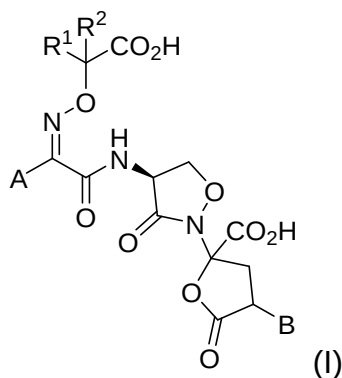
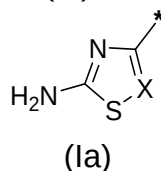


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



donde A está definido por la fórmula (Ia)



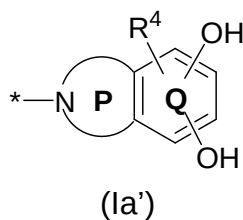
y en donde X es N o CR³ y R³ representa hidrógeno o halógeno;

R¹ y R², junto con el átomo de carbono al que están unidos, puede formar un cicloalquilo (C₃-C₈), en donde

- (i) el cicloalquilo puede contener un heteroátomo seleccionado entre O, N y S, y/o
- (ii) el cicloalquilo puede estar sustituido con uno, dos, tres o cuatro sustituyentes seleccionados independientemente entre sí del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₃) y halógeno; o

R¹ y R² pueden, independientemente entre sí, representar hidrógeno o alquilo (C₁-C₃), en donde alquilo (C₁-C₃) puede estar sustituido con un sustituyente seleccionado entre hidroxilo y cloro;

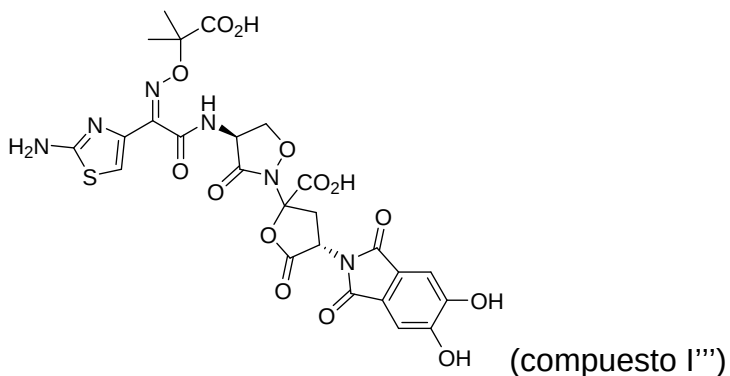
B es un catecol bicíclico o fragmento de hidroxipiridona que lleva un fragmento definido por la fórmula (Ia')



en donde P es un anillo insaturado de 5 miembros o 6 miembros, que opcionalmente puede contener un grupo carbonilo (CO) o dos grupos carbonilo (CO) o un grupo sulfona (SO₂) o una combinación de un grupo carbonilo (CO) y una sulfona (SO₂) y puede contener además hasta dos átomos de N adicionales;

y

en donde Q puede contener hasta dos átomos de N y en donde R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo (C₁-C₃), carbonilo, trifluorometilo, ciano y un halógeno; y sales del mismo, solvatos del mismo y solvatos de las sales del mismo y en donde el compuesto I'''

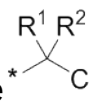


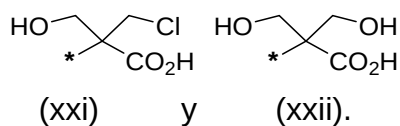
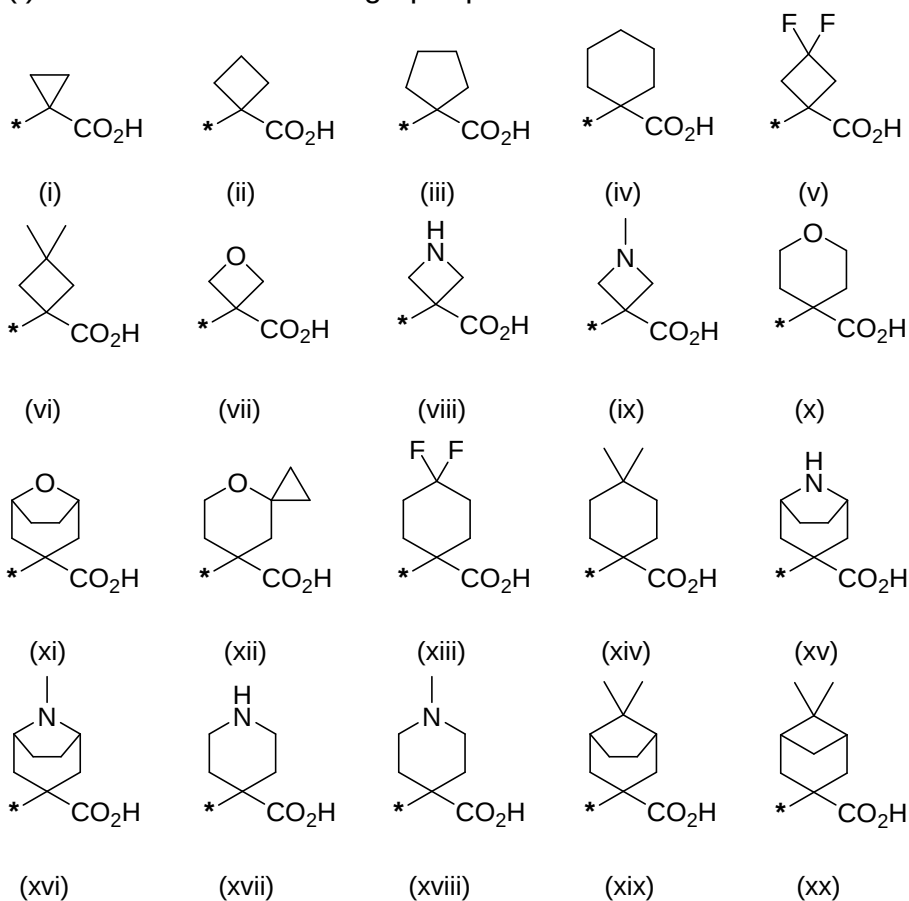
está excluido de la fórmula (I)

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el halógeno de R³ es flúor o cloro.
3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el halógeno del cicloalquilo (ii) es flúor o cloro.
4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el halógeno de R⁴ es flúor o cloro.

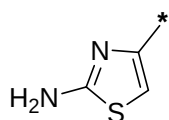
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde P es un anillo insaturado de 5 miembros.

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Q es benceno o piridina.

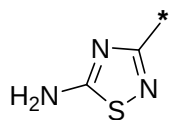
7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde  de fórmula (I) se selecciona entre el grupo que consiste en:



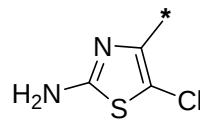
8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 7, en donde A de fórmula (I) se selecciona entre el grupo que consiste en:



(a)



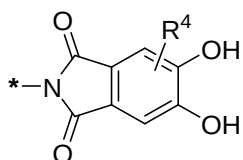
(b)



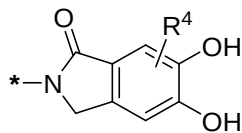
(c).

y

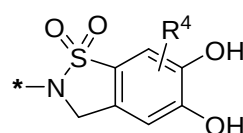
9. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 7 u 8, en donde B de fórmula (I) se selecciona entre el grupo que consiste en:



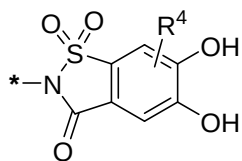
(d)



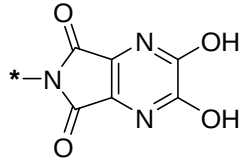
(e)



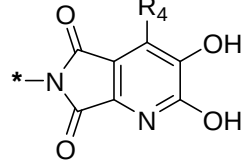
(f)



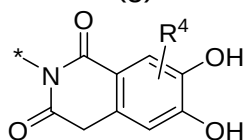
(g)



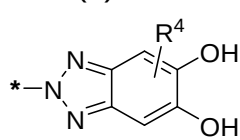
(h)



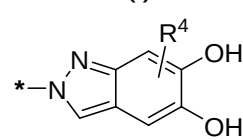
(i)



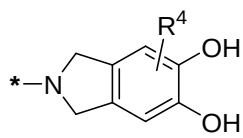
(j)



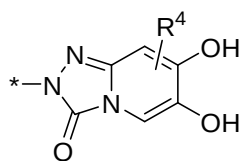
(k)



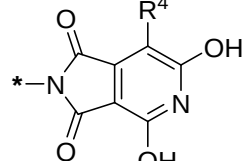
(l)



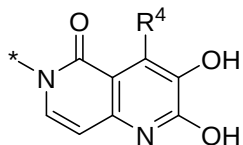
(m)



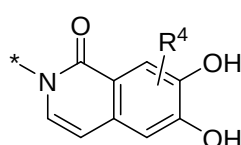
(n)



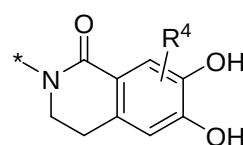
(o)



(p)



(q)

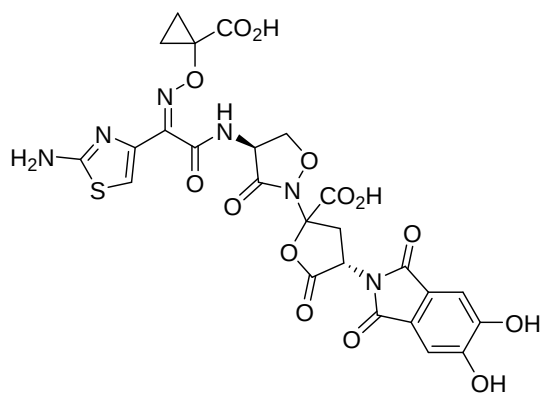
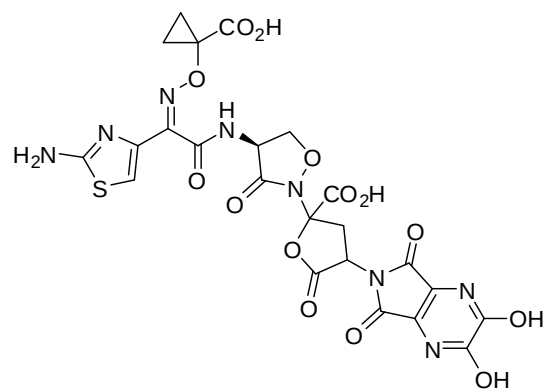
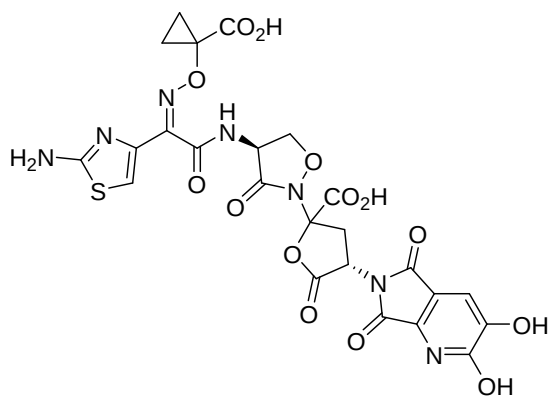
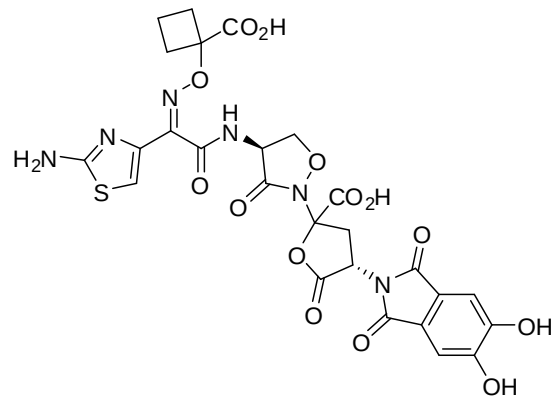
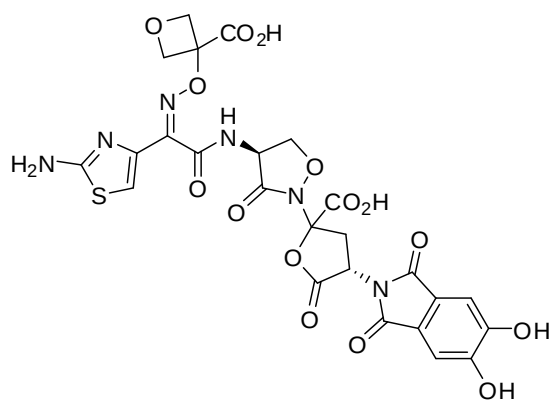
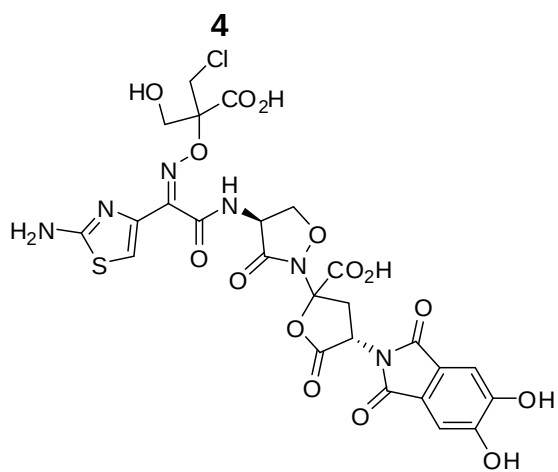


(r).

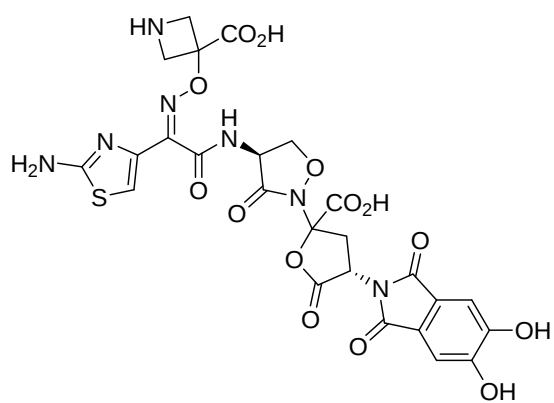
y

en donde R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo (C₁-C₃), trifluorometilo, ciano y halógeno.

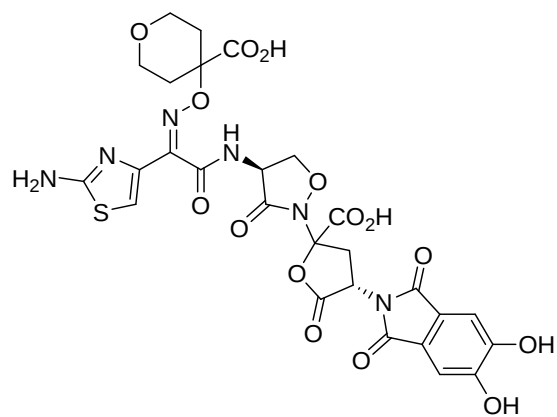
10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto de fórmula (I) es:

**1****2****3****4****5****6**

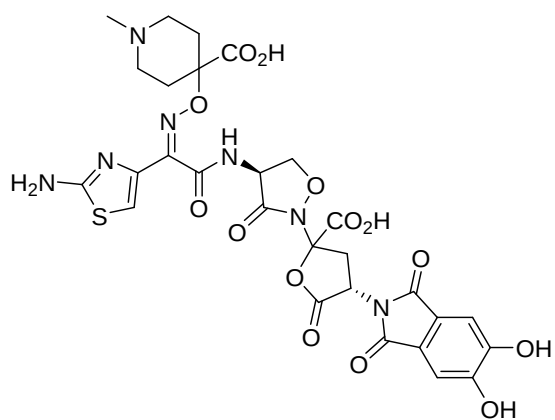
6



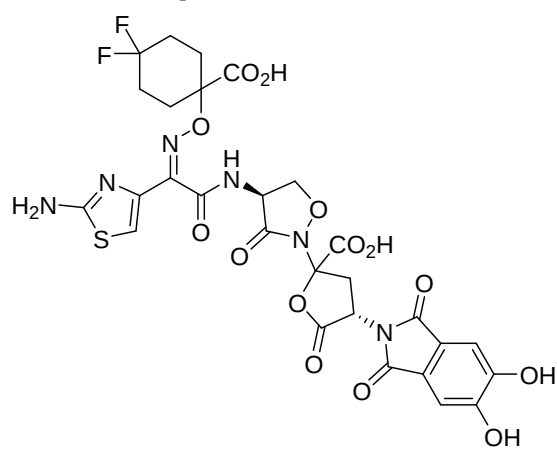
7



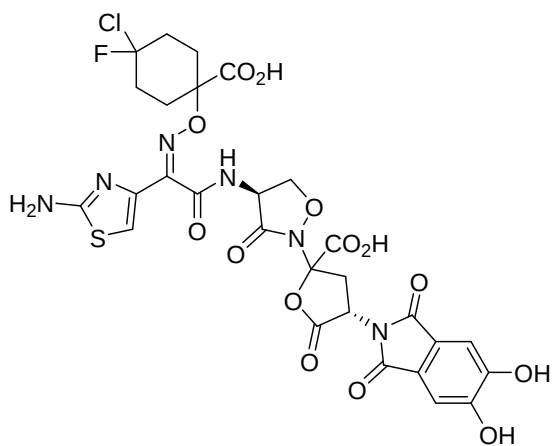
8



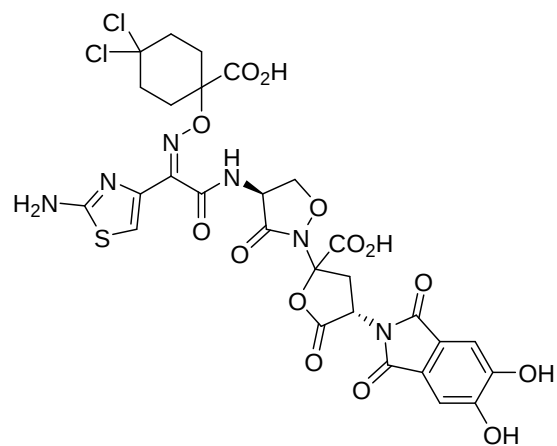
9



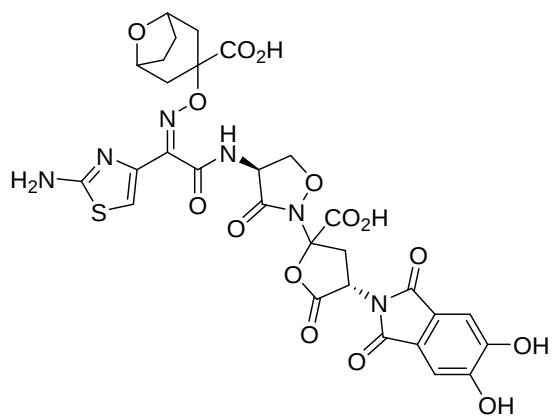
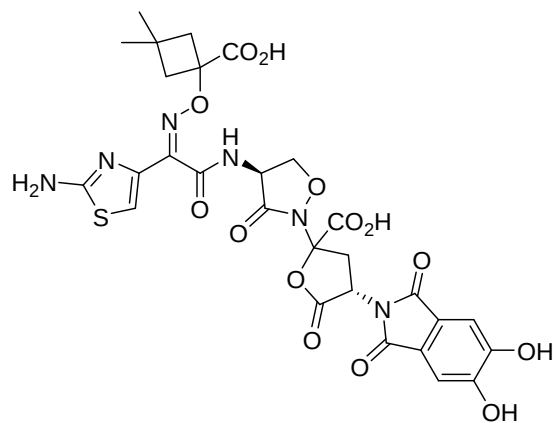
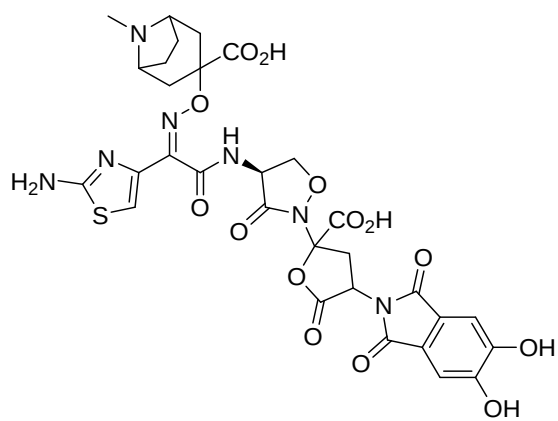
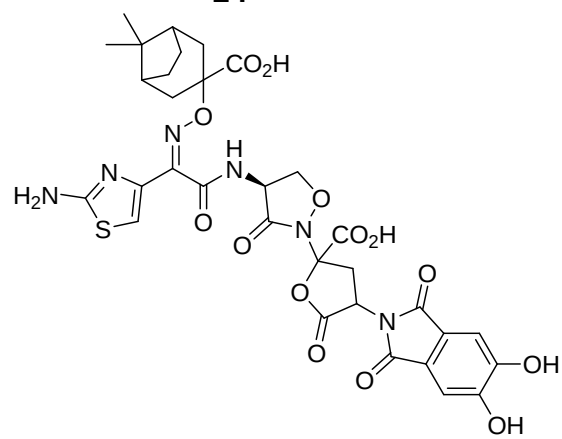
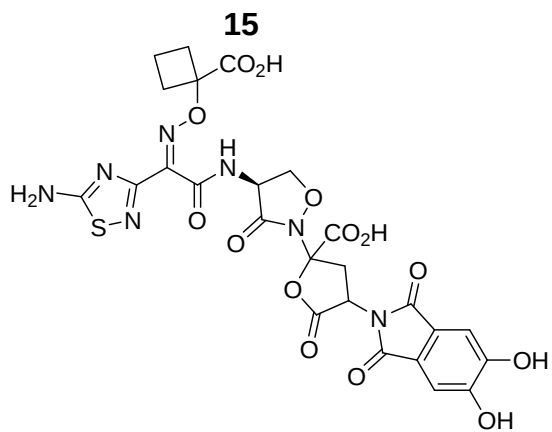
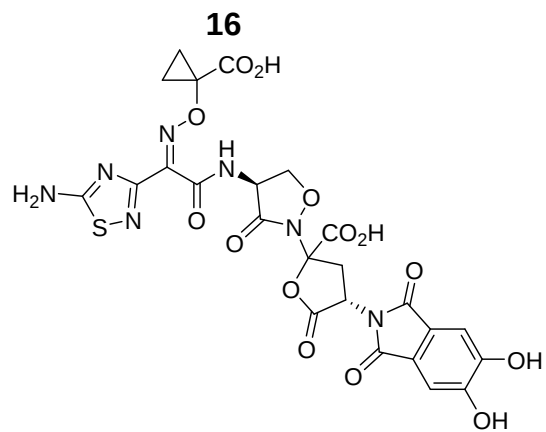
10

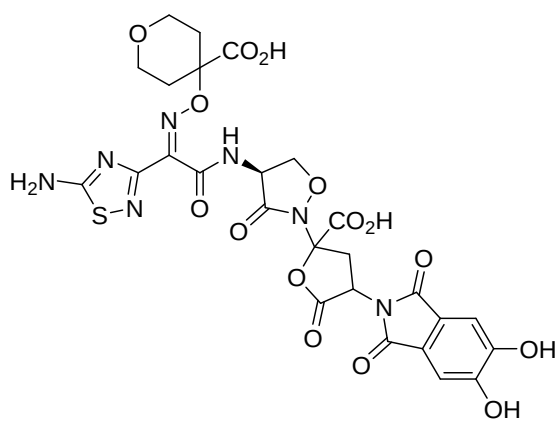
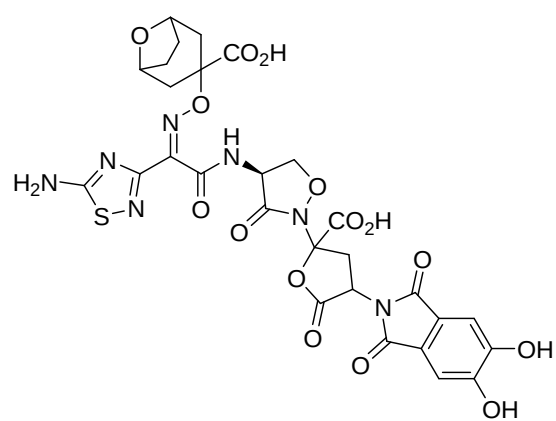
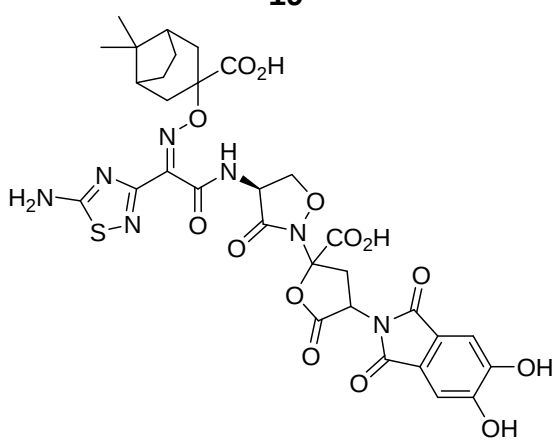
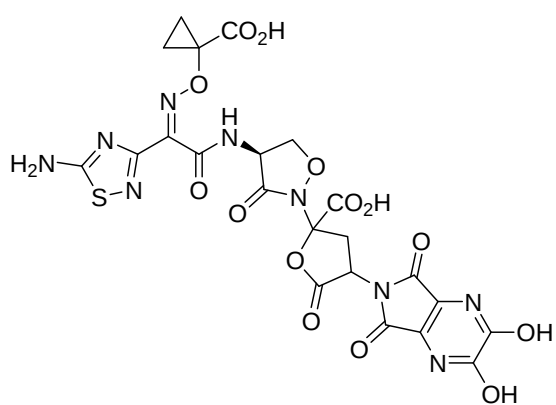
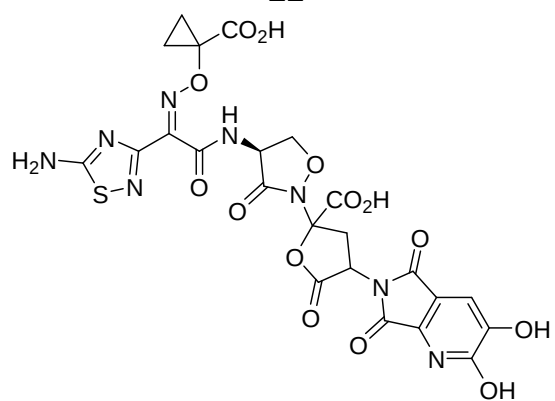
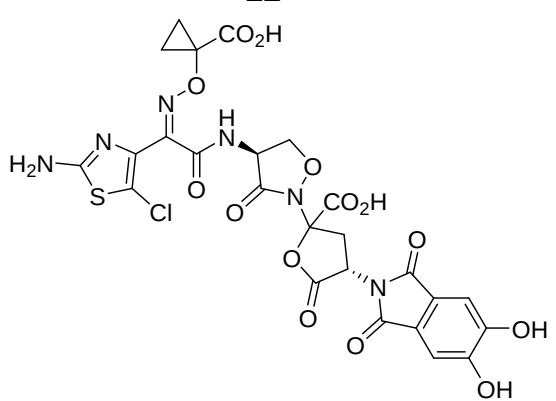


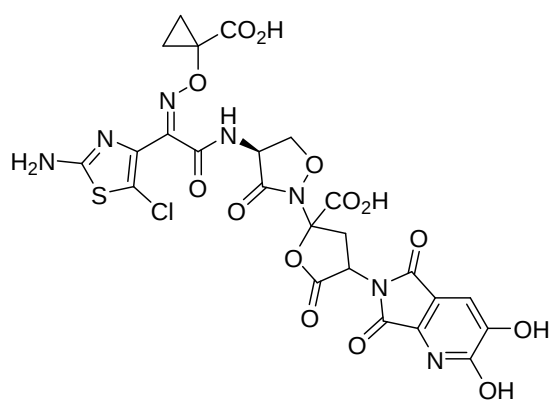
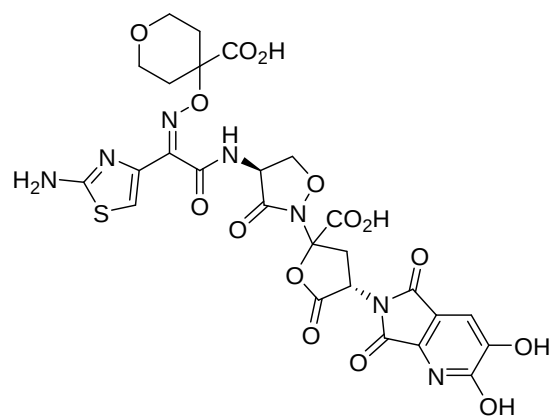
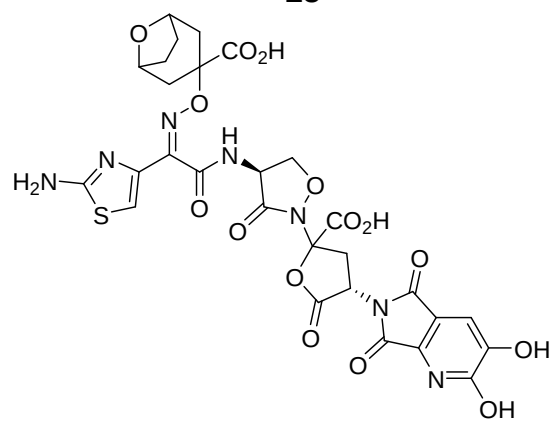
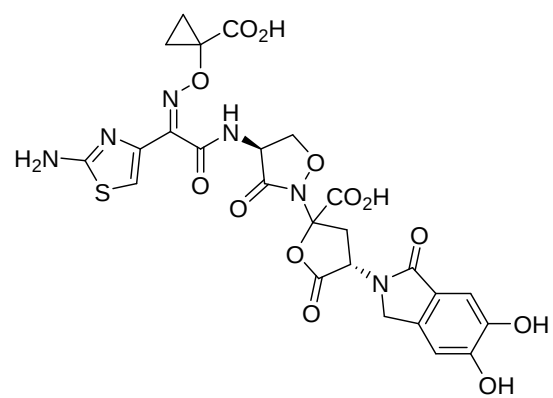
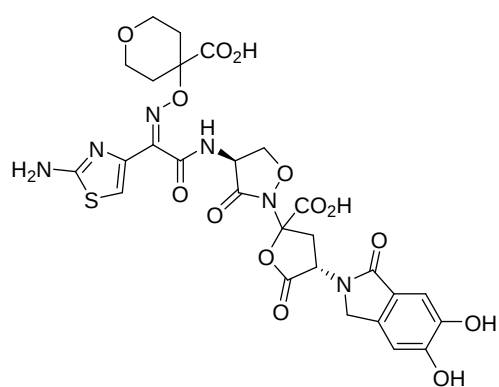
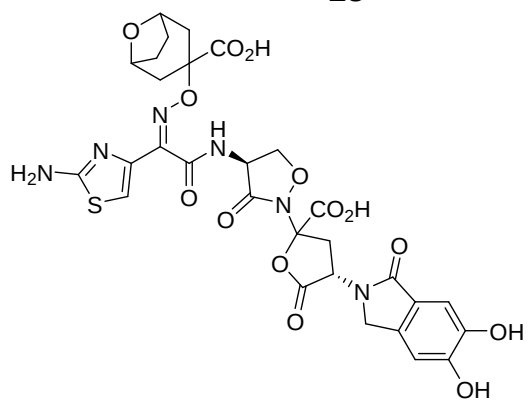
11

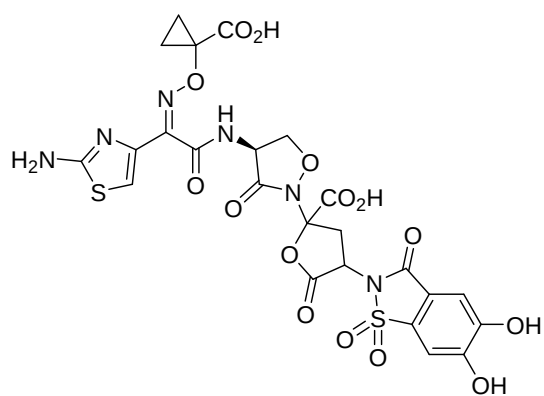
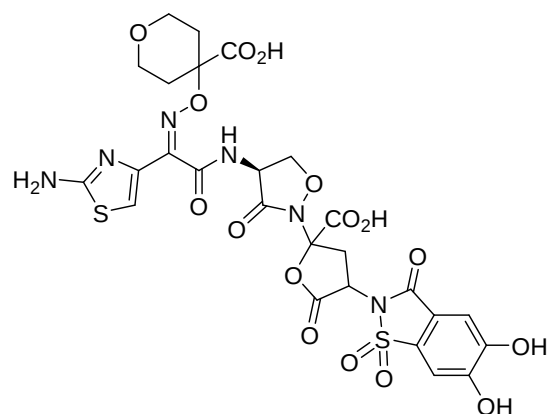
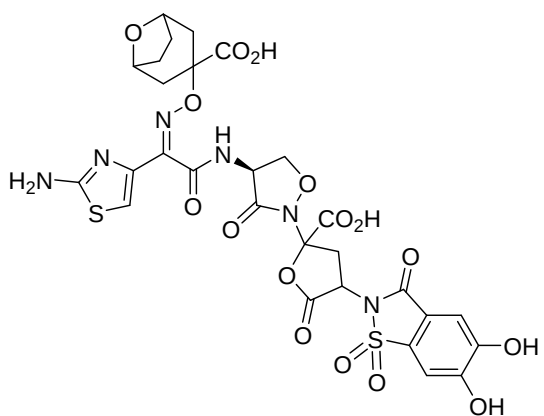
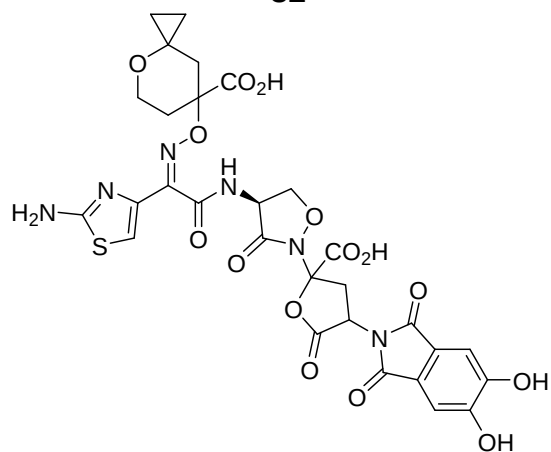
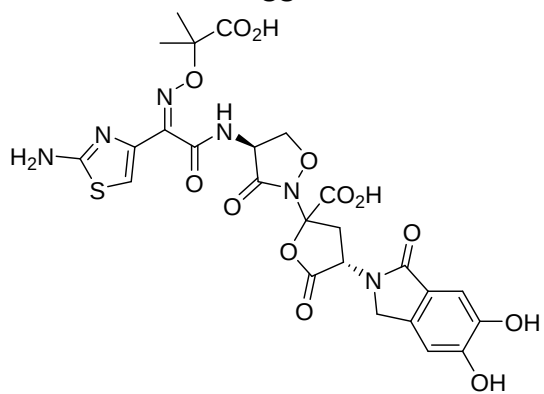
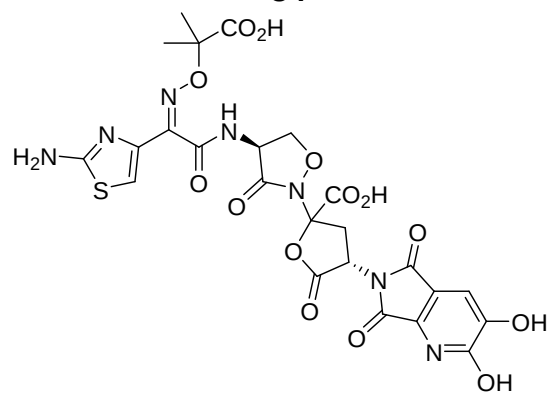


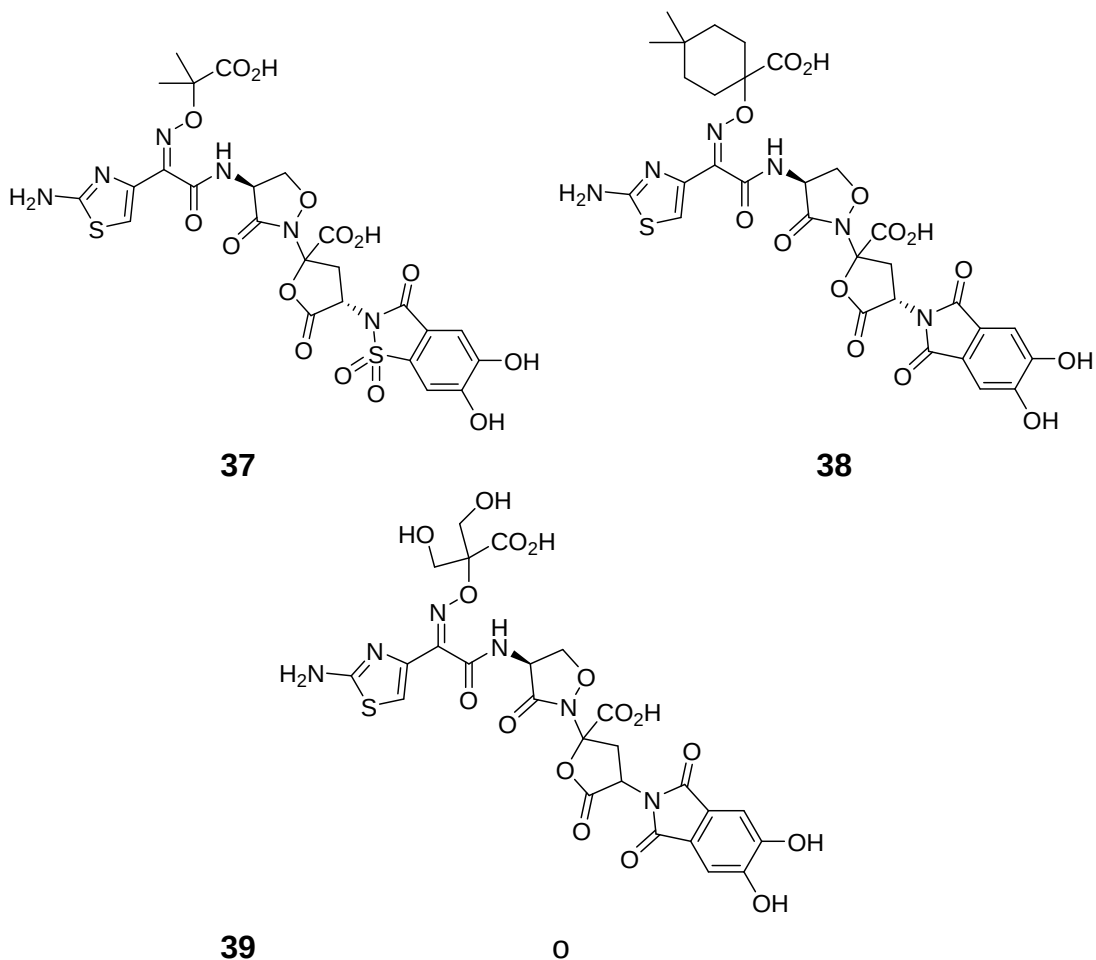
12

**13****14****15****16****17****18**

**19****20****21****22****23****24**

**25****26****27****28****29****30**

**31****32****33****34****35****36**



11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto de fórmula (I) es:

ácido (4S)-2-[(4S)-4-[[[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[[[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino]acetil]amino]-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxoxolan-2-carboxílico

ácido 2-[(4S)-4-[[[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[[[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino]acetil]amino]-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol-3,4-b]pirazin-6-il)-5-oxoxolan-2-carboxílico

ácido (4S)-2-((S)-4-((Z)-2-(2-aminotiazol-4-il)-2-((1-carboxiciclopropoxi)imino)acetamido)-3-oxoisoxazolidin-2-il)-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol-3,4-b]piridin-6-il)-5-oxotetrahidrofuran-2-carboxílico

- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(1-carboxiciclobutil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(3-carboxioxetan-3-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(2-carboxi-1-cloro-3-hidroxiopropan-2-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 3-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi]azetidina-3-carboxílico
- ácido 4-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi]oxano-4-carboxílico
- ácido 4-(((Z)-1-(2-aminotiazol-4-il)-2-(((4S)-2-((4S)-2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxoisindolin-2-il)-5-oxotetrahidrofuran-2-il)-3-oxoisoxazolidin-4-il)amino)-2-oxoetiliden)amino)oxi)-1-metilpiperidin-4-carboxílico
- ácido (4S)-2-((S)-4-((Z)-2-(2-aminotiazol-4-il)-2-(((1-carboxi-4,4-difluorociclohexil)oxi)imino)acetamido)-3-oxoisoxazolidin-2-il)-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxoisindolin-2-il)-5-oxotetrahidrofuran-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-((S)-4-((Z)-2-(2-aminotiazol-4-il)-2-(((1-carboxi-4-cloro-4-fluorociclohexil)oxi)imino)acetamido)-3-oxoisoxazolidin-2-il)-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxoisindolin-2-il)-5-oxotetrahidrofuran-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-((S)-4-((Z)-2-(2-aminotiazol-4-il)-2-(((1-carboxi-4,4-diclorociclohexil)oxi)imino)acetamido)-3-oxoisoxazolidin-2-il)-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxoisindolin-2-il)-5-oxotetrahidrofuran-2-carboxílico
- ácido 3-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-8-oxabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(1-carboxi-3,3-dimetilciclobutil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico

- ácido 3-((Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-((4S)-2-[2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il)amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-8-metil-8-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(3-carboxi-8,8-dimetilbicyclo[3.2.1]octan-3-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-[(1-carboxiciclobutil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 4-((Z)-[1-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-((4S)-2-[2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il)amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)oxan-4-carboxílico
- ácido 3-((Z)-[1-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-((4S)-2-[2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il)amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-8-oxabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-[(3-carboxi-8,8-dimetilbicyclo[3.2.1]octan-3-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol[3,4-b]pirazin-6-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(5-amino-1,2,4-tiadiazol-3-il)-2-[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol[3,4-b]piridin-6-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-5-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2-[(1-

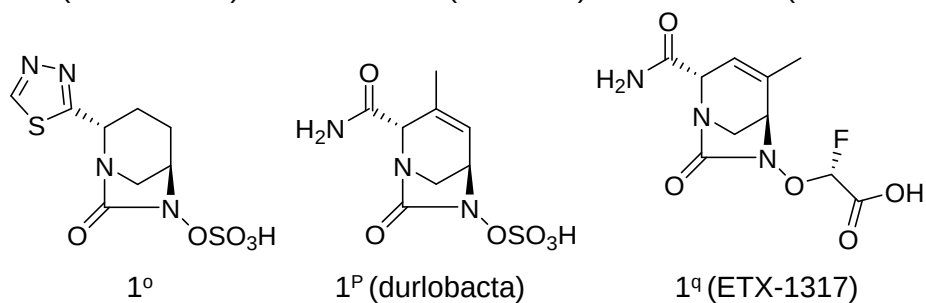
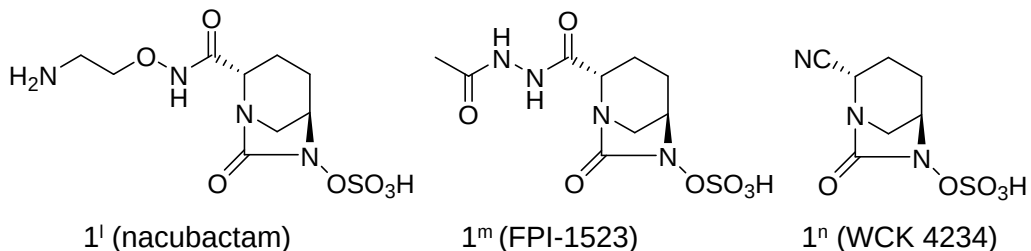
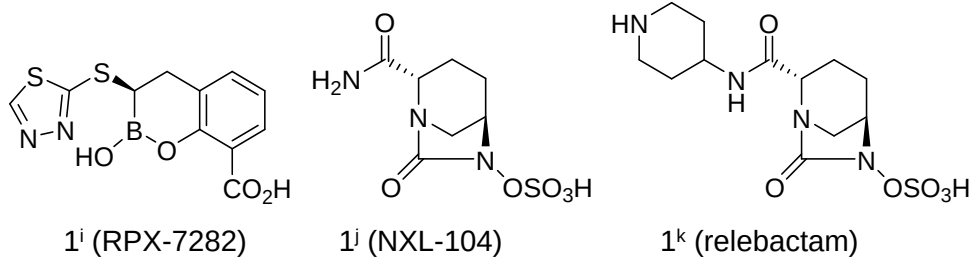
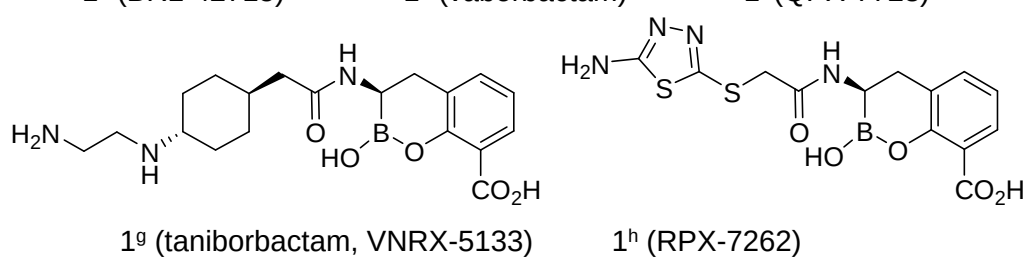
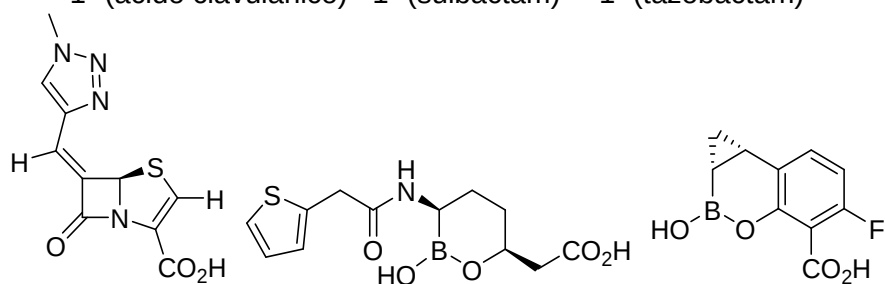
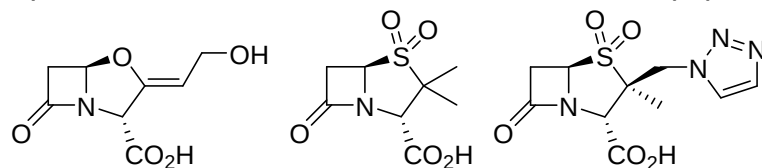
- carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[[[(2Z)-2-(2-amino-5-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2-[[[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol-3,4-b]piridin-6-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 4-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol-3,4-b]piridin-6-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)oxano-4-carboxílico
- ácido 3-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol-3,4-b]piridin-6-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-8-oxabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[[[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[[[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1-oxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 4-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1-oxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)oxano-4-carboxílico
- ácido 3-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[(4S)-2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1-oxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-8-oxabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[[[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[[[(1-carboxiciclopropil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,1,3-trioxo-1,3-dihidro-2H-1λ⁶,2-benzotiazol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 4-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,1,3-trioxo-1,3-dihidro-2H-1λ⁶,2-benzotiazol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il]amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)oxano-4-carboxílico
- ácido 3-[(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(4S)-2-[2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-

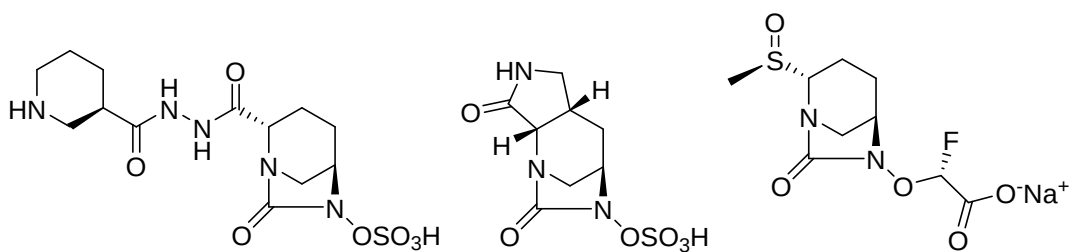
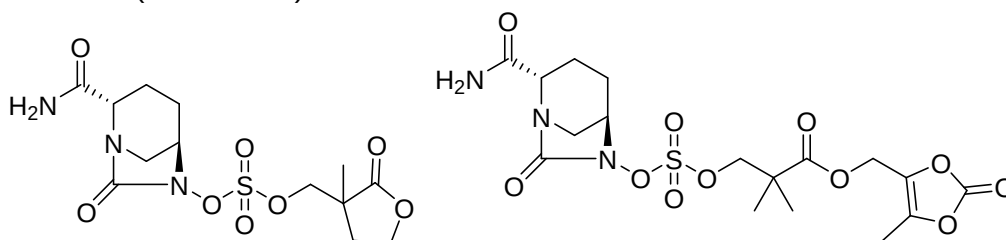
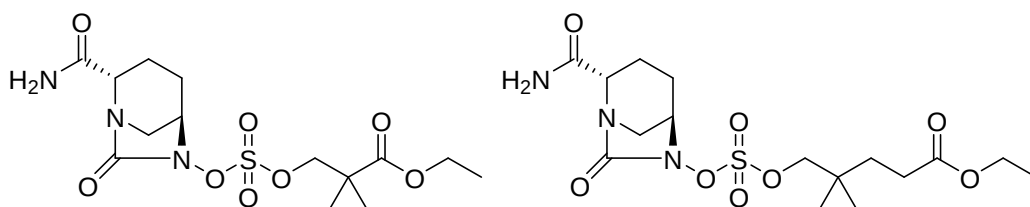
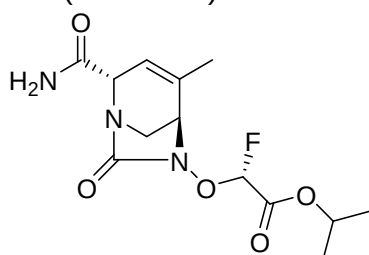
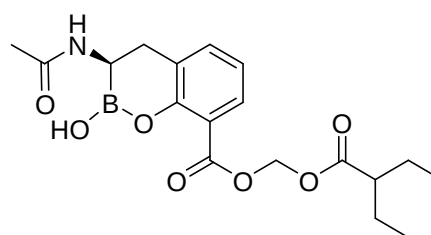
- 1,1,3-trioxo-1,3-dihidro-2H-1λ⁶,2-benzotiazol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il}amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-8-oxabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxílico
- ácido 7-({(Z)-[1-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-((4S)-2-[2-carboxi-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-il]-3-oxo-1,2-oxazolidin-4-il}amino)-2-oxoetiliden]amino}oxi)-4-oxaspiro[2.5]octano-7-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(2-carboxipropan-2-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1-oxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(2-carboxipropan-2-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(2,3-dihidroxi-5,7-dioxo-5,7-dihidro-6H-pirrol[3,4-b]piridin-6-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(2-carboxipropan-2-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,1,3-trioxo-1,3-dihidro-2H-1λ⁶,2-benzotiazol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido (4S)-2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(1-carboxi-4,4-dimetilciclohexil)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico
- ácido 2-[(4S)-4-[(2Z)-2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2-[(2-carboxi-1,3-dihidroxiopropan-2-il)oxi]imino}acetil]amino}-3-oxo-1,2-oxazolidin-2-il]-4-(5,6-dihidroxi-1,3-dioxo-1,3-dihidro-2H-isoindol-2-il)-5-oxooxolan-2-carboxílico o

12. Una composición farmacéutica que comprende uno o más compuestos de fórmula (I) de una cualquiera de las reivindicaciones 1-11 o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos y un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

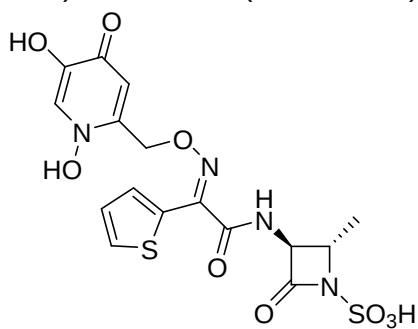
13. Una composición farmacéutica que comprende (i) uno o más compuestos de fórmula (I) de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, (ii) uno o más inhibidores de β-lactamasa y (iii) un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

14. La composición farmacéutica de la reivindicación 13, en donde los inhibidores de β -lactamasa se seleccionan entre la fórmula (1^a) a 1^{z'}):



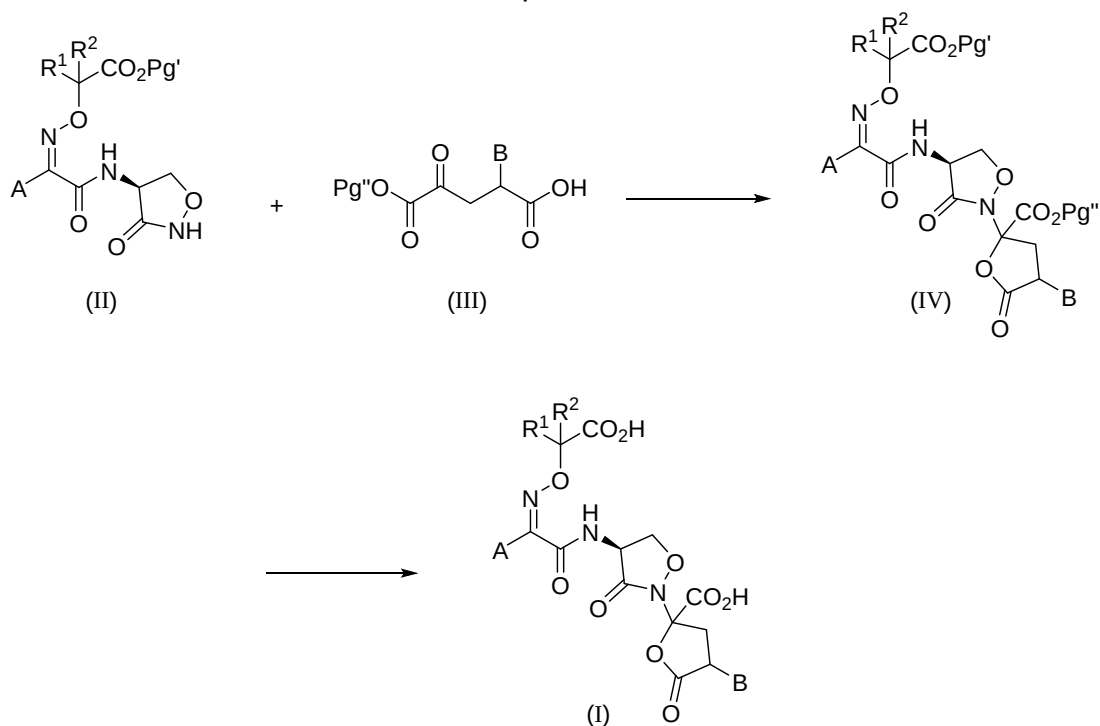
1^r (zidebactam)1^s1^t1^u1^v1^w (ARX-1796)1^x1^y (ETX-0282)1^z (VNRX-7145)

y

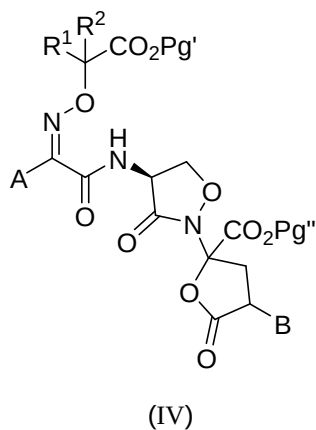
1^{z'} (Syn2190).

15. Un método para la preparación del compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende realizar la secuencia de reacción del Esquema 1.

Esquema 1



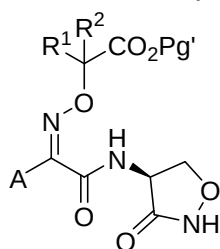
16. Un método para la preparación del compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende eliminar grupos protectores de un compuesto de fórmula (IV), en donde Pg' y Pg'' representan un grupo protector



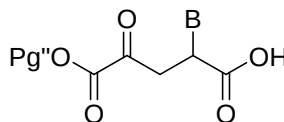
en donde los grupos protectores de carboxilo Pg' y Pg'' en la fórmula (IV) son restos de un alcohol alifático o aralifático formador de éster.

17. El método de acuerdo con la reivindicación 16, en donde los grupos protectores de carboxilo se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en *iso*-propilo, *terc*-butilo, metoximetilo, etoximetilo, *iso*-butoximetilo, acetoximetilo, propioniloximetilo, butiriloximetilo, pivaloiloximetilo, 1-metoxycarboniloxietilo, 1-etoxycarboniloxietilo, *p*-metoxibencilo, bencilo, *o*-nitrobencilo, *p*-nitrobencilo, 2,4-dinitrobencilo, bencihidrido, ftalidilo y alilo.

18. El método de acuerdo con la reivindicación 16 o 17, caracterizado por que el compuesto (IV) se prepara haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula (III)

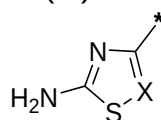


(II)



(III)

donde A está definido por la fórmula (Ia)



(Ia)

y en donde X es N o CR³ y R³ representa hidrógeno o halógeno;

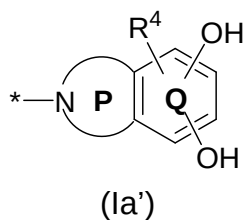
R¹ y R², junto con el átomo de carbono al que están unidos, puede formar un cicloalquilo (C₃-C₈), en donde

(i) el cicloalquilo puede contener un heteroátomo seleccionado entre O, N y S, y/o

(ii) el cicloalquilo puede estar sustituido con uno, dos, tres o cuatro sustituyentes seleccionados independientemente entre sí del grupo que consiste en alquilo (C₁-C₃) y halógeno; o

R¹ y R² pueden, independientemente entre sí, representar hidrógeno o alquilo (C₁-C₃), en donde alquilo (C₁-C₃) puede estar sustituido con un sustituyente seleccionado entre hidroxilo y cloro;

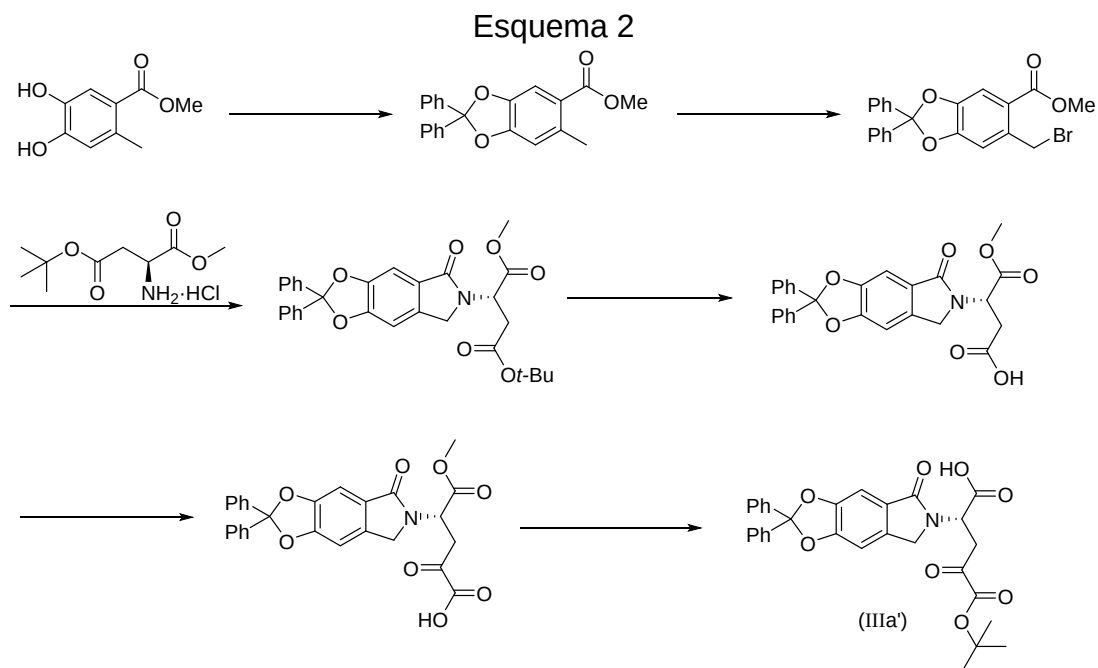
B es un catecol bicíclico o fragmento de hidroxipiridona que lleva un fragmento definido por la fórmula (Ia')



en donde P es un anillo insaturado de 5 miembros o 6 miembros, que opcionalmente puede contener un grupo carbonilo (CO) o dos grupos carbonilo (CO) o un grupo sulfona (SO₂) o una combinación de un grupo carbonilo (CO) y una sulfona (SO₂) y puede contener además hasta dos átomos de N adicionales; y

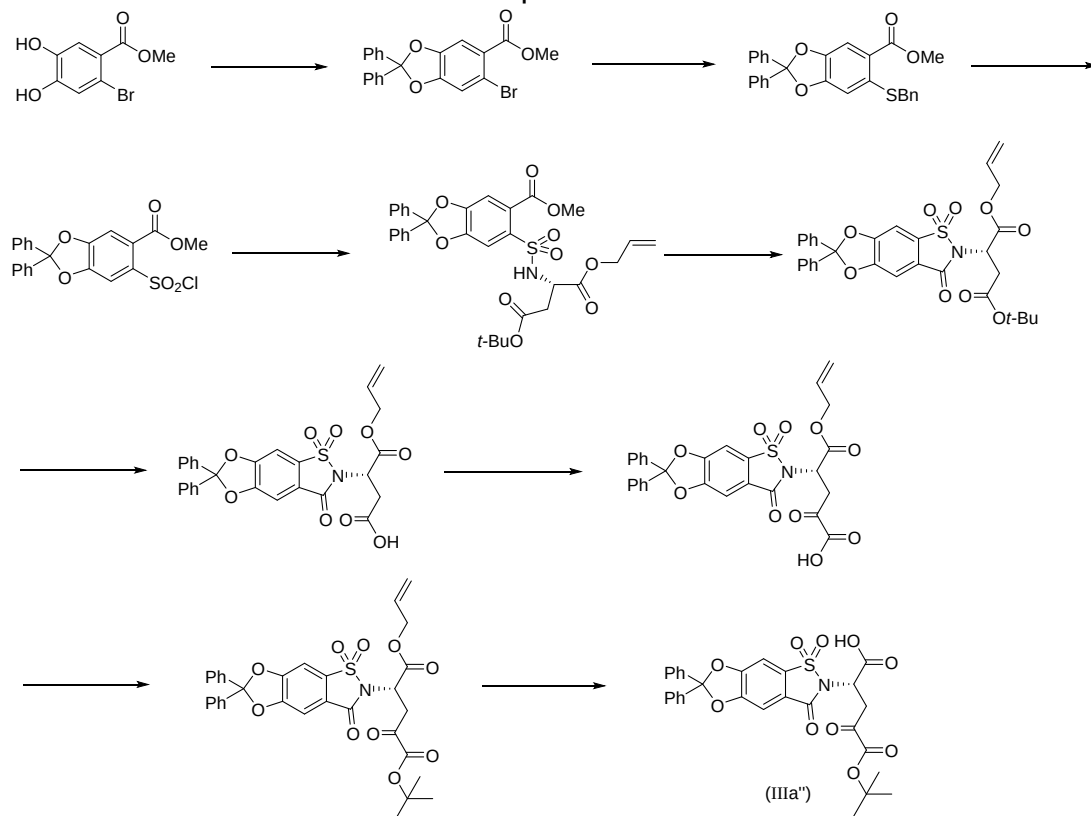
en donde Q puede contener hasta dos átomos de N y en donde R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo (C₁-C₃), carbonilo, trifluorometilo, ciano y un halógeno.

19. El método de acuerdo con la reivindicación 18, en donde el compuesto de fórmula (III) se prepara mediante la secuencia de reacción del Esquema 2 para proporcionar un compuesto intermedio de fórmula (IIIa').



20. El método de acuerdo con la reivindicación 18, en donde el compuesto de fórmula (III) se prepara mediante la secuencia de reacción del Esquema 3 para proporcionar un compuesto intermedio de fórmula (IIIa'').

Esquema 3



21. El método de acuerdo con la reivindicación 18, en donde la reacción de acoplamiento del compuesto intermedio (II) con el compuesto intermedio (III) se produce en disolventes inertes en presencia de un reactivo de acoplamiento, a una temperatura que varía entre -20 °C y 80 °C durante de 1 a 24 horas.

22. El método de acuerdo con la reivindicación 21, en donde los disolventes inertes son uno o más de diclorometano, tolueno, N-metilpyrrolidin-2-one, 1,4-dioxano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo y tetrahidrofurano.

23. El método de acuerdo con la reivindicación 21, en donde el reactivo de acoplamiento es uno o más de N,N'-diethylcarbodiimida, N,N'-dipropylcarbodiimida, N,N'-diisopropylcarbodiimida, N,N'-dicyclohexylcarbodiimida, clorhidrato de N-etil-N'-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (EDC), carbonildiimidazol (CDI), O-(benzotriazol-1-il)-N,N',N'-hexafluorofosfato de tetrametiluronio (HBTU), O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N',N'-hexafluorofosfato de tetrametiluronio (HATU), 1-

hidroxibenzotriazol (HOBt), hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tripirrolidinofosfonio (PyBOP) y *N*-hidroxisuccinimida y mezclas de los mismos, con o sin adición de una base.

24. El método de acuerdo con la reivindicación 21 que comprende además la adición de una base a la reacción de acoplamiento, en donde la base es uno o más de un carbonato, un bicarbonato, trietilamina, diisopropiletilamina, *N*-metilmorfolina, *N*-metilpiperidina y 4-dimetilaminopiridina.