

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

Por la cual se otorga una Patente de Invención

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E)

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 24 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 13 de mayo de 2020 con el N° NC2020/0005806, por SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE CICLOBUTAN AMINAS Y AMIDAS ENANTIOMÉRICA Y DIASTEREOMÉRICAMENTE ENRIQUECIDAS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2018/081257 del 14 de noviembre de 2018.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 893 el 29 de mayo de 2020, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio No. 13343 notificado el 26 de agosto de 2022, 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.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2020/0005806 el 22 de noviembre de 2022, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 26 que reemplazan las originalmente presentadas. Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

Que en el presente caso, las reivindicaciones 1 a 26 incluidas en el radicado bajo el N° NC2020/0005806 el 22 de noviembre de 2022 superan las objeciones de Art. 30 D. 486 de emplear términos no concisos, no limitativos, y falta de coherencia en las reivindicaciones dependientes al reclamar materia más amplia que las reivindicaciones independientes, que fueron trasladadas en el Oficio No. 13343 notificado el 26 de agosto de 2022, ya que se han eliminado los términos objetados reclamando las modalidades preferidas en reivindicaciones dependientes, además se han modificado las reivindicaciones independientes de tal manera que el contenido de las reivindicaciones dependientes se encuentra dentro de su alcance.

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.”*

Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 26 incluidas en el radicado bajo el N° NC2020/0005806 el 22 de noviembre de 2022, cumplen los requisitos indicados anteriormente, toda vez que refieren a un proceso para la preparación de ciclobutan



Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

aminas y amidas de fórmulas (V) y (VII) que difiere del estado de la técnica más cercano, US20160157485, en que el compuesto de fórmula (VII) es preparado partiendo de un compuesto de fórmula (I) o (III); en donde se reduce el resto nitrilo del compuesto de fórmula (I) a un aldehído dando el compuesto de fórmula (II), que se hace reaccionar en presencia de un ácido de Lewis para obtener un compuesto de fórmula (III), el cual reacciona con una sal de amonio y H_2 en presencia de un catalizador de metal de transición quiral para obtener una amina de fórmula (IV), que al reaccionar con un compuesto de fórmula (X) forma la amida enantiomérica y diastereoméricamente enriquecida de fórmula (VII). Por otra parte, difiere en que el compuesto de fórmula (V) es preparado a partir del compuesto de fórmula (II) en presencia de un ácido de Lewis seleccionado de $AlCl_3$ y $GaCl_3$, para obtener un compuesto de fórmula (III), que se hace reaccionar con acetonitrilo y un aditivo, en donde el aditivo se selecciona de cloruros de acilo, anhídridos o ésteres, obteniendo el compuesto de fórmula (V). Asimismo, refieren a un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (III) que difiere del estado de la técnica más cercano, Truong, *et al. Tetrahedron: Asymmetry*¹, en que el aldehído de partida, es decir el compuesto de fórmula (II) ya comprende el sustituyente A, el cual reacciona con un ácido de Lewis. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia un proceso para la preparación de ciclobutan aminas y amidas enantiomérica y diastereoméricamente enriquecidas. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 26 cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial establecidos en la normatividad citada en precedencia y esta Oficina encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

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

RESUELVE

ARTÍCULO 1: 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:

“PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE CICLOBUTAN AMINAS Y AMIDAS ENANTIOMÉRICA Y DIASTEREOMÉRICAMENTE ENRIQUECIDAS”

Clasificación IPC: C07C 209/26, C07C 211/40, C07C 45/44, C07C 45/35, C07C 45/54, C07C 49/467, C07D 213/803

Reivindicación(es): 1 a 26 incluidas en el radicado bajo el No NC2020/0005806 el 22 de noviembre de 2022, de acuerdo con el Anexo No. 1

Titular(es): SYNGENTA PARTICIPATIONS AG.

Dirección(es): SCHWARZWALDALLEE 215, BASEL CH-4058 BASEL, SUIZA

¹Molika Truong, Frédéric Lecornué, Antoine Fadel, First synthesis of (1S,2S)- and (1R,2R)-1-amino-2-isopropylcyclobutanecarboxylic acids by asymmetric Strecker reaction from 2-substituted cyclobutanones, *Tetrahedron: Asymmetry*, Vol 14, Issue 8, 2003, Pag. 1063-1072. <https://www.sciencedirect.com/science/article/abs/pii/S0957416603000739>



Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

Inventor(es): Anthony Cornelius O'SULLIVAN, Raphael DUMEUNIER, Tomas SMEJKAL, Brijnandan Premnath MISHRA, Vijayagopal Raman GOPALSAMUTHIRAM, y Edouard GODINEAU.

Prioridad(es) N° 16/11/2017, IN (INDIA), 201711041030.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2018/081257 **Fecha:** 14 de noviembre de 2018.

Vigente desde: 14 de noviembre de 2018

Hasta: 14 de noviembre de 2038.

ARTÍCULO 2: 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 3: Notificar el contenido de la presente resolución a SYNGENTA PARTICIPATIONS AG advirtiéndole 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 30 de enero de 2023

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),



Firmado digitalmente
por: JUAN CAMILO
DURAN TELLEZ
Fecha: 2023.01.30
09:05:44 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

Resolución N° 1858

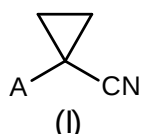
Ref. Expediente N° NC2020/0005806

ANEXO No. 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

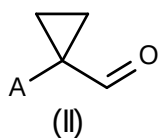
1. Un proceso para la preparación de ciclobutanamidas enantiomérica y diastereoméricamente enriquecidas que comprende

(A) reducir el resto nitrilo de un compuesto de fórmula (I) a un aldehído



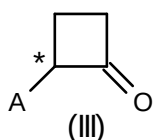
en donde A se selecciona de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆;

en donde la reducción del resto nitrilo del compuesto de fórmula (I) se lleva a cabo a través de hidrogenación parcial al intermedio correspondiente imina aplicando H₂ y un catalizador metálico, seguido de la posterior hidrólisis al compuesto de fórmula (II)



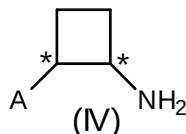
, después

(b) hacer reaccionar el compuesto de fórmula (II) en presencia de un ácido de Lewis para obtener un compuesto de fórmula (III)



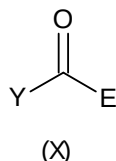
en donde * indica un estereocentro, después

(c) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (III) con una sal de amonio y H₂ en presencia de un catalizador de metal de transición quirral para obtener una amina enantiomérica y diastereoméricamente enriquecida de fórmula (IV)



en donde * indica un estereocentro y después

además haciendo reaccionar la amina de fórmula (IV) con un compuesto de fórmula (X)

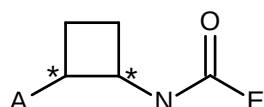


en donde Y es un grupo saliente tales como OH, OR o halógeno, R es alquilo C₁-C₆ y E se selecciona de arilo, heteroarilo, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más

Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

sustituyentes alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆; de tal manera que se forme la amida enantiomérica y diastereoméricamente enriquecida de fórmula (VII)



(VII)

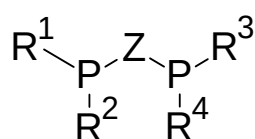
2. El proceso de acuerdo con la reivindicación 1, en donde A y E se seleccionan de arilo y heteroarilo, cuyos arilo y heteroarilo no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.

3. El proceso de acuerdo con la reivindicación 1, en donde A es fenilo y E es heteroarilo, cuyos fenilo y heteroarilo no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.

4. El proceso de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde el compuesto de fórmula (II) se hace reaccionar en la etapa (b) en presencia de un ácido de Lewis seleccionado de AlCl₃ y GaCl₃.

5. El proceso de acuerdo con la reivindicación 4, en donde en la etapa (b) se añaden 1.0-1.5 moles equivalentes de AlCl₃ o GaCl₃ con respecto al compuesto de fórmula (II).

6. El proceso de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde el catalizador de metal de transición quiral en la etapa (c) comprende un metal de transición seleccionado de Ru, Rh, Ir y Pd, y un ligando quiral con un fósforo bidentado de fórmula general (VIII)



(VIII)

en donde Z es un grupo enlazante y R¹, R², R³ y R⁴ se seleccionan independientemente de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₁-C₆, cada uno de los cuales no está sustituido o está sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y halógeno.

7. El proceso de acuerdo con la reivindicación 6, en donde el grupo enlazante Z se selecciona de (R y S)-1,1'-binaftilo, (R y S)-4,4'-bi-1,3-benzodioxol, (R y S)-2,2',6,6'-tetrametoxi-3,3'-bipiridina, (R y S)-6,6'-dimetoxi-1,1'-bifenilo, (R y S)-4,4',6,6'-tetrametoxi-1,1'-bifenilo, 2,2'-bis-[(R y S)-cx-(dimetilamino)bencil]ferroceno, ferrocenil metilo, ferroceno, benceno y etilo.

8. El proceso de acuerdo con la reivindicación 6 o 7, en donde el ligando quiral se selecciona de (R)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo,

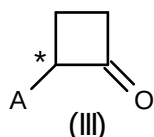
Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

(R)-2,2'-bis(di-*p*-tolilfosfino)-1,1'-binaftilo,
(R)-2,2'-bis[di(3,5-xilil)fosfino]-1,1'-binaftilo,
(R)-5,5'-bis(difenilfosfino)-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(R)-5,5'-bis[di(3,5-xilil)fosfino]-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(R)-5,5'-bis[di(3,5-di-*terc*-butil-4-metoxifenil)fosfino]-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(S)-1,13-bis(difenilfosfino)-7,8-dihidro-6H-dibenzo[f,h][1,5]dioxina,
(R)-2,2',6,6'-tetrametoxi-4,4'-bis(di(3,5-xilil)fosfino)-3,3'-bipiridina,
(R)-2,2'-bis(difenilfosfino)-6,6'-dimetoxi-1,1'-bifenilo,
(R)-2,2'-bis(difenilfosfino)-4,4',6,6'-tetrametoxi-1,1'-bifenilo,
(R)-6,6'-bis(difenilfosfino)-2,2',3,3'-tetrahidro-5,5'-bi-1,4-benzodioxina,
(R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-5,5',6,6',7,7',8,8'-octahidro-1,1'-binaftilo,
(R)-(+)-2,2'-bis(di-3,5-xililfosfino)-5,5',6,6',7,7',8,8'-octahidro-1,1'-binaftilo,
(R)-5,5'-bis(difenilfosfino)-2,2,2',2'-tetrafluoro-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(S)-1-[(S)-1-[di(3,5-xilil)fosfino]etil]-2-[2-[di(3,5-xilil)fosfino]fenil]ferroceno,
y
(S)-1-[(S)-1-[bis[3,5-bis(trifluorometil)fenil]fosfino]etil]-2-[2-(difenilfosfino)fenil]ferroceno.

9. El proceso de acuerdo con la reivindicación 6, en donde el catalizador de metal de transición quiral se selecciona de [RuCl(p-cimeno)((S)-DM-SEGPPOS)]Cl, [RuCl(p-cimeno)((R)-DM-SEGPPOS)]Cl, [NH₂Me₂][(RuCl((R)-xilbinap))₂(u-Cl)₃], [NH₂Me₂][(RuCl((S)-xilbinap))₂(u-Cl)₃], Ru(OAc)₂[(R)-binap], Ru(OAc)₂[(S)-binap], Ru(OAc)₂[(R)-xilbinap], Ru(OAc)₂[(S)-xilbinap], RuCl₂[(R)-xilbinap][(R)-daipeno], RuCl₂[(S)-xilbinap][(S)-daipeno], RuCl₂[(R)-xilbinap][(R,R)-dpeno], y RuCl₂[(S)-xilbinap][(S,S)-dpeno].

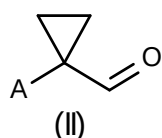
10. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (III)



en donde A se selecciona de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆ y haloalquinilo C₂-C₆,

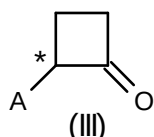
y * indica un estereocentro,

que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)



con un ácido de Lewis.

11. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (III)



en donde A se selecciona de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más

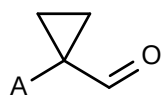
Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆ y haloalquinilo C₂-C₆;

y * indica un estereocentro,

que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)

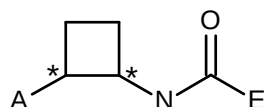


(II)

con un ácido de Lewis seleccionado de AlCl₃ y GaCl₃.

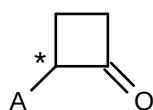
12. El proceso de acuerdo con la reivindicación 11, en donde se añaden 1.0-1.5 moles equivalentes de AlCl₃ o GaCl₃ con respecto al compuesto de fórmula (II).

13. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (VII)



(VII)

que comprende hacer reaccionar el compuesto de fórmula (III)

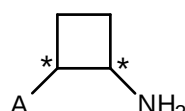


(III)

en donde A se selecciona de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆ y haloalquinilo C₂-C₆;

y * indica un estereocentro,

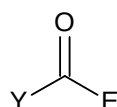
con una sal de amonio y H₂ en presencia de un catalizador de metal de transición quiral, para obtener una amina enantiomérica y diastereoméricamente enriquecida de fórmula (IV)



(IV)

en donde * indica un estereocentro y después

hacer reaccionar además la amina de fórmula (IV) con un compuesto de fórmula (X)



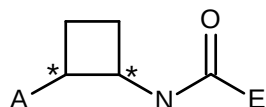
(X)

en donde Y es un grupo saliente tales como OH, OR o halógeno, R es alquilo C₁-C₆ y E se selecciona de arilo, heteroarilo, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆

Resolución N° 1858

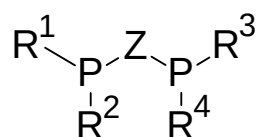
Ref. Expediente N° NC2020/0005806

C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆; de tal manera que se forme la amida enantiomérica y diastereoméricamente enriquecida de fórmula (VII)



(VII)

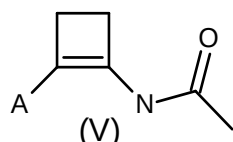
14. El proceso de acuerdo con la reivindicación 13, en donde el catalizador de metal de transición quiral comprende un metal de transición seleccionado de Ru, Rh, Ir y Pd, y un ligando quiral con un fósforo bidentado de fórmula general (VIII)



(VIII)

en donde Z es un grupo enlazante y R¹, R², R³ y R⁴ se seleccionan independientemente de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₁-C₆, cada uno de los cuales no está sustituido o está sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y halógeno.

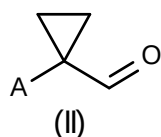
15. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (V)



(V)

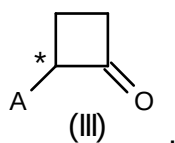
en donde A se selecciona de arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇, cuyos arilo, heteroarilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₇ no están sustituidos o están sustituidos con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆;

que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)



(II)

en presencia de un ácido de Lewis seleccionado de AlCl₃ y GaCl₃, para obtener un compuesto de fórmula (III)



(III)

Resolución N° 1858

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

y hacer reaccionar además el compuesto de fórmula (III) con acetonitrilo y un aditivo, en donde el aditivo se selecciona de cloruros de acilo, anhídridos o ésteres.

16. El proceso de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el grupo saliente Y es cloro.

17. El proceso de acuerdo con la reivindicación 4, en donde el ácido de Lewis es AlCl_3 .

18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6 en donde el metal de transición es Ru.

19. El proceso de acuerdo con la reivindicación 7 en donde el grupo enlazante z es (R y S)-1,1'-binaftilo.

20. El proceso de acuerdo con la reivindicación 11, en donde el ácido de Lewis es AlCl_3 .

21. El proceso de acuerdo con la reivindicación 13 en donde el grupo saliente Y es cloro.

22. El proceso de acuerdo con la reivindicación 15 en donde el ácido de Lewis es AlCl_3 .

23. El proceso de acuerdo con la reivindicación 15, en donde el aditivo se selecciona de cloruro de acetilo, acetato de isopropenilo, cloruro de 4-metoxibenzoilo y anhídrido p-anísico.

24. El proceso de acuerdo con la reivindicación 14, en donde el grupo enlazante Z se selecciona de (R y S)-1,1'-binaftilo, (R y S)-4,4'-bi-1,3-benzodioxol, (R y S)-2,2',6,6'-tetrametoxi-3,3'-bipiridina, (R y S)-6,6'-dimetoxi-1,1'-bifenilo, (R y S)-4,4',6,6'-tetrametoxi-1,1'-bifenilo, 2,2'-bis-[(R y S)-cx-(dimetilamino)bencil]ferroceno, ferrocenil metilo, ferroceno, benceno y etilo.

25. El proceso de acuerdo con la reivindicación 14 o 24, en donde el ligando quiral se selecciona de

(R)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo,
(R)-2,2'-bis(di-*p*-tolilfosfino)-1,1'-binaftilo,
(R)-2,2'-bis[di(3,5-xilil)fosfino]-1,1'-binaftilo,
(R)-5,5'-bis(difenilfosfino)-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(R)-5,5'-bis(di[3,5-xilil]fosfino)-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(R)-5,5'-bis[di(3,5-di-*terc*-butil-4-metoxifenil)fosfino]-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(S)-1,13-bis(difenilfosfino)-7,8-dihidro-6H-dibenzo[f,h][1,5]dioxina,
(R)-2,2',6,6'-tetrametoxi-4,4'-bis(di(3,5-xilil)fosfino)-3,3'-bipiridina,
(R)-2,2'-bis(difenilfosfino)-6,6'-dimetoxi-1,1'-bifenilo,
(R)-2,2'-bis(difenilfosfino)-4,4',6,6'-tetrametoxi-1,1'-bifenilo,
(R)-6,6'-bis(difenilfosfino)-2,2',3,3'-tetrahidro-5,5'-bi-1,4-benzodioxina,
(R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-5,5',6,6',7,7',8,8'-octahidro-1,1'-binaftilo,
(R)-(+)-2,2'-bis(di-3,5-xililfosfino)-5,5',6,6',7,7',8,8'-octahidro-1,1'-binaftilo,
(R)-5,5'-bis(difenilfosfino)-2,2,2',2'-tetrafluoro-4,4'-bi-1,3-benzodioxol,
(S)-1-[(S)-1-[di(3,5-xilil)fosfino]etil]-2-[2-[di(3,5-xilil)fosfino]fenil]ferroceno,
y
(S)-1-[(S)-1-[bis[3,5-bis(trifluorometil)fenil]fosfino]etil]-2-[2-(difenilfosfino)fenil]ferroceno.

26. El proceso de acuerdo con la reivindicación 14, en donde el catalizador de metal de transición quiral se selecciona de $[\text{RuCl}(\text{p-cimeno})((\text{S})\text{-DM-SEGPHOS})]\text{Cl}$, $[\text{RuCl}(\text{p-cimeno})((\text{R})\text{-DM-SEGPHOS})]\text{Cl}$, $[\text{NH}_2\text{Me}_2][(\text{RuCl}((\text{R})\text{-xilbinap}))_2(\text{u-Cl})_3]$, $[\text{NH}_2\text{Me}_2][(\text{RuCl}((\text{S})\text{-xilbinap}))_2(\text{u-Cl})_3]$, $\text{Ru}(\text{OAc})_2[(\text{R})\text{-binap}]$, $\text{Ru}(\text{OAc})_2[(\text{S})\text{-binap}]$, $\text{Ru}(\text{OAc})_2[(\text{R})\text{-xilbinap}]$, $\text{Ru}(\text{OAc})_2[(\text{S})\text{-xilbinap}]$, $\text{RuCl}_2[(\text{R})\text{-xilbinap}][(\text{R})\text{-daipeno}]$,

Resolución N° **1858**

Ref. Expediente N° NC2020/0005806

$\text{RuCl}_2[(S)\text{-xilbinap}][[(S)\text{-daipeno}],$ $\text{RuCl}_2[(R)\text{-xilbinap}][[(R,R)\text{-dpeno}],$ y $\text{RuCl}_2[(S)\text{-xilbinap}][[(S,S)\text{-dpeno}].$

