

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 646 628**

21 Número de solicitud: 201790034

51 Int. Cl.:

C07H 15/04 (2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A2

22 Fecha de presentación:

04.03.2016

30 Prioridad:

13.03.2015 CN 201510109400

43 Fecha de publicación de la solicitud:

14.12.2017

71 Solicitantes:

**HUIAN PEAKS BIOLOGICAL SCIENCE AND
TECHNOLOGY CO., LTD (100.0%)
Room 401, Silicon Valley Building No. 9 Haikou
Road, Economic Development Zone Huaian
JIANGSU CN**

72 Inventor/es:

SHAN, Yulong

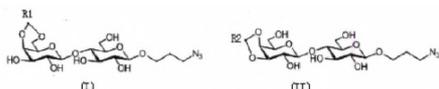
74 Agente/Representante:

DE PABLOS RIBA, Juan Ramón

54 Título: **MOLÉCULA DE AZÚCAR ACTIVA FARMACÉUTICAMENTE Y SU MÉTODO DE SÍNTESIS**

57 Resumen:

Este invento revela una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, que forma una estructura de fórmula (I) o (II):



La invención de la molécula de azúcar puede ser utilizado para la síntesis de moléculas de azúcar de sulfonación, además, se aplica el mecanismo de patogenicidad de la bacteria en el intestino grueso. Métodos de síntesis que ofrece el invento sencillo, cómodo y fácil de usar, puede utilizarse para sintetizar muchas moléculas de azúcar.

DESCRIPCIÓN

Molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis.

5 Objeto de la invención

La presente invención, según expresa el enunciado de esta memoria se refiere a una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, cuyo objeto es poder servir de importante medio para la síntesis química de moléculas de azúcar de sulfonación, aplicándose además el mecanismo de patogenicidad para la investigación de la *escherichia coli*, el invento ofrece un método de síntesis sencillo, cómodo y fácil de usar que puede ser utilizado para el estudio de la estructura molecular de bacilos coliformes, así como pudiéndose utilizar para sintetizar muchas moléculas de azúcar y la síntesis de moléculas que proporciona el invento puede ser empleada para actividades de preparación y desarrollo de medicamentos diferentes.

Campo de aplicación

El campo de aplicación se enmarca dentro del campo de la tecnología química en la medicina, especialmente en lo que se refiere a moléculas de azúcar activas para medicamentos.

Antecedentes de la invención

25 La *Escherichia coli* es la bacteria común, y suele aparecer en el cuerpo humano y el cuerpo de los animales. La mayoría de las bacterias son inofensivas, pero algunas especies perjudiciales para el cuerpo humano, tales como H4 *Escherichia coli* en Alemania y Francia causó 50 muertes.

30 FebF es la *escherichia coli* F18 pili final, cuando la molécula de azúcar FebF captura en la mucosa intestinal, puede causar las enfermedades como la diarrea o edema. FebF se encuentra a menudo con aminos lactosa acetyl sulfonación y sulfonación con lactosa, pero el ligado específico, aún no se han confirmado.

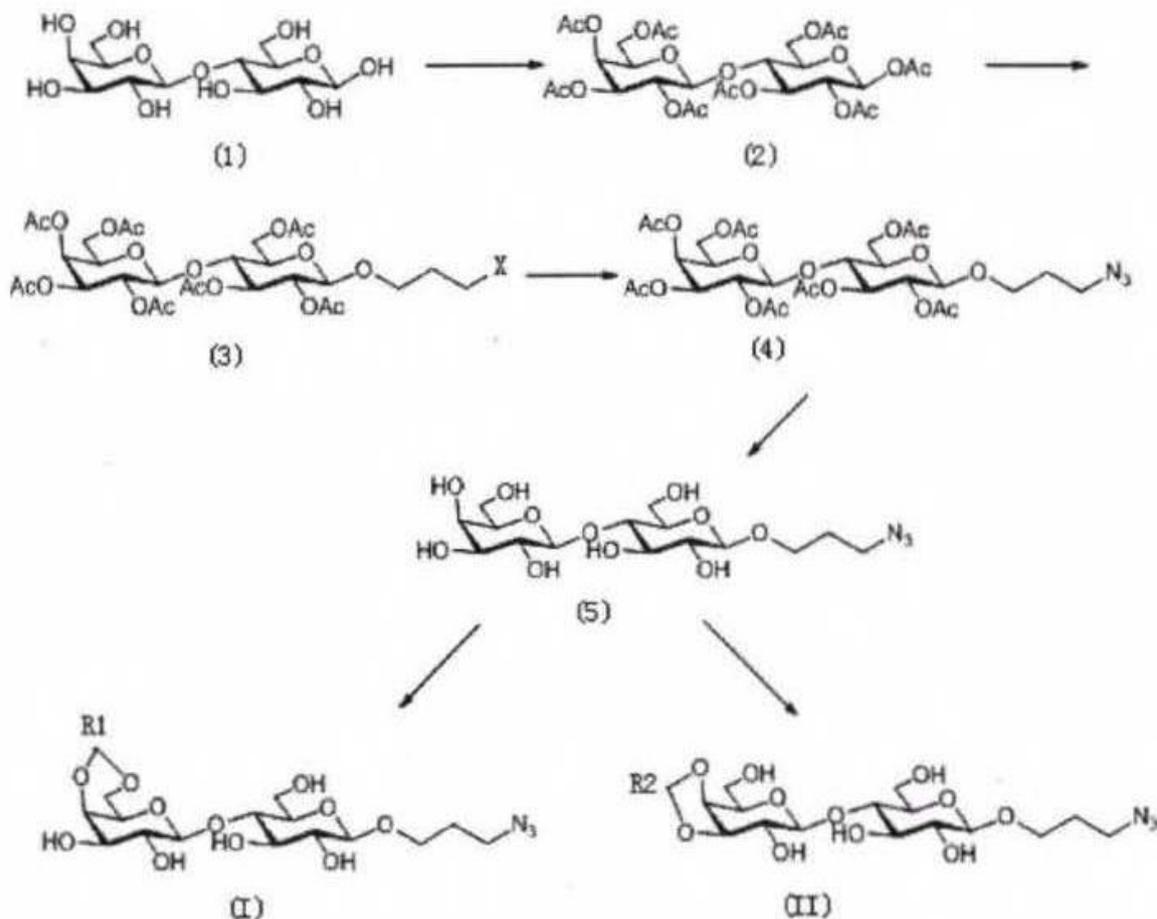
35 Para el estudio de la estructura de los hidratos de carbono en combinación de sustancias, la estructura molecular de la glucosa es la síntesis de las diferentes necesidades de la sulfonación.

40 Para resolver los problemas expuestos, la actividad de la síntesis de moléculas de azúcar de la presente invención puede utilizarse su aplicación a productos importantes tal como es la síntesis de moléculas de azúcar de sulfonación, la cual se aplica en la patogénesis de la *escherichia coli*, y dicha síntesis de moléculas que proporciona el invento puede ser empleada para actividades de preparación y desarrollo de medicamentos diferentes.

45 Explicación de la invención

De manera concreta, lo que la presente invención preconiza es una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, constituyendo una molécula de azúcar la droga activa, teniendo forma de (I) (II) de la estructura de la muestra, la actividad de la molécula de azúcar puede utilizarse para sintetizar una molécula de azúcar de sulfonación, lo que se aplica en la patogénesis de la *escherichia coli*.

El invento también proporciona tipo (I) o (II) que se muestra en forma de síntesis de los compuestos, el proceso consta de las siguientes reacciones:



5

- Entre ellos, R1, R2 de forma independiente con la definición anterior;
- X es un halógeno.

10

- **Como ejemplo práctico, el método de la invención de preparación, consta de los siguientes pasos de la reacción:**

15

1). En presencia de bases, la manera (1) de los compuestos de la reacción con anhídrido, se obtiene la fórmula (2) de los compuestos.

20

2). La manera (2) de reacción de alcoholes con halogenuros de generación, obtiene la manera de (3) compuesto glucósido de leche.

3). La manera (3) de reacciones de compuestos y azidas, se obtiene la fórmula (4) de los compuestos que la muestra.

4). La manera (4) de la hidrólisis de compuestos, se obtiene la fórmula (5) de los compuestos que la muestra.

25

5). La manera (5) de acetales o cetales compuestos y reacciones, se obtiene la fórmula (I) o (II) de los compuestos que la muestra.

- Entre ellos, paso 2) halógenos en alcoholes halogenados, F, Cl, Br o I; La formación de alcoholes como C₁₋₁₀ alquilo, el anhídrido acético como catalizador.

Paso 3) de azidas, preferiblemente de azida de sodio o potasio 1 azida;

5

R1, R2 de forma independiente con la anterior definición; X es un halógeno.

Definir y Explicar el Término

10 A menos que se indique otra cosa, cuando se usan "compuestos de este invento en el documento" o cuando "la invención de los compuestos", abarca el tipo (I) y (II) muestra todos los compuestos.

El término "halógenos" flúor, cloro, bromo y yodo.

15

El término "C₁₋₂₀ alquilo" se debe entender como representación referido es de 1-20 átomos de carbono saturados hidrocarburos de cadena ramificada de conexión directa o monovalentes, preferiblemente C₁₋₁₀ alquilo. "C1-6 alquilo" se debe entender como una representación preferido 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono o de cadena ramificada hidrocarburos saturados con un precio, por ejemplo, metil, etil, propilo, butilo, amyl, hexilo, alcohol isopropílico, base de isobutilo, la base de butilo, terc-butilo, isoamyl, 2-metil de butil, 1-metil de butil, 1-etil propil, 1,2-2 -metil propil, neopentilo,, 4-Amil metil, 3-Amil metil, 2-Amil metil, 1-Amil metil, 2-Butil etil, 1-Butil etil, 3,3-Dimetil de butilo, 2,2-Dimetil de butilo, 1,1-Dimetil de butilo, 2,3-Dimetil de butilo, 1,3-Dimetil de butilo o 1,2-Dimetil-butilo o Isómeros de ellos. En particular, el grupo tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono ("C1-4 Alquilo"), por ejemplo, metil, etil, propilo, butil, isopropil, base de isobutilo, SEC de butil, terc de butilo, más en particular, dicho grupo tiene 1, 2 o 3 átomos de carbono ("C1-3 Alquilo"), por ejemplo de metilo, etilo, N -propil o isopropyl.

20

25

30

El término "sub alquil" se refiere a cualquier conexión directa o de cadena ramificada hidrocarburos bivalente, "C₁₋₂₀ sub alquil" se debe entender como representación preferido es de 1-20 átomos de carbono saturados hidrocarburos de cadena ramificada de conexión directa o bivalente, preferiblemente C₁₋₁₀ sub alquil, se debe entender como representación preferido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 átomos de carbono saturados hidrocarburos de cadena ramificada de conexión directa o bivalente, que incluye -(CH₂)₁₋₁₀- sub alquil, en particular -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH₂)₆- O -CH (CH₃)-, -C (CH₃)₂-, -CH(C₆H₅)-, -CH(CH₂CH₃)- etc..

35

40

El término "Anillos heterocíclicos" de anillo o doble anillo de hidrocarburos saturados monovalentes significa, contiene 1-5 independiente elegido de N, O y S heteroátomos, preferiblemente "3-10 yuanes heterocíclicos alquil". El término " 3-10 yuanes heterocíclicos alquil" de anillo o doble anillo de hidrocarburos saturados monovalentes significa, contiene 1-5, preferiblemente de 1-3 seleccionado de N, O y S heteroátomos.

45

El término "C6-10 alquil de aromáticos", se debe entender como representación preferido con 6 - 10 átomos de carbono aromáticos aromaticidad o parte de un anillo. Se debe entender como representación preferido con 6, 7, 8, 9, 10 átomos de carbono o de parte de un anillo aromáticos aromaticidad.

50

El término "5-10 yuanes heteroarilo alquil de aromáticos" se debe entender como un anillo de monovalentes, sistema doble o anillos aromáticos tricíclicos: Tiene 5-10 átomos de anillo y contiene 1 - 5 independiente elegido de N, O y S heteroátomos.

El efecto beneficioso de la invención:

1. La invención de la molécula de azúcar puede servir de importante intermedio para la síntesis química de moléculas de azúcar la sulfonilurea, el mecanismo de patogenicidad para la investigación de *escherichia coli*.

2. Los compuestos de la invención siempre tiene azido como grupo conectado de la misión de genes, puede ser mucho mejor la estructura molecular de la reacción con otros enlaces, puede ser utilizado para el estudio de la estructura molecular de bacilos coliformes, es de gran importancia en el desarrollo de los medicamentos.

3. Para la síntesis de moléculas de azúcar que proporciona el invento puede ser utilizado para actividades de preparación de medicamentos diferentes, y la operación es simple y conveniente.

Realización específicas de aplicación

A continuación se concreta en esta invención de una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, compuestos y su método de preparación y aplicación más detalladas de la nota. Los ejemplos siguientes sólo como ejemplo para ilustrar y entonces el invento, y no debe interpretarse como la limitación al ámbito de la protección de la invención. Los contenidos de la invención de la tecnología que se incluye en la aplicación dentro de los límites de este invento que pretende proteger.

A menos que se indique otra cosa, el uso de los materiales y reactivos de la encarnación se venden en el mercado de bienes.

Ejemplo de Aplicación 1: La Actividad de las Moléculas de Azúcar (001) Preparación**1.1 Preparación de Compuestos (2)**

Tomar el acetato de sodio anhidro (2 eq, 25.0 g, 0.31 mol) y anhídrido acético (10.7 eq, 175 ml, 1.85 mol) del calentamiento de la mezcla a la temperatura de reflujo, entonces uno por uno a los compuestos 1 (D - La lactosa, 1 eq, 50.0 g, 0.15 mol), seguir 30 minutos la calefacción de reflujo reacción, la reacción de solución en 500 ml de agua helada en la agitación de la noche a la mañana; Separación de sólidos el lavado, filtrado, secado al vacío después de 600 ml de etanol por recristalización, para conseguir el objetivo de producto 2 (80.6 g, 81%).

La espectroscopia de resonancia magnética de los datos son los siguientes:

¹H-NMR2. (500 MHz, CDCl₃ = 7.31 ppm): δ = 5.66 (d, 1H, H-1, J_{1,2} = 8.4 Hz), 5.33 (dd, 1H, J = 1.2Hz, J = 3.6 Hz H-4'), 4.46 (d, 1H, J = 7.6 Hz, H-1'), 4.42 (d, 1H, H-6' a), 4.13-4.04 (m, 3H, H-5', H-6A, H-6'B), 3.88-3.85 (m, 2H, H-4', H-6b) 2.14, 2.10, 2.08, 2.05, 2.04, 2.02, 2.01, 1.95 (Bs, 24H, 8CH₃) ppm:

¹³C-NMR (125 MHz, CDCl₃ = 77.16): δ = 170.48, 170.44, 170.26, 170.18, 169.74, 169.68, 169.14, 168.98 (8C, BC=O), 101.68 (C-1'), 91.67 (C-1), 75.81, 73.63, 72.76, 71.09, 70.87, 70.65, 69.14, 66.74, (8C), 61.87 (C-6), 60.98 (C-6'), 20.95, 20.93, 20.87, 20.75, 20.73, 20.71, 20.62, 18.53 (CH₃) ppm.

1.2 Preparación de Compuestos (3)

Tomar el compuesto 2 (1 eq., 10.0 g 14.7 mmol) y tolueno girar juntos después de la destilación, disolución en DCM; Se va 3 - mcpd (2 eq., 2.5 mL, 29.4 mmol) y BF₃.Et₂O (2.5 eq, 4.7 mL, and 36.8 mmol) de la adhesión en reacción a la solución, la reacción de nitrógeno en el medio ambiente, la mezcla de reacción a temperatura ambiente por 3 horas, el proceso de reacción por TLC (toluene/EtOAc, 1:1) control de supervisión ; Después de la reacción, añadir la solución en agua helada durante 30 minutos; después de mezclar la solución de estratificación, con la saturación de la capa orgánica NaHCO₃ y la saturación de agua y sal, la destilación de reducción de presión; Después de la separación del producto bruto por sílice obtener leche con largas cadenas de Glucósido (8,2 g, 82%).

La espectroscopia de resonancia magnética de los datos son los siguientes:

¹H-NMR(500 MHz, CDCl₃ = 7.31 ppm): δ = 5.33 (dd, 1H, J = 1.2 Hz, J = 4.4 Hz, H-4'), 5.14 (dd = t, 1H, H-3), 5.10 (dd, 1H, H-2'), 4.94 (dd, 1H, J = 3.6 Hz, J = 10.4 Hz, H 3'), 4.87 (dd, 1H, J = 8.0 Hz, J = 9.6 Hz, H-2), 4.50-4.45 (m, 3H, H-1', H 6a, H-1), 4.14-4.04 (m, 3H, H-5', H-6a, H-6' b), 3.96-3.91 (m, 1H, -OCH₂a-), 3.88-3.84 (m, 1H, H-6b), 3.80-3.75 (dd = t, 1H, H-4), 3.69-3.55 (m, 4H, H-5, -OCH₂b, -CH₂N₃), 2.14, 2.11, 2.05, 2.04, 2.03, 2.29, 1.95 (7s, 21H, -COCH₃) ppm:

¹³C-NMR (125 MHz, CDCl₃ = 77.16 ppm): b = 170.50, 170.47, 170.27, 170.18, 169.86, 169.83, 169.19 (C=O), 101.21 (C1), 100.93 (C1'), 76.4, 72.84, 72.80, 71.79, 71.13, 70.83, 69.25 (7C), 66.74 (-OCH₂CH₂CH₂Cl), 66.50, 62.11, 60.95 (3C), 41.43 (2C, -OCH₂CH₂CH₂Cl), 32.29 (-OCH₂CH₂CH₂Cl), 20.99, 20.93, 20.94, 20.82, 20.77, 20.76, 20.74 (CH₃) ppm. MALDI-TOF MS: 737.06 [M+Na]⁺ ± 27 ppm.

1.3 Preparación de Compuestos (4)

Tomar el compuestos de 3 (1 eq, 4.0 g, 5.6 mmol) NaI (2 eq, 1.7 g, 11.3 mmol) se disuelve en el secado en DMF, calentar a 50°C para agitar durante 1 hora; Luego añadir NaN₃ después de la solución se calienta a reacción 140°C 1 hora de reflujo, la reacción en solución en agua helada; después añadir EtOAc de la estratificación, la separación de la fase orgánica, repetir la extracción y el uso de dos etoac, la fase de extracción dos veces después de la fusión con la saturación de agua salada, la limpieza, la destilación al vacío para obtener la materia y objetivo 4 (3.2 g, 80%).

La espectroscopia de resonancia magnética de los datos son los siguientes:

¹H-NMR(500 MHz, CDCl₃ = 7.31 ppm): δ = 5.39 (dd, 1H, J = 1.2 Hz, J = 3.6 Hz H-4'), 5.23 (dd=t, 1H, H-3), 5.15 (dd, 1H, H-2'), 5.00 (dd, 1H, J ~ 3.6 Hz, J = 10.4 Hz, H-3'), 4.93 (dd, 1H, H-2), 4.55-4.50 (dd, 1H, H-6'a), 4.52 (d, 1H, H-1'), 4.51 (d, 1H, H-1), 4.18-4.09 (m, 3H, H-5', H-6a, H-6'b), 3.97-3.89 (m, 2H, H-6b, -OCH₂^a-), 3.83 (dd = t, 1H, J = 9.6 Hz, H-4), 3.66-3.59 (m, 2H, H-S, OCH₂^b-), 3.41-3.36 (m, 2H, -CH₂N₃), 2.19, 2.16, 2.10, 2.09, 2.08, 2.01, 2.00 (7s, 21H, -CH₃), 1.90-1.82 (m, 2H, -CH₂CH₂CH₂N₃) ppm;

¹³C-NMR (125 MHz, CDCl₃ = 77.16 ppm): b = 170.40, 170.39, 170.19, 170.10, 169.80, 169.68, 169.12 (C=O), 101.22 (C1), 100.71 (C1'), 76.38 (C-4), 72.89 (C-3), 72.81 (C-5), 71.79 (C-2), 71.12 (C-5'), 70.83 (C-3'), 69.24 (C-2'), 66.74 (C-4'), 66.59 (-OCH₂CH₂CH₂N₃), 62.06 (C-6'), 60.93 (C-6), 48.08 (-OCH₂CH₂CH₂N₃), 29.11 (-OCH₂CH₂CH₂N₃), 20.98-20.64 (7 CH₃) ppm. MALDI-TOF MS: 742.21 [M+Na]⁺ ± 40 ppm.

1.4 Preparación de Compuestos (5)

Tomar el compuestos de 4 (1eq, 1.0 g, 1.38 mmol) soluble en metanol de secado (10 ml);
 5 Después de la adición de metanol de sodio (1 M, 100 μ l), la solución de reacción a temperatura ambiente durante la noche, mediante el proceso de reacción TLC (DCM/MeOH, 3: 1) para el control de supervisión; Después de la reacción, la reacción de adición de líquido en Dowex H⁺ de la resina de intercambio de iones, la agitación de 30 minutos; la reacción de neutralización en la supervisión de control de pH, después de la
 10 reacción, la resina de intercambio de filtrado, limpieza con metanol, la cristalización de un compuesto líquido filtrado a través de la reducción de la presión después de la destilación para obtener la luz amarilla de 5 (510 mg, 88%).

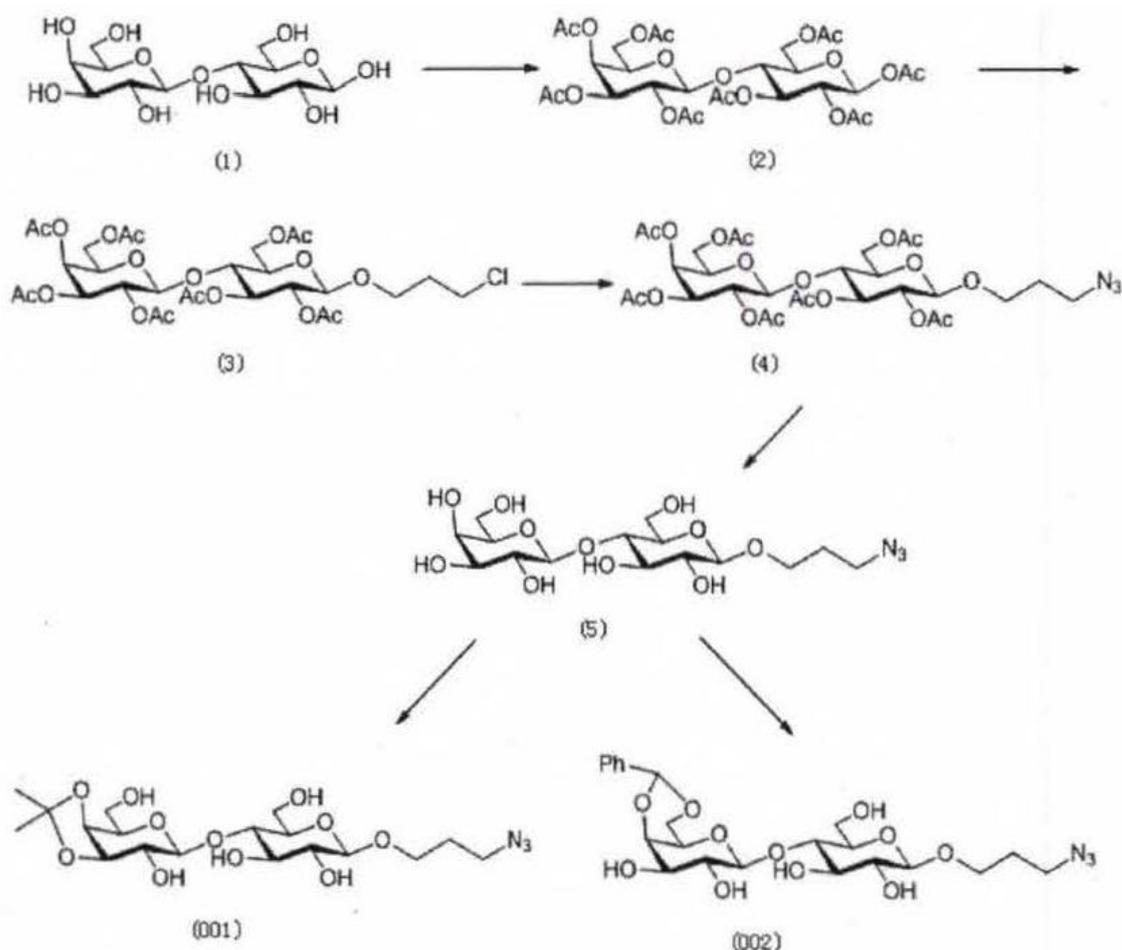
La espectroscopia de resonancia magnética de los datos son los siguientes:

15 ¹H-NMR (500 MHz, D₂O = 4.80 ppm): δ = 4.49 (2xd, 2H, H-1', H-1), 4.04-3.98 (m, 2H), 3.95 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.81-3.77 (m, 3H), 3.5 (m, 1H), 3.70-3.65 (m, 3H), 3.64-3.60 (m, 1H), 3.58-3.54 (m, 1H), 3.48 (m, 2H), 3.35-3.31 (m, 1H), 1.93 (m, 2H, -OCH₂CH₂CH₂N₃) ppm;

20 ¹³C-NMR (125 MHz, D₂O, TMS = ppm): δ = 102.91 (C-1'), 102.11 (C-1), 78.37, 75.33, 74.75, 74.36, 72.79, 72.50, 70.93, 68.52, 67.35 (-OCH₂CH₂CH₂N₃), 61.00, 60.06, 47.85 (-OCH₂CH₂CH₂N₃), 28.21 (-OCH₂CH₂CH₂N₃) ppm.: MALDI-TOF MS: 448.18 [M+Na]⁺ \pm 45 ppm.

1.5 La Actividad de las Moléculas de Azúcar (001) Preparación

En un matraz de fondo redondo de la adhesión VO(OTf)₂ (0.05 eq, 40 mg), con secado de acetonitrilo (1.77 mL) y la segunda armadura oxi propano (10 eq., 2.9 mL), agitar durante
 30 10 minutos para que el pleno de la disolución, la solución se compone de luz azul marrón; Luego añadir compuestos de 5 (50 mg, 118 mmol), la reacción de dos días a temperatura ambiente; proceso de reacción por TLC (EtOAc/MeOH, 4:1) control de supervisión; después de la reacción final, la reacción de líquido concentrado después de la columna de separación a través de gel de sílice para conseguir el objetivo de producto 001 (36 mg,
 35 69%).



Ejemplo de Aplicación 2: Actividad de la Molécula de Azúcar (002) Preparación

- 5 Tomar el compuesto de 5 (1 eq., 1 g, 1.95 mmol) se disuelve en seco de acetonitrilo (10 mL), la adición de benzaldehído dimetil (2 eq., 800 μ L) y la cantidad de catalizador ácido sulfónico de alcanfor; La mezcla de reacción en condiciones de 30 grados por la noche; El proceso de reacción por TLC(EtOAc/MeOH/water, 7:2:1) control de supervisión,
- 10 después de la reacción final, la adición de trietilamina (330 μ L), la reacción de la concentración de la solución de gel de sílice de la columna de separación, obtener un compuesto 002 (1 g, 83 %) : MICRO-TOF MS: 513.325[M⁺] \pm 41 ppm.

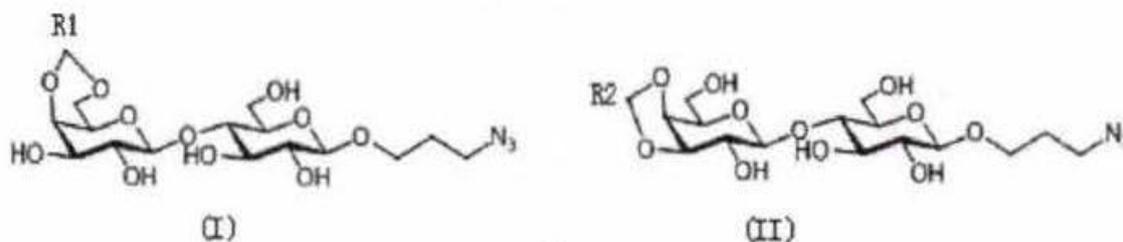
15 El invento a través de azido misión de genes para hacer la conexión, la estructura puede ser mejor con otras moléculas a través de la conexión, para la síntesis de moléculas de sulfonación de azúcar, lo que se aplica el mecanismo de investigación de *escherichia coli* patógena, la investigación en el campo de la tecnología aplicada a la medicina. Y el método puede ser utilizado en la síntesis de diversos compuestos, la operación es simple.

20 El ejemplo de aplicación de dicho anteriormente es solo para la descripción de la invención de la mejor forma de ejecución, no es la idea y el alcance de la definición de la invención. Bajo la premisa de no es salir en el diseño de este invento, el cambio y la mejora general de las personas en el campo de la invención de una tecnología, se cae en el ámbito de la protección de la invención.

25

REIVINDICACIONES

1. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, **caracterizada** por que forma una estructura de formula (I) o (II)



En la cual R1 y R2 son independientemente seleccionados a partir de C₁₋₂₀ alquileo sustituido por uno o más Ra, cada Ra independientemente seleccionado a partir de H, alquilo, alcoxi, heterocíclico, arílico, heteroarílico, halo o amino, en el cual el heterocíclico y el heteroarílico contiene de 1 a 5 heteroátomos independientemente seleccionados de N, O y S.

10

2. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizada** por que R1, R2 son independientemente seleccionados a partir de C₁₋₁₀ alquileo sustituido por uno o más Ra, cada Ra es independientemente seleccionado a partir de H, C₁₋₁₀ alquilo, 3-10 heterocíclico integrado, C₆₋₁₀ arílico, 5-10 heteroarílico integrado, F, Cl, Br, I o amino, en el cual los grupos de heterocíclico y el heteroarílico contienen de 1 a 5 donde la base de dicho alquilo de heterocíclicos y alquilo de mezcla de aril contienen 1-5 heteroátomos independientemente seleccionados de N, O y S.

15

20

3. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 2, **caracterizada** por que R1 y R2 son independientemente seleccionados de C₁₋₁₀ alquileo sustituido por uno o más Ra. Cada Ra es independientemente seleccionado de H, metilo, etilo, propílico, isopropílico, grupo fenilo, anillo de benceno sustituido, 5-6 heterocíclico, 5-6 heteroarílico integrado F, Cl, Br, I o NH₂, en la cual los grupos de heterocíclico y heteroarílico contienen de 1-3 heteroátomos independientemente seleccionados de N, O y S.

25

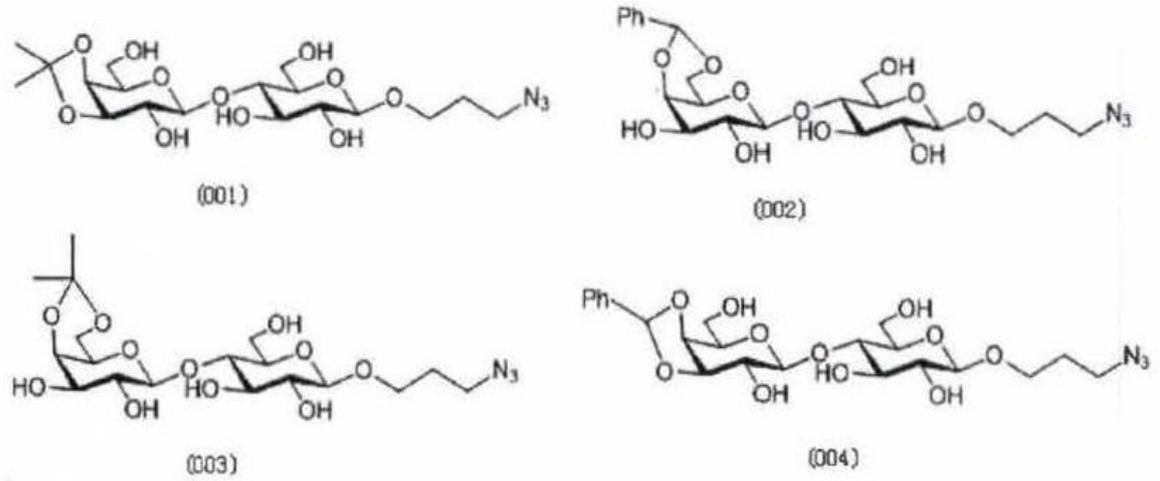
30

4. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 3, **caracterizada** por que R1 y R2 son cada uno independientemente seleccionados a partir de metileno sustituido por uno o más Ra. Cada Ra es independientemente seleccionado de H, metilo, etilo, grupo de benceno, grupo de benceno sustituido o NH₂.

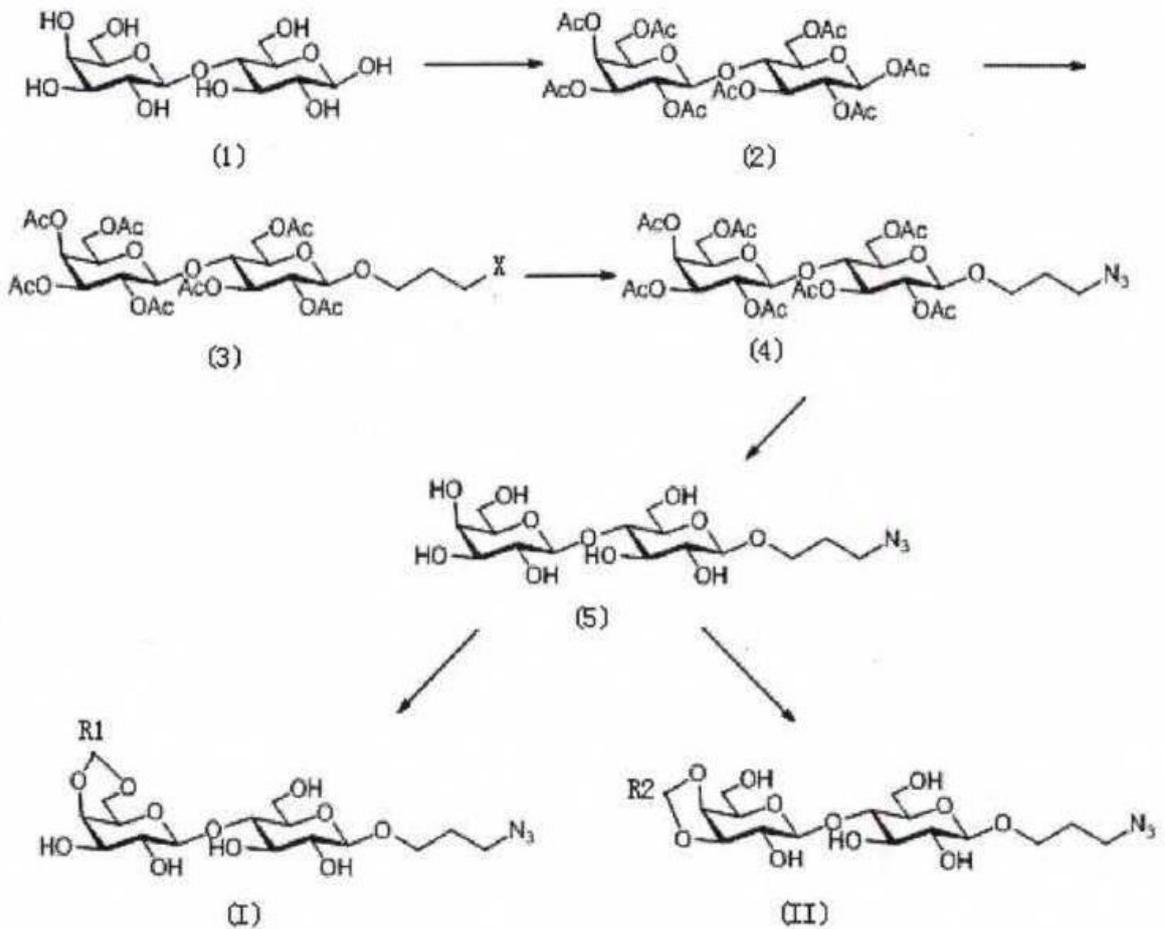
35

5. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizada** por que es seleccionada a partir de los siguientes componentes:

40



6. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con una de las reivindicaciones de la 1 a la 5, **caracterizada** por que comprende los siguientes dispositivos de reacción:



10

En el cual R1 y R2 cada uno independientemente tiene la definición donde se define en una de las reivindicaciones de la 1 a la 4, X seleccionados de halógenos.

7. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 5, **caracterizada** por que su forma de preparación consiste en los siguientes pasos:

- 5 1). El compuesto de la formula (1) reacciona con un ácido anhídrido, en presencia de una base para dar un compuesto de fórmula (2).
- 2). El compuesto de la formula (2) reacciona con un alcohol halogenado para dar un compuesto de formula (3).
- 10 3). El compuesto de formula (3) reacciona con el ácido para dar un compuesto descrito en la formula (4).
- 4). El compuesto de la formula (4) es hidrolizado para obtener un compuesto descrito en la formula (5).
- 15 5). El compuesto de la formula (5) reaccional con acetal o cetal, para obtener el compuesto de la formula (I) o (II).
- 20 En el cual R1 y R2 son cada uno independientemente definidos como describe la reivindicación 5.
- X seleccionados de halógenos.
- 25 8. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 7, caracterizada por que en su forma de preparación el halógeno de la halodrina en el paso 2) es, F, Cl, Br o I; el alcohol formado es un C₁₋₁₀ de alcohol alquílico y el anhídrido de ácido es usado como un catalizador.
- 30 9. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 7, **caracterizada** por que en su forma de preparación el ácido usado en el paso 3) es azida sódica o azida de potasio.
- 35 10. Una molécula de azúcar activa farmacéuticamente y su método de síntesis, de acuerdo con la reivindicación 7, **caracterizada** por que en su forma de preparación e l compuesto de la formula (5) es separado por una resina de intercambio catiónico en el tratamiento posterior al paso (4).