

JOSE LLORED CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6089700 Fax 6089704

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077069- -00004-0000

Fecha: 2009-03-11 16:13:40 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 15

Señor

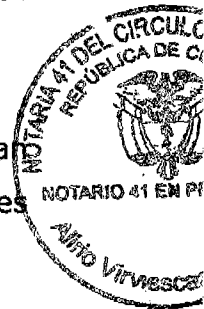
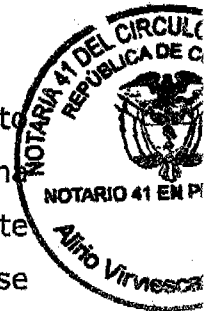
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-ARENA PHARMACEUTICALS, INC.-Solicitud de Patente de
Invencción en Fase Nacional PCT para "PROCESOS PARA
PREPARAR DERIVADOS DEL ÁCIDO 4-(FENOXI-5-METIL-
PIRIMIDIN-4-ILOXI) PIPERIDIN-1-CARBOXÍLICO Y
COMPUESTOS RELACIONADOS".-Clase C07D 401/12.-
Expediente número 07-077.069.-

1. Me refiero a mi memorial de 6 de Febrero de 2008.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número **596** de 30 de Septiembre de 2008, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. De otra parte, debidamente autorizado por mi representado, me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar en forma voluntaria un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al originalmente presentado, el cual consta de **36** reivindicaciones. Este capítulo tiene como base el originalmente presentado, sobre el cual se han realizado las siguientes modificaciones:
 - (a) Reivindicación 1: En la línea 31, en los sustituyentes R₇ y R₈, se han superpuesto los números 7 y 8 para que dichos sustituyentes queden de la siguiente manera: **R⁷ y R⁸**.



JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.
ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

134
123

- (b) Reivindicación 2: Se ha eliminado la expresión "y es una sal", con lo cual esta reivindicación queda de la siguiente manera: "El proceso de la reivindicación 1 donde dicha sal es una sal tetra (C₁₋₈ alquil) amonio de haluro"; y
- (c) Reivindicaciones 37 a 45: Estas reivindicaciones fueron eliminadas.

En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de ninguna manera el alcance de la presente invención y que el nuevo capítulo modificado es el que debe ser tenido en cuenta en el trámite de Fase Nacional.

4. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (b) Recibo No. 09-13.676, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación;
- (c) Recibo número 09-18.744, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que causa el examen de patentabilidad; y
- (d) Copia de las páginas **33** a **39** que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de **36** reivindicaciones.

5. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215



JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.
ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

NOTARIA 41 DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE CUNDINAMARCA
REPÚBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: [REDACTED] y tarjeta identificada (o) con: [REDACTED] y tarjeta profesional de abogado No. [REDACTED] del Consejo Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella (el) mismo en este escrito.

(Art. 84 C. P. C. Decreto 2282/89 mod. 36)

Bogotá D.C., [REDACTED]

FIRMA DE LA (EL) COMPRENEDIENTE
C.G. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una Solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: **ARENA PHARMACEUTICALS, INC.**,
sociedad existente y organizada de conformidad con
las leyes del Estado de Delaware, USA.

Dirección: 6166 Nancy Ridge Drive San Diego,
California 92121, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: San Diego, Estado de California, USA.

IDENTIFICACION

C.C.

NIT

C.E.

Otro

Número

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 Piso 5°, Bogotá,
Colombia

Teléfono: 3 264270

Fax: 2 126426

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C.

NIT

C.E.

Otro

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

07-077.069

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones al capítulo reivindicatorio.

⑥

Comprobante de pago No. 09 - 13.676

Fecha 19-02-2009

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

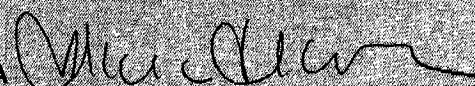
☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

125

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077069- -00004-0000

Fecha: 2009-03-11 16:13:40 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 15

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 13,676
FECHA : FEBRERO 19 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLORED A Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	97134892	19/02/2009	1,790,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	111,000.00
		TOTAL :	\$ 111,000.00

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

139
126

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077069- -00004-0000

Fecha: 2009-03-11 16:13:40 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 15

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 18,744
FECHA : MARZO 9 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	105594204	09/03/2009	9,944,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	112 PTC CAP-1 EXAMEN DE PATENTIBILIDA	452,000.00
TOTAL :			\$ 452,000.00

SON: CUATROCIENTOS CINCUENTA Y DOS MIL PESOS

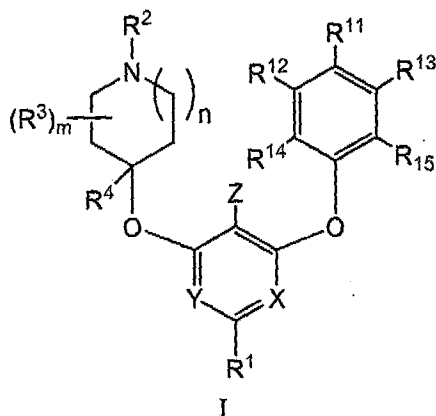
RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

Lo que se reivindica es:

1. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula I:



donde:

X es N o CR⁷;

Y es N o CR⁸;

Z es C₁₋₅ acilo, C₁₋₅ aciloxi, C₂₋₆ alquenilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₈ alquilo, C₁₋₄

alquilcarboxamida, C₂₋₆ alquinilo, C₁₋₄ alquiltiocarboxamida, C₁₋₄ alquilsulfonamida, C₁₋₄ alquilsulfinilo, C₁₋₄ alquilsulfonilo, C₁₋₄ alquiltio, C₁₋₄ alquiltioureilo, C₁₋₄ alquilureilo, amino, C₁₋₂ alquilamino, C₂₋₄ dialquilamino, carbamimidoilo, carbo-C₁₋₆-alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, C₃₋₇ cicloalquilo, C₄₋₈ diacilamino, C₂₋₆ dialquilcarboxamida, C₂₋₆ diaquiltiocarboxamida, C₂₋₆ dialquilsulfonamida, C₂₋₆ dialquilsulfonilamino, formilo, C₁₋₄ haloalcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalquilcarboxamida, C₁₋₄ haloalquilsulfinilo, C₁₋₄ haloalquilsulfonilo, C₁₋₄ haloalquiltio, halógeno, arilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, hidroxilo, hidroxycarbamimidoilo, hidroxilamino, nitro o tetrazolilo; donde dicho C₁₋₈ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo y heterocicloalquilo están cada uno opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3 ó 4 grupos seleccionados entre C₁₋₅ acilo, C₁₋₅ aciloxi, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₇ alquilo, C₁₋₄ alquilcarboxamida, C₁₋₄ alquilsulfonamida, C₁₋₄ alquilsulfinilo, C₁₋₄ alquilsulfonilo, C₁₋₄ alquiltio, C₁₋₄ alquilureilo, amino, C₁₋₂ alquilamino, C₂₋₄ dialquilamino, carbo-C₁₋₆-alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, formilo, C₁₋₄ haloalcoxi, C₁₋₄ haloalquilsulfinilo, C₁₋₄ haloalquilsulfonilo, C₁₋₄ haloalquiltio, halógeno, hidroxilo, hidroxilamino y nitro;

R¹ es H, C₁₋₅ aciloxi, C₂₋₆ alquenilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₈ alquilo, C₁₋₄ alquilcarboxamida, C₂₋₆ alquinilo, C₁₋₄ alquilsulfonamida, C₁₋₄ alquilsulfinilo, C₁₋₄ alquilsulfonilo, C₁₋₄ alquiltio, C₁₋₄ alquilureilo, amino, C₁₋₄ alquilamino, C₂₋₈ dialquilamino, carboxamida, ciano, C₃₋₇ cicloalquilo, C₂₋₆ dialquilcarboxamida, C₂₋₆ dialquilsulfonamida, halógeno, C₁₋₄ haloalcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalquilsulfinilo, C₁₋₄ haloalquilsulfonilo, C₁₋₄ haloalquiltio o hidroxilo;

R² es -R²², -CR²³R²⁴C(O)-R²², -C(O)CR²³R²⁴-R²², -C(O)-R²², -CR²³R²⁴C(O)NR²⁵-R²², -NR²⁵C(O)CR²³R²⁴-R²², -C(O)NR²³-R²², -NR²³C(O)-R²², -C(O)O-R²², -OC(O)-R²², -C(S)-

139
128

R^{22} , $-C(S)NR^{23}-R^{22}$, $-NR^{23}C(S)-R^{22}$, $-C(S)O-R^{22}$, $-OC(S)-R^{22}$, $-CR^{23}R^{24}-R^{22}$ o $-S(O)_2-R^{22}$;

R^3 es C_{1-3} alquilo, C_{1-4} alcoxi, carboxi, ciano, C_{1-3} haloalquilo o halógeno;

R^4 es H, C_{1-8} alquilo o C_{3-7} cicloalquilo, donde dicho C_{1-8} alquilo está opcionalmente sustituido con C_{1-4} alcoxi, C_{3-7} cicloalquilo o heteroarilo;

R^7 y R^8 son cada uno, independientemente, H, C_{1-5} aciloxi, C_{2-6} alquenilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-8} alquilo, C_{1-4} alquilcarboxamida, C_{2-6} alquinilo, C_{1-4} alquilsulfonamida, C_{1-4} alquilsulfinilo, C_{1-4} alquilsulfonilo, C_{1-4} alquiltio, C_{1-4} alquilureilo, amino, C_{1-4} alquilamino, C_{2-8} dialquilamino, carboxamida, ciano, C_{3-7} cicloalquilo, C_{2-6} dialquilcarboxamida, C_{2-6} dialquilsulfonamida, halógeno, C_{1-4} haloalcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalquilsulfinilo, C_{1-4} haloalquilsulfonilo, C_{1-4} haloalquiltio o hidroxilo;

R^{11} es C_{1-5} acilo, C_{1-6} acilsulfonamida, C_{1-5} aciloxi, C_{2-6} alquenilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-8} alquilo, C_{1-4} alquilamino, C_{1-6} alquilcarboxamida, C_{1-4} alquiltiocarboxamida, C_{2-6} alquinilo, C_{1-4} alquilsulfonamida, C_{1-4} alquilsulfinilo, C_{1-4} alquilsulfonilo, C_{1-4} alquiltio, C_{1-4} alquiltioureilo, C_{1-4} alquilureilo, amino, arilsulfonilo, carbamimidoilo, carbo- C_{1-6} -alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, C_{3-7} cicloalquilo, C_{3-7} cicloalquiloxi, C_{2-6} dialquilamino, C_{2-6} dialquilcarboxamida, C_{2-6} dialquiltiocarboxamida, guanidinilo, halógeno, C_{1-4} haloalcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalquilsulfinilo, C_{1-4} haloalquilsulfonilo, C_{1-4} haloalquiltio, heterocicloalquilo, heterocicloalquil-oxi, heterocicloalquilsulfonilo, heterocicloalquil-carbonilo, heteroarilo, heteroarilcarbonilo, hidroxilo, nitro, C_{4-7} oxo-cicloalquilo, fenoxi, fenilo, sulfonamida, ácido sulfónico o tiol; y donde dicho C_{1-5} acilo, C_{1-6} acilsulfonamida, C_{1-4} alcoxi, C_{1-8} alquilo, C_{1-4} alquilamino, C_{1-6} alquilsulfonamida, C_{1-4} alquilsulfonilo, C_{1-4} alquiltio, arilsulfonilo, carbamimidoilo, C_{2-6} dialquilamino, heterocicloalquilo, heterocicloalquil-carbonilo, heteroarilo, fenoxi y fenilo están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre C_{1-5} acilo, C_{1-5} aciloxi, C_{2-6} alquenilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-7} alquilo, C_{1-4} alquilamino, C_{1-4} alquilcarboxamida, C_{2-6} alquinilo, C_{1-4} alquilsulfonamida, C_{1-4} alquilsulfinilo, C_{1-4} alquilsulfonilo, C_{1-4} alquiltio, C_{1-4} alquilureilo, carbo- C_{1-6} -alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, C_{3-7} cicloalquilo, C_{3-7} cicloalquiloxi, C_{2-6} dialquilamino, C_{2-6} dialquilcarboxamida, halógeno, C_{1-4} haloalcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalquilsulfinilo, C_{1-4} haloalquilsulfonilo, C_{1-4} haloalquiltio, heteroarilo, heterociclilo, hidroxilo, nitro, fenilo y fosfonooxi, donde dicho C_{1-7} alquilo y C_{1-4} alquilcarboxamida están opcionalmente sustituidos con 1 a 5 sustituyentes seleccionados entre C_{1-4} alcoxi e hidroxilo;

R^{12} , R^{13} , R^{14} y R^{15} son cada uno, independientemente, H, C_{1-5} acilo, C_{1-5} aciloxi, C_{2-6} alquenilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-8} alquilo, C_{1-4} alquilcarboxamida, C_{2-6} alquinilo, C_{1-4} alquilsulfonamida, C_{1-4} alquilsulfinilo, C_{1-4} alquilsulfonilo, C_{1-4} alquiltio, C_{1-4} alquilureilo, carbo- C_{1-6} -alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, C_{3-7} cicloalquilo, C_{2-6} dialquilcarboxamida, halógeno, C_{1-4} haloalcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalquilsulfinilo, C_{1-4} haloalquilsulfonilo,

148
129

C₁₋₄ haloalquiltio, hidroxilo o nitro;

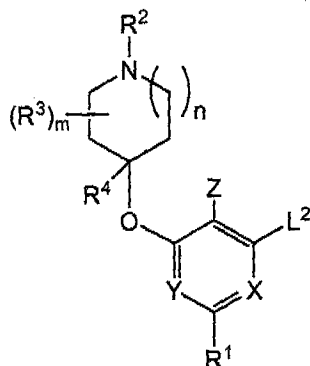
R²² es H, C₁₋₈ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en C₁₋₅ acilo, C₁₋₅ aciloxi, C₂₋₆ alquenoilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₇ alquilo, C₁₋₄ alquilamino, C₁₋₄ alquilcarboxamida, C₁₋₄ alquiltiocarboxamida, C₁₋₄ alquilsulfonamida, C₁₋₄ alquilsulfinilo, C₁₋₄ alquilsulfonilo, C₁₋₄ alquiltio, C₁₋₄ alquiltioureilo, C₁₋₄ alquilureilo, amino, carbo-C₁₋₆-alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, C₃₋₇ cicloalquilo, C₂₋₈ dialquilamino, C₂₋₆ dialquilcarboxamida, C₂₋₆ dialquiltiocarboxamida, C₂₋₆ dialquilsulfonamida, C₁₋₄ alquiltioureilo, C₁₋₄ haloalcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalquilsulfinilo, C₁₋₄ haloalquilsulfonilo, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalquiltio, halógeno, heteroarilo, heterociclilo, hidroxilo, hidroxilamino, nitro, fenilo, fenoxi y ácido sulfónico donde dicho C₁₋₇ alquilo, heteroarilo, fenilo y fenoxi están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en C₁₋₅ acilo, C₁₋₅ aciloxi, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₈ alquilo, C₁₋₄ alquilamino, C₁₋₄ alquilcarboxamida, C₁₋₄ alquiltiocarboxamida, C₁₋₄ alquilsulfonamida, C₁₋₄ alquilsulfinilo, C₁₋₄ alquilsulfonilo, C₁₋₄ alquiltio, C₁₋₄ alquiltioureilo, C₁₋₄ alquilureilo, amino, carbo-C₁₋₆-alcoxi, carboxamida, carboxi, ciano, C₃₋₇ cicloalquilo, C₂₋₈ dialquilamino, C₂₋₆ dialquilcarboxamida, C₂₋₆ dialquiltiocarboxamida, C₂₋₆ dialquilsulfonamida, C₁₋₄ alquiltioureilo, C₁₋₄ haloalcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalquilsulfinilo, C₁₋₄ haloalquilsulfonilo, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalquiltio, halógeno, heterociclilo, hidroxilo, hidroxilamino y nitro;

R²³, R²⁴ y R²⁵ son cada uno, independientemente, H o C₁₋₈ alquilo;

n es 0 ó 1; y

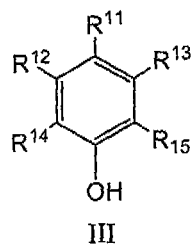
m es 0, 1, 2, 3 ó 4;

donde dicho proceso comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula II:



II

donde L² es un grupo saliente, con el compuesto de fórmula III:



en presencia de una base y una sal, formando de ese modo el compuesto de fórmula I.

- 5 2. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha sal es una sal tetra(C₁₋₈ alquil)amonio de haluro.
3. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha sal es una sal de yoduro de amonio tetrasustituido.
- 10 4. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha sal es un halogenuro de un metal alcalino.
5. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha sal es KI.
6. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha base es una amida de un metal alcalino, un
15 hidruro de un metal alcalino, un carbonato de un metal alcalino o un bicarbonato de un metal alcalino.
7. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha base es K₂CO₃.
- 20 8. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha reacción se lleva a cabo a temperatura elevada.
9. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha reacción se lleva a cabo a una temperatura entre
 aproximadamente 120 °C y aproximadamente 140 °C.
- 25 10. El proceso de la reivindicación 1 donde dicha reacción se lleva a cabo en un disolvente.
11. El proceso de la reivindicación 10 donde dicho disolvente comprende el DMSO.
12. El proceso de la reivindicación 1 donde L² es halo.
- 30 13. El proceso de la reivindicación 1 donde L² es Cl.
14. El proceso de la reivindicación 1 donde tanto X como Y son N.

15. El proceso de la reivindicación 1 donde Z es C₁₋₅ acilo, C₁₋₅ aciloxi, C₂₋₆ alquenilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₈ alquilo, C₂₋₆ alquinilo, formilo, C₁₋₄ haloalcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, halógeno, hidroxilo o nitro.
- 5 16. El proceso de la reivindicación 1 donde Z es metilo.
17. El proceso de la reivindicación 1 donde R¹ es H.
- 10 18. El proceso de la reivindicación 1 donde R² es -C(O)O-R²² y R²² es metilo, etilo, prop-1-ilo o prop-2-ilo.
19. El proceso de la reivindicación 1 donde R² es -C(O)O-R²² y R²² es prop-2-ilo.
- 15 20. El proceso de la reivindicación 1 donde R⁴ es H.
21. El proceso de la reivindicación 1 donde n es 1.
22. El proceso de la reivindicación 1 donde m es 0.
- 20 23. El proceso de la reivindicación 1 donde R¹¹ es C₁₋₄ alquilsulfonilo.
24. El proceso de la reivindicación 1 donde R¹¹ es metilsulfonilo.
- 25 25. El proceso de la reivindicación 1 donde R¹², R¹³, R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno, independientemente, H o halógeno.
26. El proceso de la reivindicación 1 donde R¹⁵ es F.
- 30 27. El proceso de la reivindicación 1 donde R¹¹ es C₁₋₄ alquilsulfonilo; R¹², R¹³ y R¹⁴ son cada uno H; y R¹⁵ es halógeno.
28. El proceso de la reivindicación 1 donde:
X es N;
35 Y es N;
Z es metilo;
R¹ es H;

143
132

R^2 es $-C(O)O-R^{22}$;

R^4 es H;

R^{11} es metilsulfonilo;

R^{12} , R^{13} y R^{14} son cada uno H;

5 R^{15} es F;

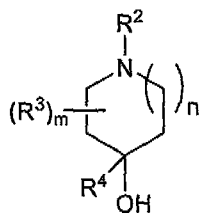
R^{22} es prop-2-ilo;

n es 1; y

m es 0.

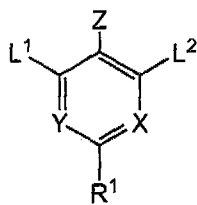
10 29. El proceso de la reivindicación 1 donde dicho compuesto de fórmula II se prepara mediante:

a) la combinación de un compuesto de fórmula IV:



IV

15 con un compuesto de fórmula V:



V

donde L^1 es un grupo saliente, para formar una mezcla; y

b) la adición de una base a dicha mezcla, formando de ese modo el compuesto de fórmula II.

20 30. El proceso de la reivindicación 29 donde dicha base es una sal C_{1-6} alcóxido, una amida de un metal alcalino, un hidruro de un metal alcalino, un carbonato de un metal alcalino o un bicarbonato de un metal alcalino.

25 31. El proceso de la reivindicación 29 donde dicha base es el *t*-butóxido de potasio.

30 32. El proceso de la reivindicación 29 donde dichas combinación y adición se llevan a cabo en un disolvente.

144
133

33. El proceso de la reivindicación 32 donde dicho disolvente comprende el tetrahidrofurano.
34. Los procesos de la reivindicación 29 donde dicha adición se lleva a cabo a una temperatura por debajo de 10° C.
35. El proceso de la reivindicación 29 donde L¹ es halo.
36. El proceso de la reivindicación 29 donde L¹ es Cl.

5