

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

Por la cual se otorga una Patente de Invención

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26
del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 31 de marzo de 2017, con el N° NC2017/0003225, por F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “NUEVOS COMPUESTOS DE 5-AMINO-6H-TIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDIN-2,7-DIONA 3-SUSTITUIDOS PARA EL TRATAMIENTO Y PROFILAXIS DE INFECCIONES VIRALES”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2015/078439 del 3 de diciembre de 2015.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 799 el 19 de julio de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 7890, notificado el 27 de junio de 2018, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2017/0003225 el 7 de noviembre de 2018, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presenta reivindicaciones 1 a 18 que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina “*Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial.*”

SEXTO: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 18 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0003225 del 7 de noviembre de 2018, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior y, en consecuencia, este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

SÉPTIMO: Que el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0003225 del 6 de julio de 2017, solicitó la modificación del título a: “NUEVOS COMPUESTOS DE 5-AMINO-6H-TIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDIN-2,7-DIONA 3-SUSTITUIDOS”, la cual no se acepta porque no divulga de manera completas características funcionales y estructurales de la invención y no permite entender el objeto de la invención. Teniendo en cuenta lo anterior, el título quedará de la siguiente manera: “NUEVOS COMPUESTOS NUCLEOSIDOS DE 5-AMINO-6H-TIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDIN-2,7-DIONA 3-SUSTITUIDOS MODULADORES DE RECEPTORES TIPO TOLL”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE

ARTÍCULO PRIMERO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

“NUEVOS COMPUESTOS NUCLEOSIDOS DE 5-AMINO-6H-TIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDIN-2,7-DIONA 3-SUSTITUIDOS MODULADORES DE RECEPTORES TIPO TOLL”

Clasificación IPC: C07H 19/24, A61K 31/519, A61P 31/12, C07D 513/04.

Reivindicaciones: 1 a 18 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0003225 del 7 de noviembre de 2018, de acuerdo al anexo I.

Titular: F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.

Domicilio: GRENZACHERSTRASSE 124 4070 BASEL SUIZA.

Inventores: Dongdong CHEN, Song FENG, Lu GAO, Baoxia WANG, Chao LI, Lisha WANG, Hongying YUN y Xiufang ZHENG.

Prioridades N° 08/12/2014, CN (REPUBLICA POPULAR DE CHINA), PCT/CN2014/093224 y 14/08/2015, CN (REPUBLICA POPULAR DE CHINA), PCT/CN2015/086987.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2015/078439 **Fecha:** 3 de diciembre de 2015.

Vigente desde: 3 de diciembre de 2015

Hasta: 3 de diciembre de 2035.



**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 11955

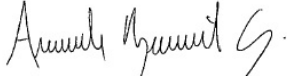
Ref. Expediente N° NC2017/0003225

ARTÍCULO SEGUNDO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, advirtiéndoles que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 6 de mayo de 2019



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

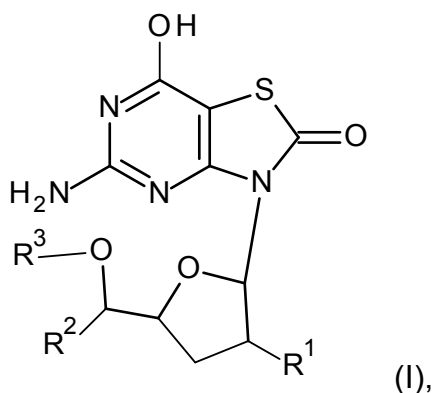
Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

ANEXO I

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de fórmula (I),



en las que

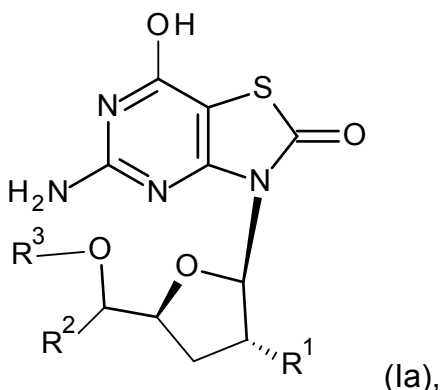
R¹ es hidroxilo, metilo, propilo, fluoroisopropilo, acetiloxi, metilsulfanilo, azido, ciano, alilo, 2-metilalilo, metilsulfonilamino, dimetilamino, acetilamino, pirrolidinilo, morfolinilo o piperidinilo;

R² es hidrógeno, metilo, etilo, propilo, butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, vinilo, alilo, bencilo, etinilo, 1-propinilo, metoximetilo o tiofenilo;

R³ es hidrógeno, acetilo o isobutirilo;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

2. Un compuesto de fórmula (Ia) de acuerdo con la reivindicación 1,



en las que

R¹ es hidroxilo, metilo, propilo, fluoroisopropilo, acetiloxi, metilsulfanilo, azido, ciano, alilo, 2-metilalilo, metilsulfonilamino, dimetilamino, acetilamino, pirrolidinilo, morfolinilo o piperidinilo;

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

R² es hidrógeno, metilo, etilo, propilo, butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, vinilo, alilo, bencilo, etinilo, 1-propinilo, metoximetilo o tiofenilo;

R³ es hidrógeno, acetilo o isobutirilo;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en las que
R¹ es hidroxilo, metilo, propilo, acetiloxi, metilsulfanilo, azido o alilo;
R² es metilo, etilo, propilo, butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, vinilo, alilo, bencilo, etinilo, 1-propinilo, metoximetilo o tiofenilo;
R³ es hidrógeno, acetilo o isobutirilo;
o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.
4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, en las que R¹ es hidroxilo, metilo, n-propilo, metilsulfanilo, azido o alilo.
5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3 o 4, en la que R² es metilo, etilo, n-propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo o 1-propinilo.
6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 3 a 5, en la que R³ es hidrógeno o isobutirilo.
7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 3 a 6, en las que
R¹ es hidroxilo, metilo, propilo, metilsulfanilo, azido o alilo;
R² es metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo o 1-propinilo;
R³ es hidrógeno o isobutirilo;
o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.
8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en las que
R¹ es fluoroisopropilo, metilsulfanilo, ciano, 2-metilalilo, metilsulfonilamino, dimetilamino, acetilamino, pirrolidinilo, morfolinilo o piperidinilo;
R² es hidrógeno;
R³ es hidrógeno;
o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.
9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en las que R¹ es metilsulfanilo o pirrolidinilo.



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 seleccionado entre
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- acetato de [(2*R*,3*R*,5*S*)-2-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-3-ilo];
- acetato de [(1*S*)-1-[(2*S*,4*R*,5*R*)-5-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-4-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]propilo];
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxietil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxibut-3-enil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxipentil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidine-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxibutil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[ciclopentil(hidroxi)metil]-3-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxi-2-fenil-etil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxi-3-metil-butil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[ciclopropil(hidroxi)metil]-3-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- acetato de [(2*S*,4*R*,5*R*)-5-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-4-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]-ciclopropil-metilo];
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxiprop-2-inil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;
- 5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxibut-2-inil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-[hidroxi(2-tienil)metil]tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxi-2-metoxi-etil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(1-hidroxipropil)-3-metilsulfanil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-azido-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxialil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-azido-5-((*S*)-1-hidroxietil)tetrahidrofuran-2-il]-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7(3*H*,6*H*)-diona;

3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-alil-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-2-il]-5-amino-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxipropil]-3-propil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*R*)-1-hidroxipropil]-3-propil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxipropil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxibut-2-inil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(*S*)-ciclopropil(hidroxi)metil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxietil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-pirrolidin-1-il-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

N-[(2*R*,3*R*,5*S*)-2-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-5-(hidroximetil)tetrahidrofuran-3-il]metanosulfonamida;

N-[(2*R*,3*R*,5*S*)-2-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-5-(hidroximetil)tetrahidrofuran-3-il]acetamida;



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-morfolino-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-(1-piperidil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-(dimetilamino)-5-(hidroximetil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

(2*R*,3*S*,5*S*)-2-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-5-
(hidroximetil)tetrahidrofuran-3-carbonitrilo;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-metilsulfanil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-(1-fluoro-1-metil-etil)-5-(hidroximetil)tetrahidrofuran-2-
il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-(2-metilalil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona

y 2-metilpropanoato de [(1*S*)-1-[(2*S*,4*R*,5*R*)-5-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-3-il)-4-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]propilo];

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los
mismos.

11. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10
seleccionado entre

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxibutil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[ciclopropil(hidroxi)metil]-3-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]-
6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxiprop-2-inil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxibut-2-inil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(1-hidroxipropil)-3-metilsulfanil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-azido-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-hidroxi-5-(1-hidroxialil)tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-3-alil-5-(1-hidroxipropil)tetrahidrofuran-2-il]-5-amino-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxipropil]-3-propil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*R*)-1-hidroxipropil]-3-propil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxipropil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxibut-2-inil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-
6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(*S*)-ciclopropil(hidroxi)metil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-
il]-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-[(1*S*)-1-hidroxietil]-3-metil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-pirrolidin-1-il-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

5-amino-3-[(2*R*,3*R*,5*S*)-5-(hidroximetil)-3-metilsulfanil-tetrahidrofuran-2-il]-6*H*-
tiazolo[4,5-*d*]pirimidin-2,7-diona;

y 2-metilpropanoato de [(1*S*)-1-[(2*S*,4*R*,5*R*)-5-(5-amino-2,7-dioxo-6*H*-tiazolo[4,5-*d*]
pirimidin-3-il)-4-hidroxi-tetrahidrofuran-2-il]propilo];

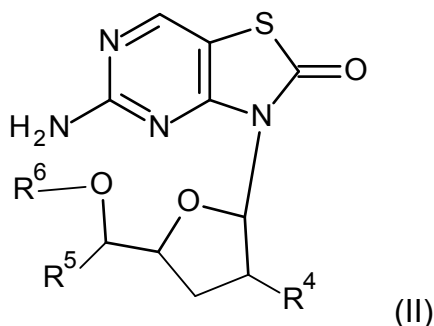
o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los
mismos.

12. Un compuesto de fórmula (II),

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225



en las que

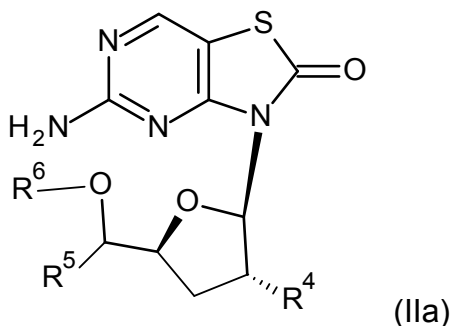
R⁴ es hidroxilo, metilo, n-propilo, fluoroisopropilo, acetiloxi, metilsulfanilo, azido, ciano, alilo, 2-metilalilo, metilsulfonilamino, dimetilamino, acetilamino, pirrolidinilo, morfolinilo o piperidinilo;

R⁵ es hidrógeno, metilo, etilo, propilo, butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, vinilo, alilo, bencilo, etinilo, 1-propinilo, metoximetilo o tiofenilo;

R⁶ es hidrógeno, acetilo o isobutirilo;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

- 13.** Un compuesto de fórmula (IIa) de acuerdo con la reivindicación 12,



en las que

R⁴ es hidroxilo, metilo, n-propilo, fluoroisopropilo, acetiloxi, metilsulfanilo, azido, ciano, alilo, 2-metilalilo, metilsulfonilamino, dimetilamino, acetilamino, pirrolidinilo, morfolinilo o piperidinilo;

R⁵ es hidrógeno, metilo, etilo, propilo, butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, vinilo, alilo, bencilo, etinilo, 1-propinilo, metoximetilo o tiofenilo;

R⁶ es hidrógeno, acetilo o isobutirilo;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

- 14.** Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 12 o 13, en las que
R⁴ es hidroxilo, metilo, propilo, metilsulfanilo, azido o alilo;

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225

R⁵ es metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, vinilo, etinilo o 1-propinilo;

R⁶ es hidrógeno o isobutirilo;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

15. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 12 a 14, en las que

R⁴ es hidroxilo o acetiloxi;

R⁵ es etilo o ciclopropilo;

R⁶ es hidrógeno o acetilo;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

16. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 12 a 15 seleccionado entre

5-amino-3-[(2R,3R,5S)-3-hidroxi-5-(1-hidroxipropil)tetrahydrofuran-2-il]tiazolo[4,5-d]pirimidin-2-ona;

acetato de [(2R,3R,5S)-2-(5-amino-2-oxo-tiazolo[4,5-d]pirimidin-3-il)-5-(1-hidroxipropil)tetrahydrofuran-3-ilo];

acetato de 1-[(2S,4R,5R)-5-(5-amino-2-oxo-tiazolo[4,5-d]pirimidin-3-il)-4-hidroxi-tetrahydrofuran-2-il]propilo;

acetato de [(S)-[(2S,4R,5R)-5-(5-amino-2-oxo-tiazolo[4,5-d]pirimidin-3-il)-4-hidroxi-tetrahydrofuran-2-il]-ciclopropil-metilo];

y 5-amino-3-[(2R,3R,5S)-5-[ciclopropil(hidroxi)metil]-3-hidroxi-tetrahydrofuran-2-il]tiazolo[4,5-d]pirimidin-2-ona;

o una sal, enantiómero o diastereómero farmacéuticamente aceptable de los mismos.

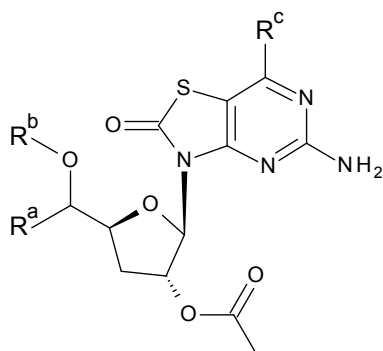
17. Un proceso para la preparación de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 que comprende las siguientes etapas:

(a) la reacción de un compuesto de fórmula (X),

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 11955

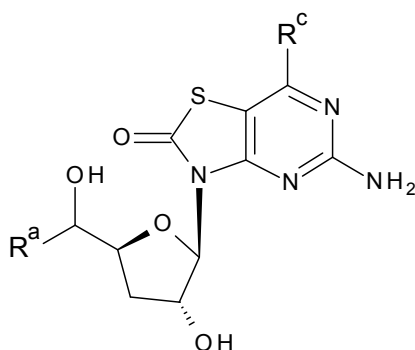
Ref. Expediente N° NC2017/0003225



(X),

con una base o reactivo de fluoruro, en el que R^a es R^2 o R^5 ; R^b es acilo, benzoilo, *terc*-butil(dimetil)sililo o *terc*-butil(difenil)sililo; R^c es hidrógeno o hidroxilo;

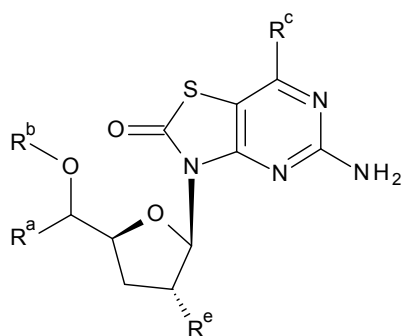
(b) la reacción de un compuesto de fórmula (P1)



(P1),

con un anhídrido ácido o un cloruro ácido, en el que R^a es R^2 o R^5 ; R^c es hidrógeno o hidroxilo;

(c) la reacción de un compuesto de fórmula (XIV),



(XIV),

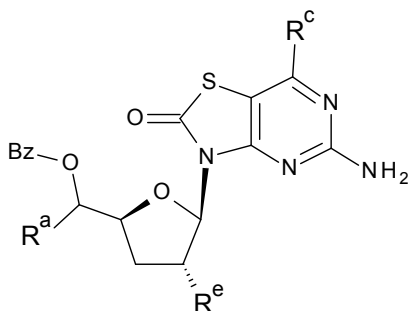
con una base o un reactivo de fluoruro, en el que R^a es R^2 o R^5 ; R^b es acilo, benzoilo o *terc*-butil(difenil)sililo; R^c es hidrógeno o hidroxilo; R^d es trifluorometilsulfonilo o *p*-tolilsulfonilo; R^e es R^1 o R^4 ;

(d) la reacción de un compuesto de fórmula (XXIII),

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

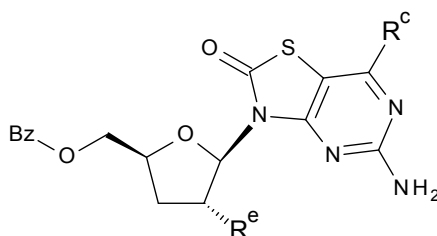
Resolución N° 11955

Ref. Expediente N° NC2017/0003225



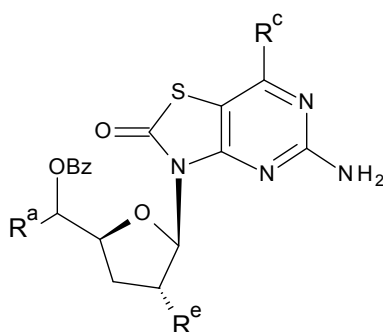
(XXIII),

con una base, en el que R^a es R^2 o R^5 ; R^c es hidrógeno o hidroxilo; R^e es R^1 o R^4 ;
(e) la reacción de un compuesto de fórmula (XXVI),



(XXVI),

con una base, en el que R^c es hidrógeno o hidroxilo; R^e es R^1 o R^4 ;
(f) la reacción de un compuesto de fórmula (XXXI),



(XXXI),

con una base, en el que R^a es R^2 o R^5 ; R^c es hidrógeno o hidroxilo; R^e es R^1 o R^4 ;
o

en el que R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definen en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, 12-15.

- 18.** Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17 y un vehículo terapéuticamente inerte.