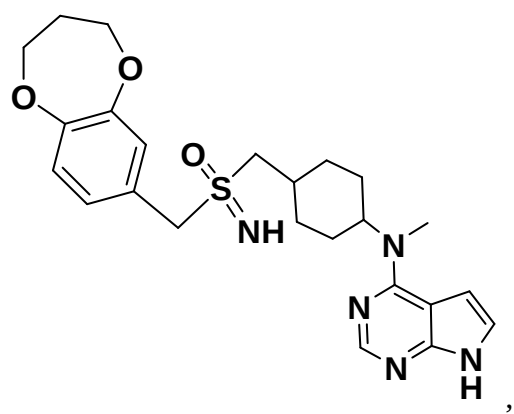
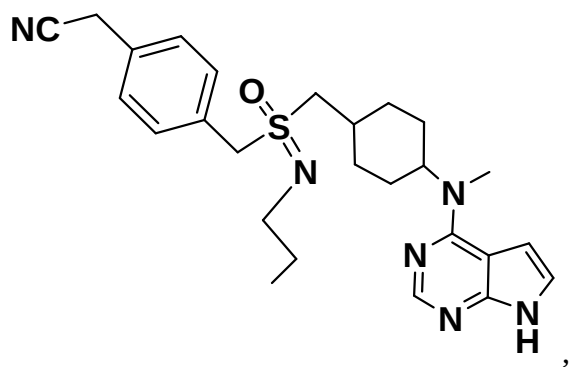
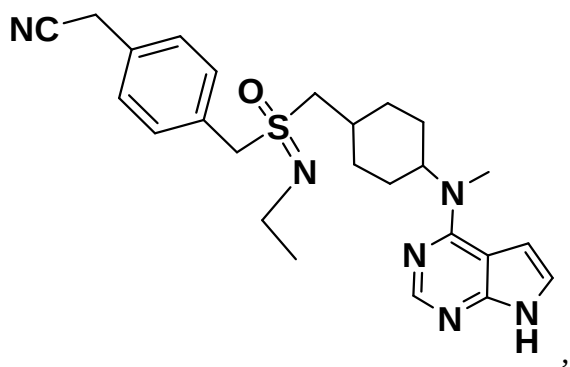


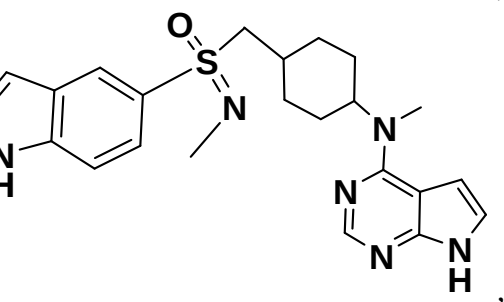
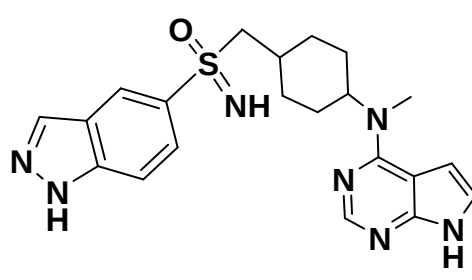
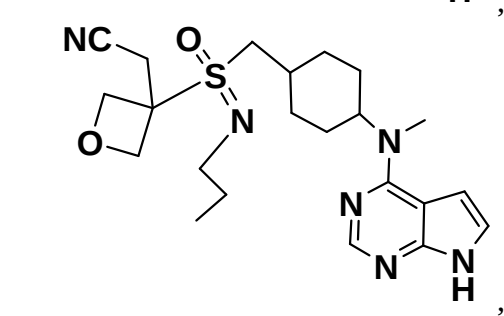
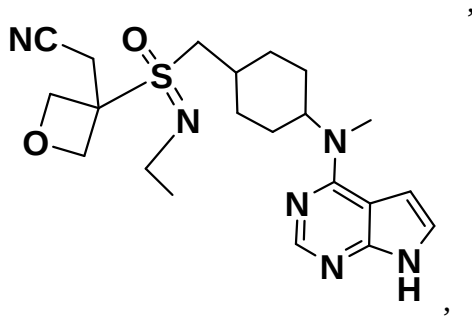
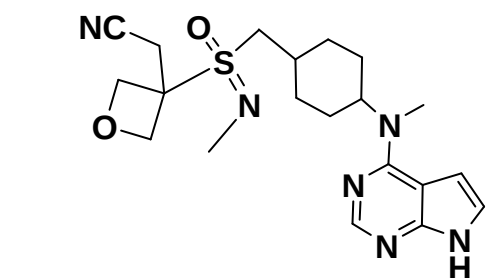
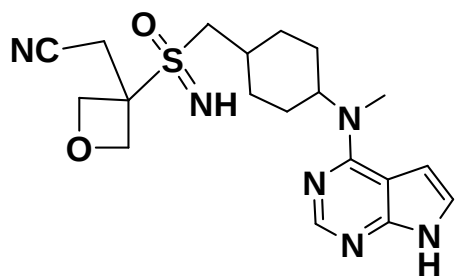
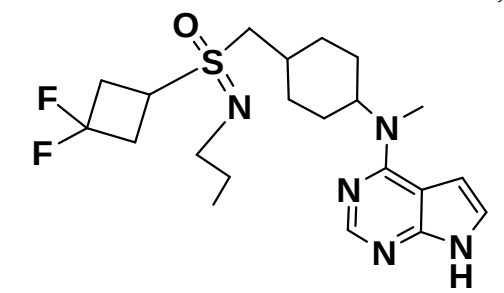
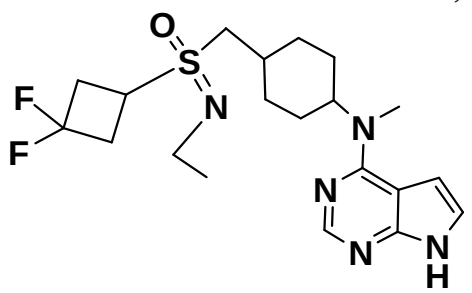
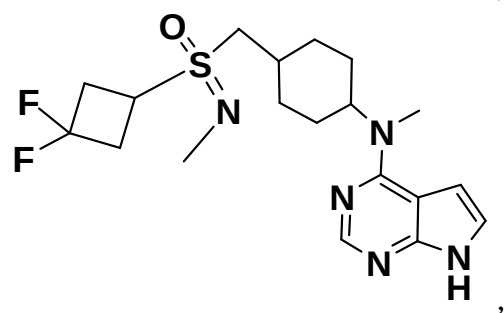
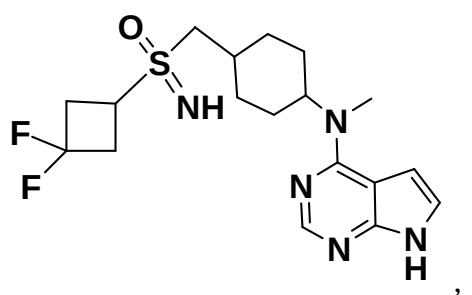
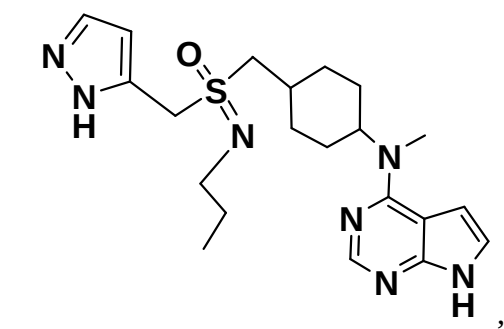
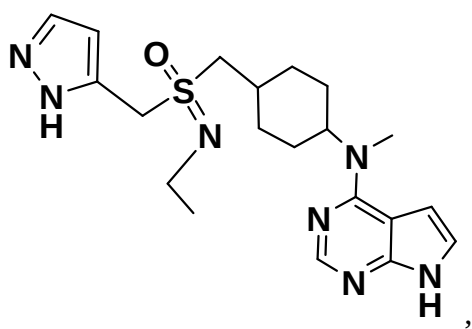


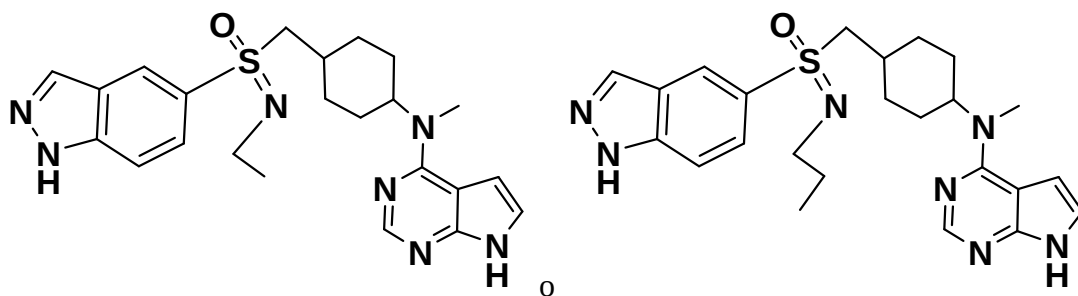




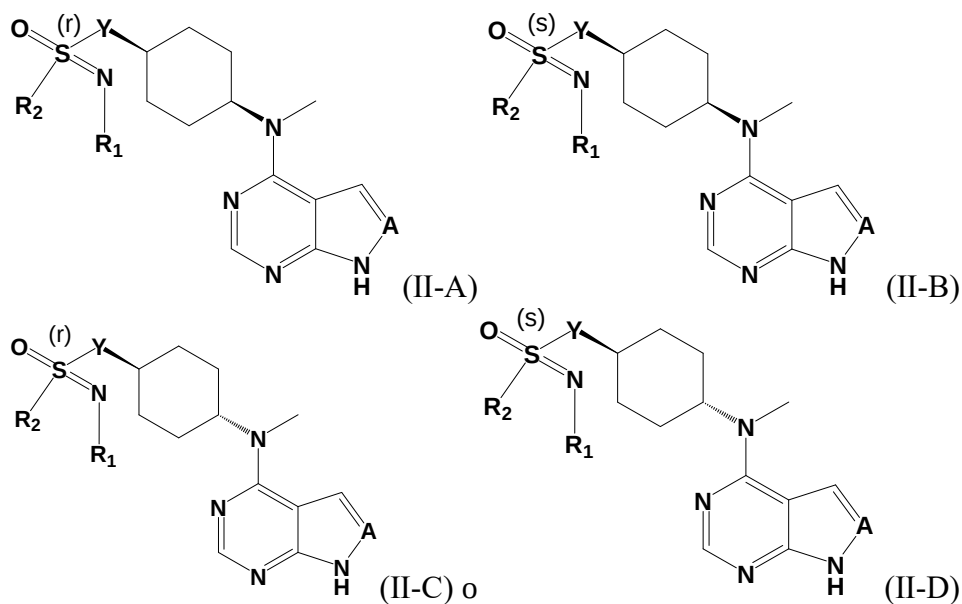




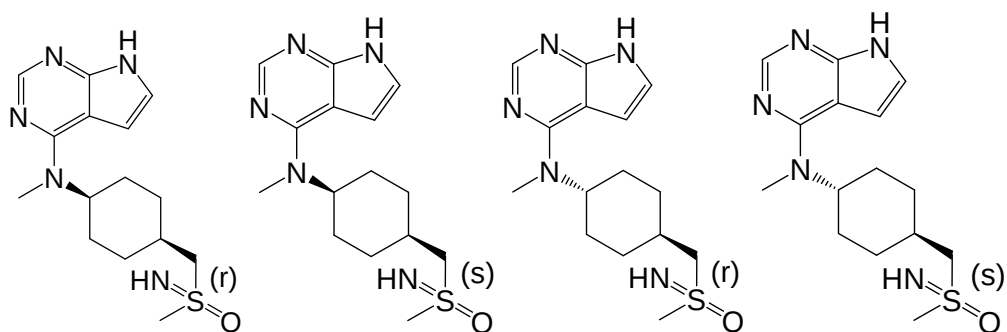


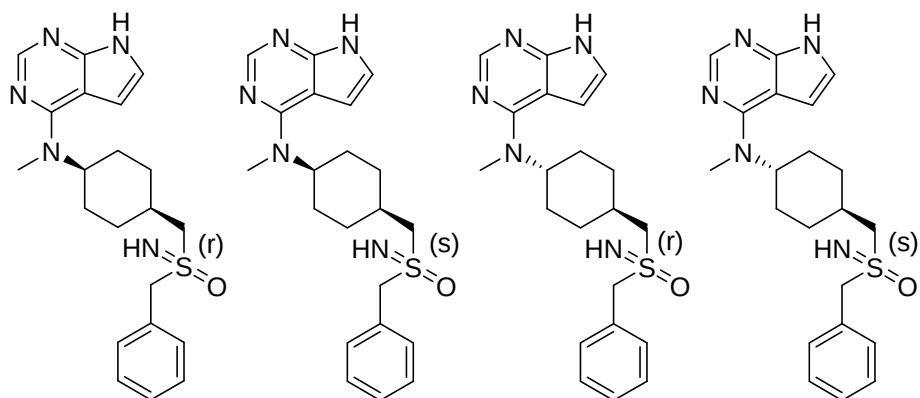
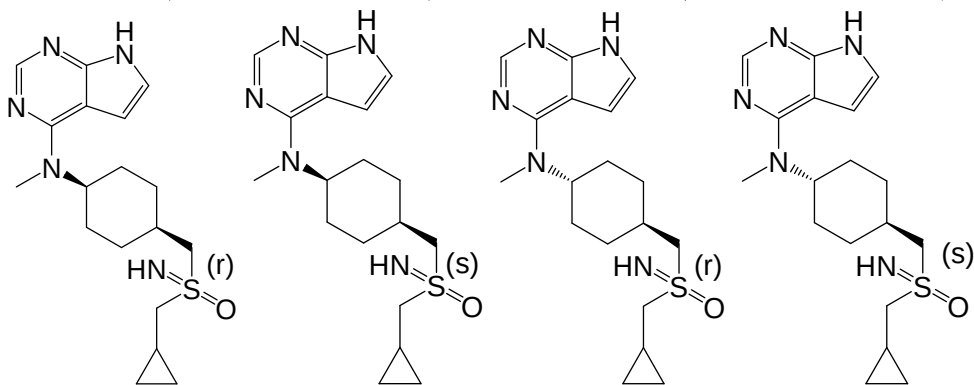
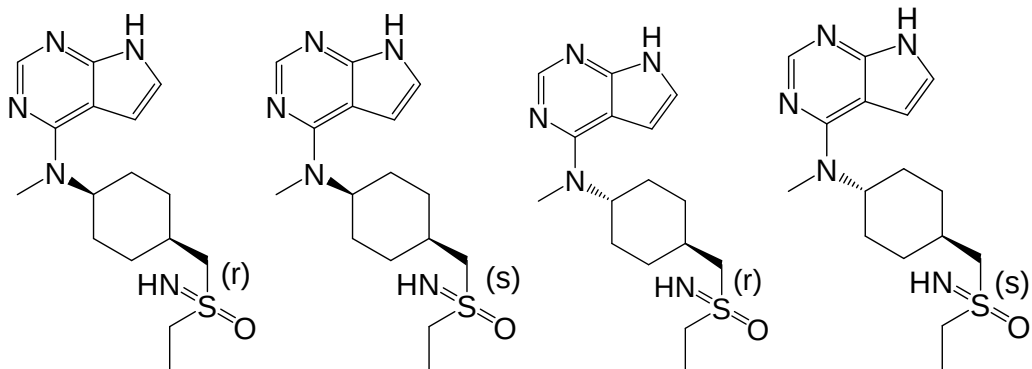
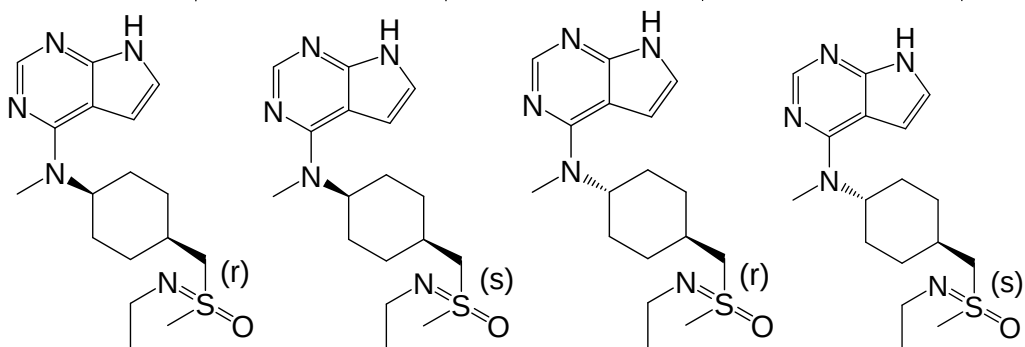
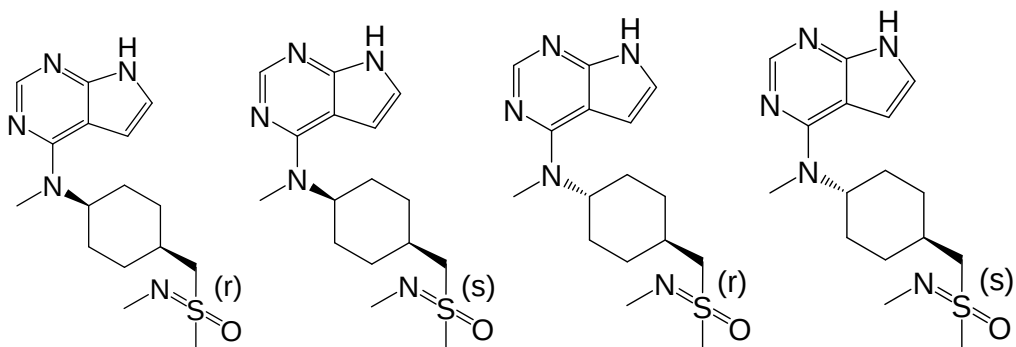


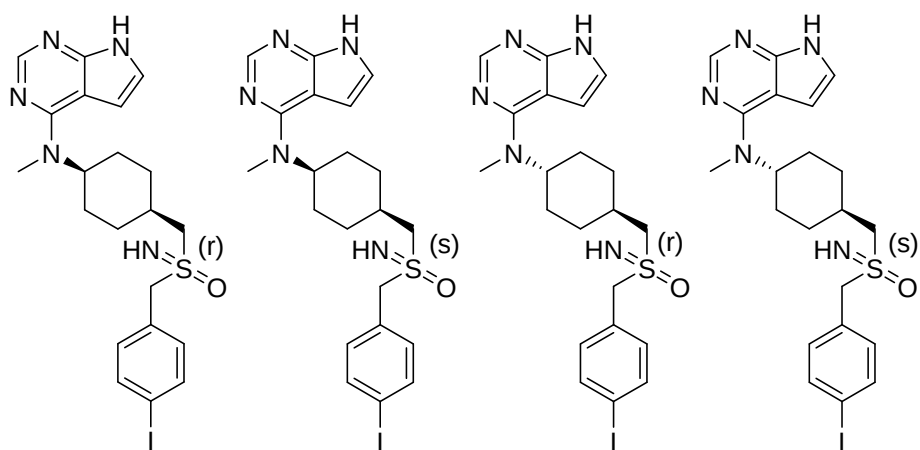
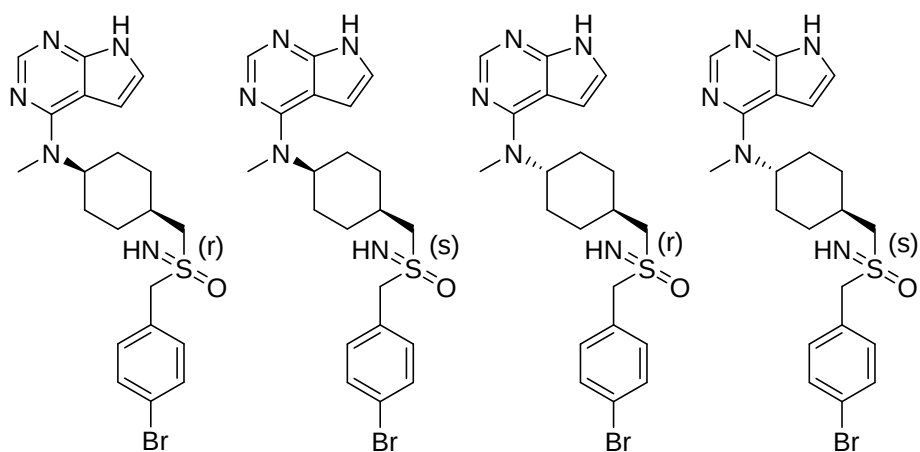
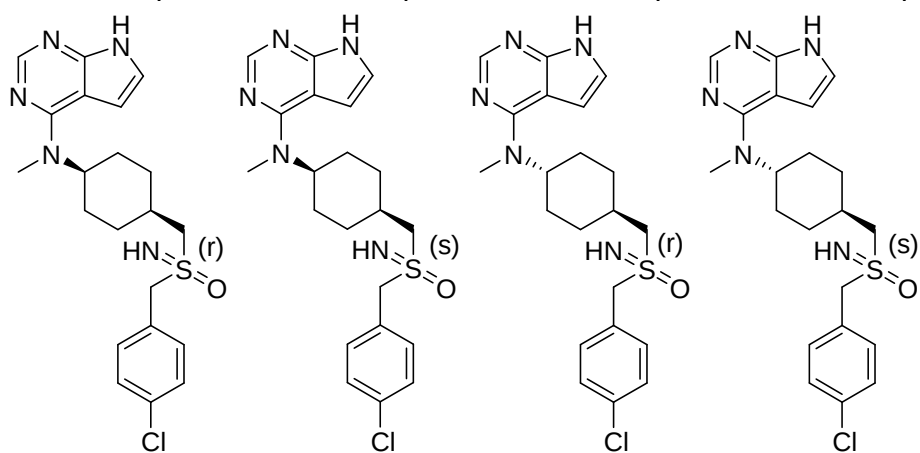
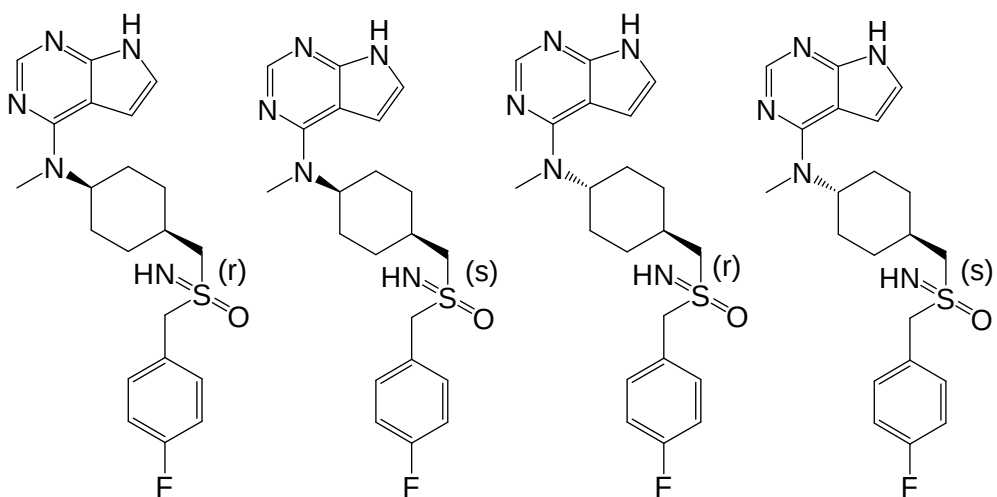
6. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable, estereoisómero, éster o metabolito del mismo según la reivindicación 1, caracterizado porque el estereoisómero tiene la siguiente estructura:

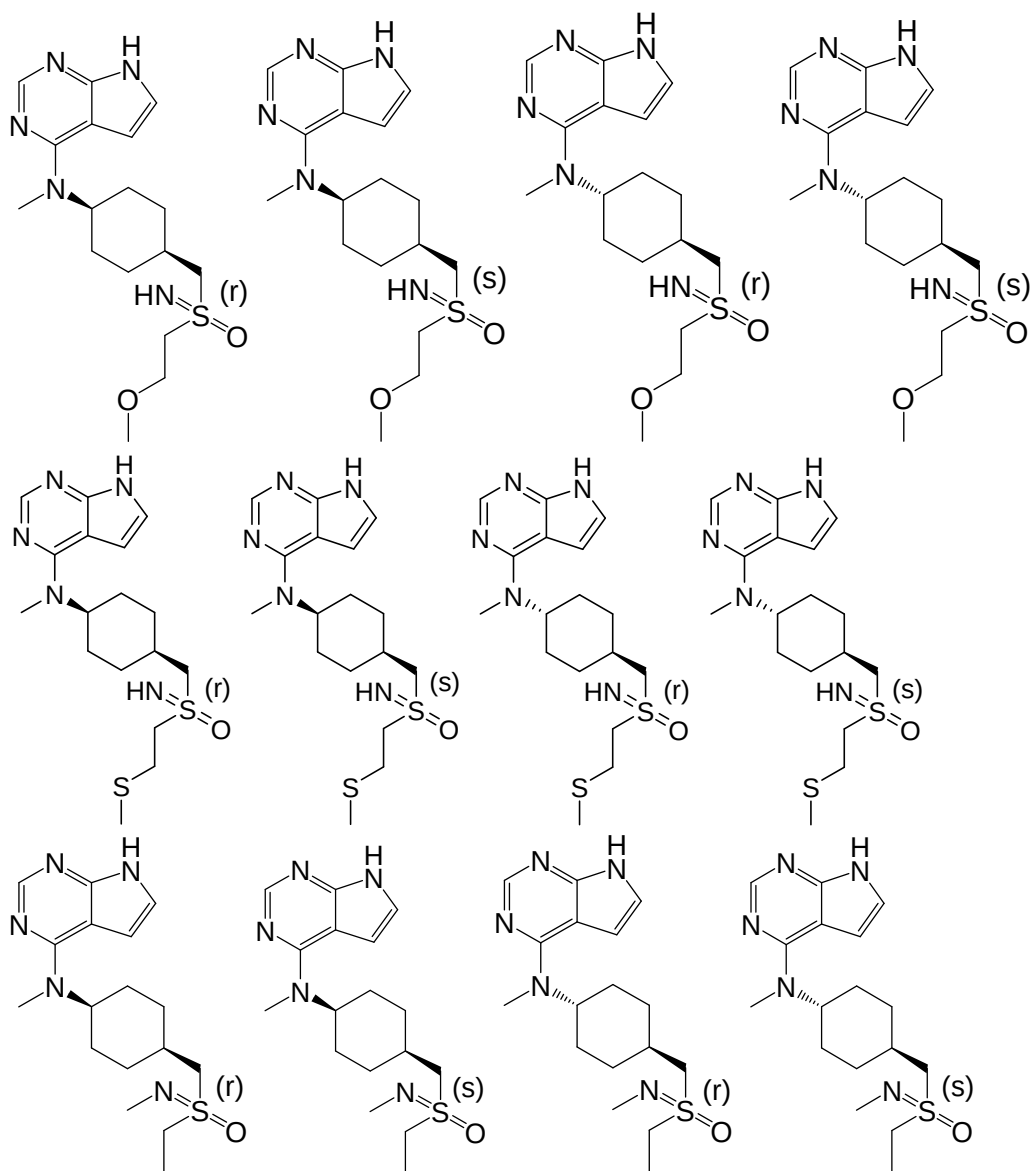


7. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable, estereoisómero, éster o metabolito del mismo según la reivindicación 6, caracterizado porque el estereoisómero tiene la siguiente estructura:

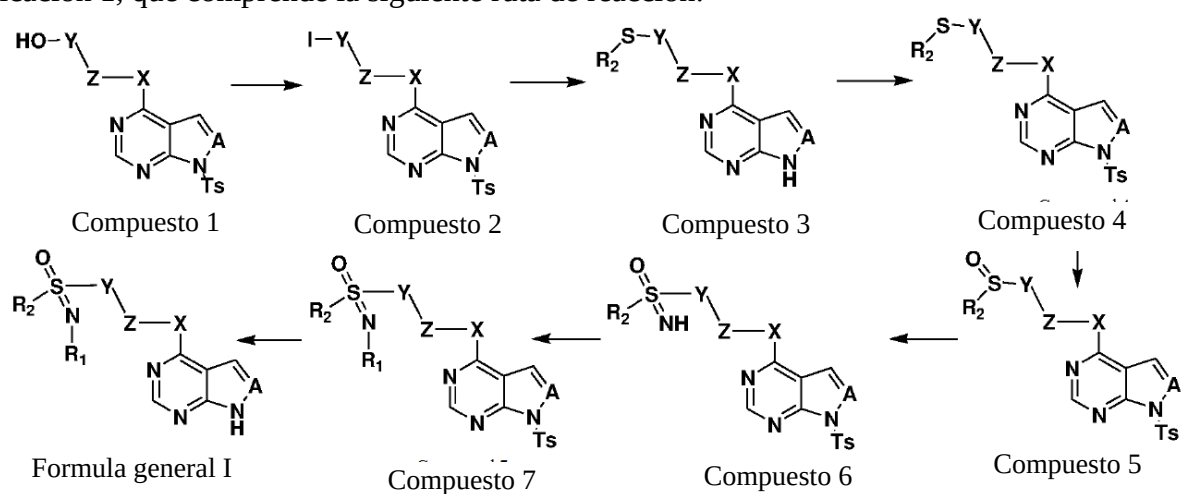








8. Un método para preparar el compuesto representado por la formula general I de la reivindicación 1, que comprende la siguiente ruta de reacción:



(1) disolver un compuesto 1 en un disolvente 1, añadir trietilamina y cloruro de

paratoluensulfonilo, agitando durante 20 -24 horas a temperatura ambiente, concentrar, añadir un agente yodante, calentar hasta 60 -70 °C y agitar durante 8 -9 horas para obtener un compuesto 2;

(2) disolver el compuesto 2 en un disolvente 2, añadir alquiltiolato sódico, llevar a cabo una reacción durante 20 -24 horas, filtrar y concentrar para obtener un compuesto 3;

(3) disolver el compuesto 3 en un disolvente 3, añadir trietilamina y cloruro de paratoluensulfonilo, agitando durante 20 -24 horas a temperatura ambiente, y separar para obtener un compuesto 4;

(4) disolver el compuesto 4 en un disolvente 4, añadir ácido metacloroperbenzoico (m-CPBA), llevar a cabo una reacción durante 1 -2 horas, extraer para recoger una fase orgánica, lavar y secar la fase orgánica, filtrar y concentrar para obtener un compuesto 5;

(5) disolver el compuesto 5 en un disolvente 5, añadiendo Diacetato de yodobenceno ($\text{PhI}(\text{OAc})_2$) y carbamato de amonio, llevando a cabo una reacción durante 30 -35 min, concentrando bajo presión reducida para obtener un compuesto 6;

(6) disolver el compuesto 6 y polialdehído en un disolvente 6, calentar hasta 90 - 95°C, llevar a cabo una reacción durante 20 -24 horas, concentrar, extraer para recoger una fase orgánica, lavar con agua y secar la fase orgánica, filtrar y concentrar para obtener un compuesto 7; y

(7) disolver el compuesto 7 y Carbonato de cesio (Cs_2CO_3) en un disolvente 7, llevar a cabo una reacción durante 3 -4 horas a 40 -50°C, filtrar y concentrar para obtener el compuesto representado por la fórmula general I;

en donde, los disolventes 1-7 se seleccionan de: uno o una combinación de dos o más diclorometano, acetona, tetrahidrofurano, alcohol metílico y ácido fórmico.

9. Una composición farmacéutica, en donde la composición farmacéutica comprende el compuesto representado por la fórmula general I o la sal farmacéuticamente aceptable, estereoisómero, éster o metabolito del mismo de la reivindicación 1, y además comprende un adyuvante farmacéuticamente aceptable.

