

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

Por la cual se otorga una Patente de Invención

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

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 4 de marzo de 2022 con el N° NC2022/0002637, por VERTEX PHARMACEUTICALS INCORPORATED, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "PROCESO DE FABRICACIÓN DE MODULADORES DE CFTR", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2020/046116 del 13 de agosto de 2020.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 965 el 21 de junio de 2022, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2022/0002637 el 13 de febrero de 2023, solicitó el reconocimiento de los resultados del examen de patentabilidad efectuado por la Oficina Europea de Patentes (EPO) allegando la documentación correspondiente y dando cumplimiento a los requisitos señalados en el numeral 1.2.2.5.2.1 del título X de la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio No. 9811 de 9 de junio de 2023, 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.

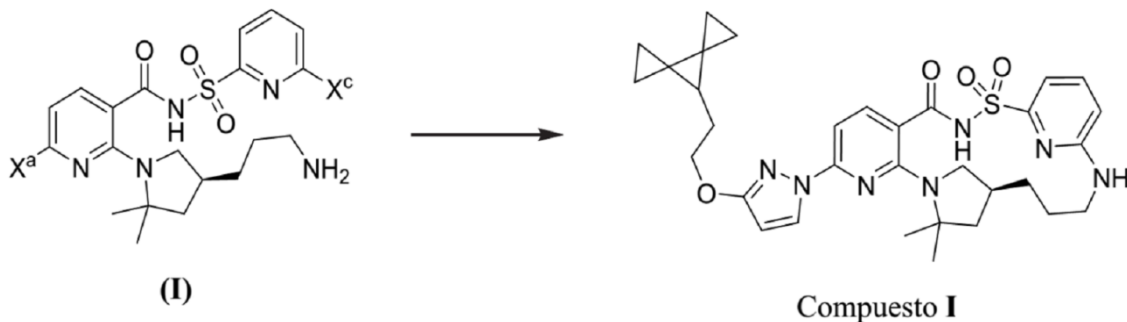
Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2022/0002637 el 26 de octubre de 2023, respondió oportunamente el requerimiento formulado sin presentar nuevo capítulo reivindicatorio. Por lo tanto, se tendrá en cuenta el capítulo reivindicatorio presentado con el radicado N° NC2022/0002637 el 13 de febrero de 2023.

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 37 presentadas en el radicado N° NC2022/0002637 el 13 de febrero de 2023 cumplen los requisitos indicados anteriormente, toda vez que se refieren a un proceso de síntesis de un compuesto modulador de CFTR e intermediarios de síntesis, que difieren de la información del estado de la técnica más cercano WO/2018/107100 en la conversión del intermediario (I) al compuesto de fórmula (I) y su estructura planteada.

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637



Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia un proceso de síntesis mejorado.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 37 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.

Que de acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2022/0002637 el 13 de febrero de 2023 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “PROCESO DE SÍNTESIS DEL COMPUESTO (14S)-8-[3-(2-{DISPIRO[2.0.24.13]HEPTAN-7-IL}ETOXI)-1H-PIRAZOL-1-IL]-12,12-DIMETIL-2λ6-TIA-3,9,11,18,23-PENTAAZATETRACICLO [17.3.1.111,14.05,10] TETRACOSA-(22),5,7,9,19(23),20-HEXAENO-2,2,4-TRIONA MODULADOR DE CFTR Y COMPUESTOS INTERMEDIARIOS”

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

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 DE SÍNTESIS DEL COMPUESTO (14S)-8-[3-(2-{DISPIRO[2.0.24.13]HEPTAN-7-IL}ETOXI)-1H-PIRAZOL-1-IL]-12,12-DIMETIL-2λ6-TIA-3,9,11,18,23-PENTAAZATETRACICLO [17.3.1.111,14.05,10] TETRACOSA-(22),5,7,9,19(23),20-HEXAENO-2,2,4-TRIONA MODULADOR DE CFTR Y COMPUESTOS INTERMEDIARIOS”

Clasificación IPC: C07D 207/08, C07D 207/09, C07D 213/61, C07D 213/62, C07D 213/70, C07D 213/74, C07D 231/20, C07D 401/04, C07D 401/14, C07D 513/22.

Reivindicaciones: 1 a 37 incluidas en el radicado bajo el No NC2022/0002637 el 13 de febrero de 2023, de acuerdo con el Anexo No. 1

Titular: VERTEX PHARMACEUTICALS INCORPORATED.

Dirección: 50 Northern Avenue Boston, Massachusetts 02210, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA.

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

Inventores: Thomas CLEVELAND, FABRICE JEAN DENIS PIERRE, Corey Don ANDERSON, Jeremy J. CLEMENS, Timothy Richard COON, Bryan FRIEMAN, Peter GROOTENHUIS (Fallecido), Sara Sabina HADIDA RUAH, Jason MCCARTNEY, Mark Thomas MILLER, Prasuna PARASELLI, Sara E. SWIFT, Jinglan ZHOU, Paul ANGELL, John E. COCHRAN, Benjamin J. LITTLER, DAVID ANDREW SIESEL, Armando URBINA.

Prioridad N°: 14/08/2019, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/886,660.

Solicitud internacional N°: PCT/US2020/046116 **Fecha:** 13 de agosto de 2020.

Vigente desde: 13 de agosto de 2020

Hasta: 13 de agosto de 2040.

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 VERTEX PHARMACEUTICALS INCORPORATED advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante la 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 26 de abril de 2024

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,

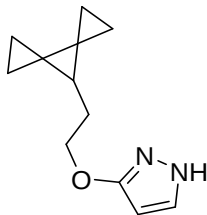


Firmado digitalmente
por: CIELO ELAINNE
RUSINQUE URREGO
Fecha: 2024.04.26
23:02:26 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

- 2) combinar el compuesto de la fórmula (II), o una sal del mismo, con el compuesto 1:



1,

o una sal del mismo,

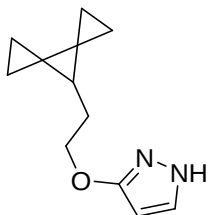
y al menos una segunda base para producir el compuesto I, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,

en donde en el compuesto de la fórmula (II), o una sal del mismo:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R; y

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro.

3. El método de la Reivindicación 1, en donde la conversión del compuesto de la fórmula (I), o una sal del mismo, en el compuesto I, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, comprende combinar el compuesto de la fórmula (I), o una sal del mismo, con el compuesto 1:



1,

o una sal del mismo, y al menos una tercera base para producir el compuesto I, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,

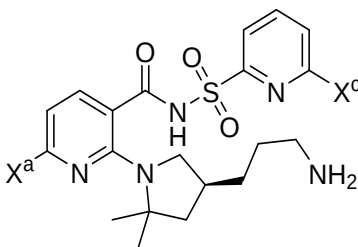
en donde en el compuesto de la fórmula (I), o una sal del mismo:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro; y

X^c se selecciona de F, Cl, Br, e I.

4. El método de la Reivindicación 1, en donde el compuesto de la fórmula (I):

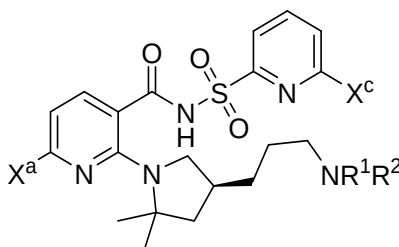


Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

(I),

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión de un compuesto de la fórmula (III):



(III),

o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (I), o una sal del mismo,

en donde en el compuesto de la fórmula (III), o una sal del mismo:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro;

X^c se selecciona de F, Cl, Br, e I; y

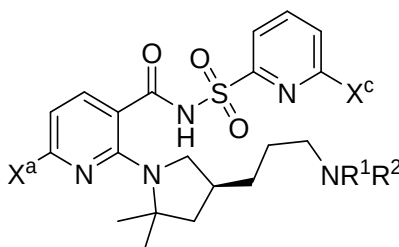
en donde:

R¹ es hidrógeno y R² es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R¹ y R² se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

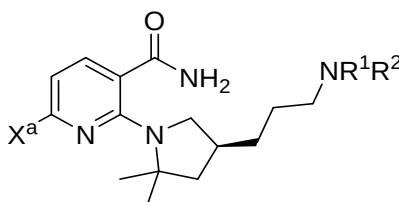
R¹ y R², junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno.

5. El método de la Reivindicación 4, en donde el compuesto de la fórmula (III):



(III),

o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación de un compuesto de la fórmula (IV):

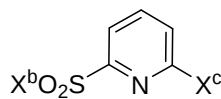


(IV),

o una sal del mismo, con un compuesto de la fórmula (V):

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

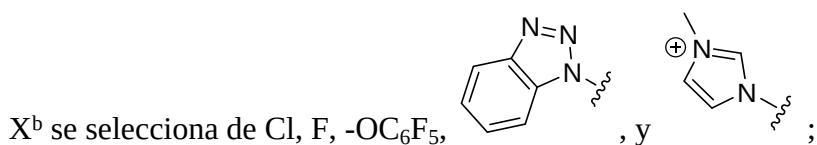


(V),

o una sal del mismo, para producir el compuesto de la fórmula (III), o una sal del mismo, en donde:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro



X^c se selecciona de F, Cl, Br, e I; y

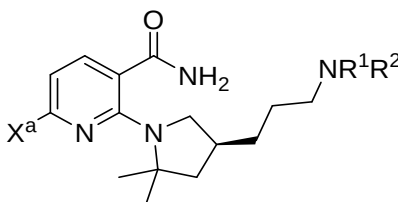
en donde:

R¹ es hidrógeno y R² es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R¹ y R² se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

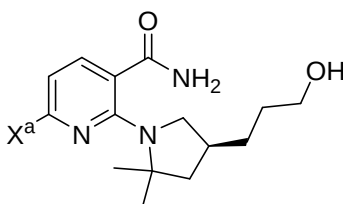
R¹ y R², junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno.

6. El método de la Reivindicación 5, en donde el compuesto de la fórmula (IV):



(IV),

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión de un compuesto de la fórmula (VI):



(VI),

o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (IV), o una sal del mismo,

en donde en el compuesto de la fórmula (VI), o una sal del mismo:

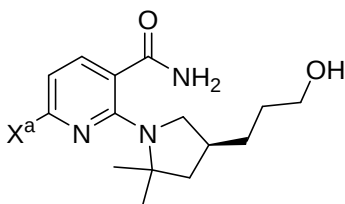
X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R; y

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro.

Resolución N° 21039

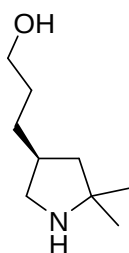
Ref. Expediente N° NC2022/0002637

7. El método de la Reivindicación 6, en donde el compuesto de la fórmula (VI):



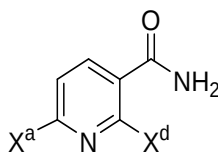
(VI),

o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación del compuesto 2:



2,

o una sal del mismo, con un compuesto de la fórmula (VII):



(VII),

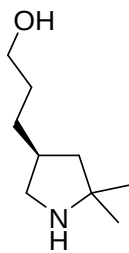
o una sal del mismo, para producir el compuesto de la fórmula (VI), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (VII), o una sal del mismo:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro; y

X^d se selecciona de F, Cl, Br, e I.

8. El método de la Reivindicación 7, en donde el compuesto 2:

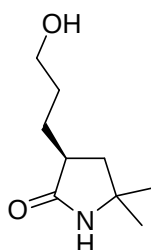


2,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 3:

Resolución N° 21039

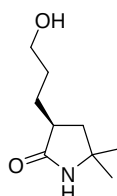
Ref. Expediente N° NC2022/0002637



3,

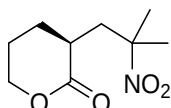
o una sal del mismo, en el compuesto **2**, o una sal del mismo.

9. El método de la Reivindicación 8, en donde el compuesto **3**:



3,

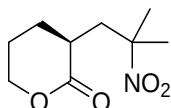
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **4**:



4,

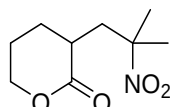
o una sal del mismo, en el compuesto **3**, o una sal del mismo.

10. El método de la Reivindicación 9, en donde el compuesto **4**:



4,

o una sal del mismo, se prepara mediante resolución quiral del compuesto ($\pm$)-**4**:



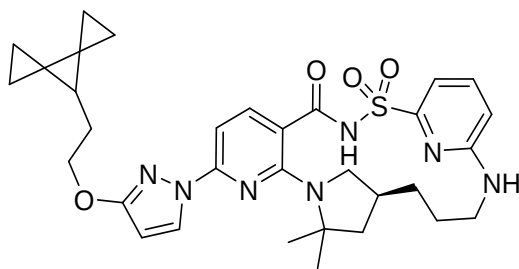
($\pm$)-**4,**

o una sal del mismo.

11. Un método para preparar el compuesto **I**:

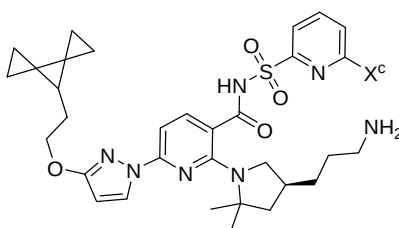
Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637



Compuesto I,

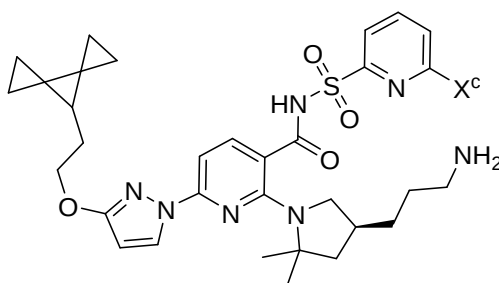
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende convertir un compuesto de la fórmula (VIII):



(VIII),

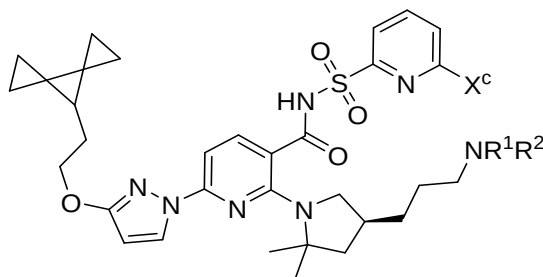
o una sal del mismo, en el compuesto I, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (VIII), o una sal del mismo, X^c se selecciona de F, Cl, Br, e I.

12. El método de la Reivindicación 11, en donde el compuesto de la fórmula (VIII):



(VIII),

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión de un compuesto de la fórmula (IX):



(IX),

o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (VIII), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (IX), o una sal del mismo:

X^c se selecciona de F, Cl, Br, e I; y

en donde:

Resolución N° 21039

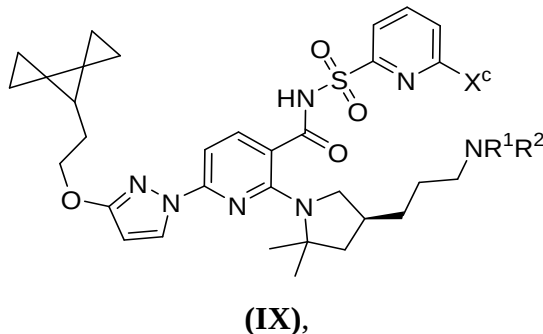
Ref. Expediente N° NC2022/0002637

R^1 es hidrógeno y R^2 es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

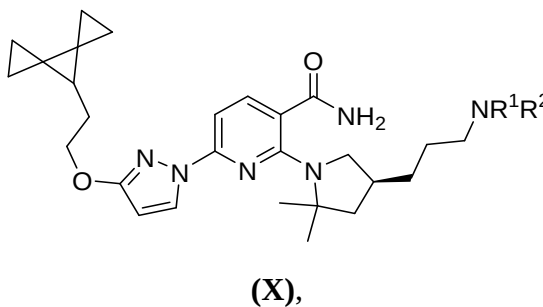
R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

R^1 y R^2 , junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno.

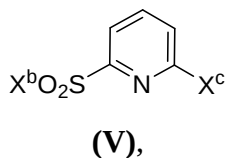
13. El método de la Reivindicación 12, en donde el compuesto de la fórmula (IX):



o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación de un compuesto de la fórmula (X):



o una sal del mismo, con un compuesto de la fórmula (V):

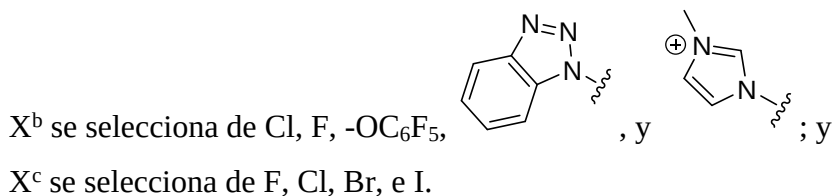


o una sal del mismo, para producir el compuesto de la fórmula (IX), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (X), o una sal del mismo:

R^1 es hidrógeno y R^2 es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

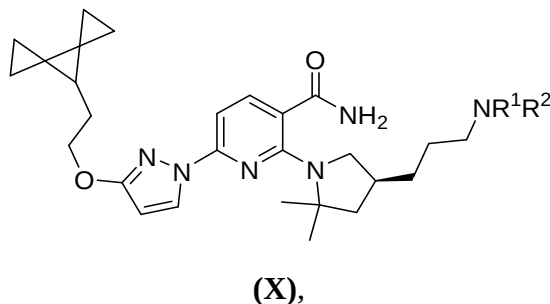
R^1 y R^2 , junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno; y en donde en el compuesto de la fórmula (V), o una sal del mismo:



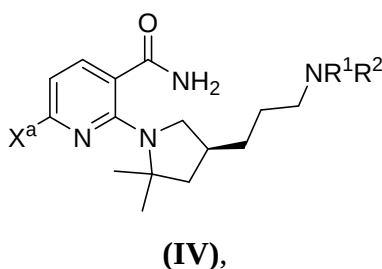
Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

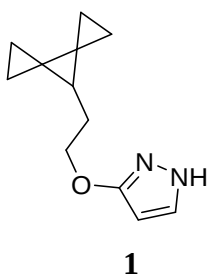
14. El método de la Reivindicación 13, en donde el compuesto de la fórmula (X):



o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación de un compuesto de la fórmula (IV):



o una sal del mismo, con el compuesto 1:



o una sal del mismo, para producir el compuesto de la fórmula (X), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (IV), o una sal del mismo:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro; y

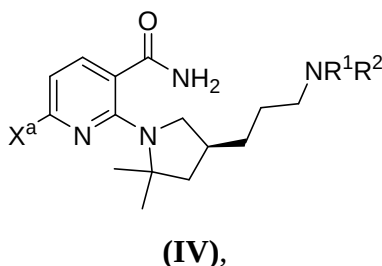
en donde:

R¹ es hidrógeno y R² es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R¹ y R² se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

R¹ y R², junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno.

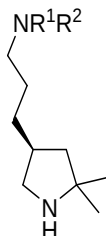
15. El método de la Reivindicación 14, en donde el compuesto de la fórmula (IV):



Resolución N° 21039

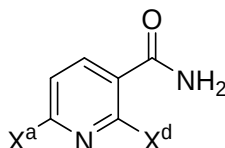
Ref. Expediente N° NC2022/0002637

o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación de un compuesto de la fórmula (XI):



(XI),

o una sal del mismo, con un compuesto de la fórmula (VII):



(VII),

o una sal del mismo, para producir el compuesto de la fórmula (IV), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (XI), o una sal del mismo:

R¹ es hidrógeno y R² es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R¹ y R² se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

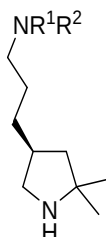
R¹ y R², junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno; y en donde en el compuesto de la fórmula (VII), o una sal del mismo:

Xᵃ se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁-₁₀, -haloalquilo C₁-₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁-₁₀, -haloalquilo C₁-₁₀, halo, o nitro; y

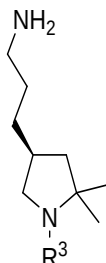
Xᵈ se selecciona de F, Cl, Br, e I.

16. El método de la Reivindicación 15, en donde el compuesto de la fórmula (XI):



(XI),

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión de un compuesto de la fórmula (XII):



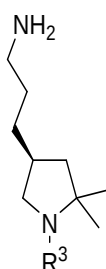
Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

(XII),

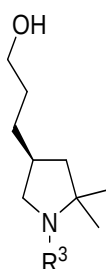
o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XI), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (XII), o una sal del mismo, R³ es un grupo protector de nitrógeno monovalente.

17. El método de la Reivindicación 16, en donde el compuesto de la fórmula (XII):



(XII),

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto de la fórmula (XV):

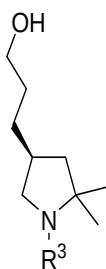


(XV),

o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XII), o una sal del mismo, en donde en el compuesto de la fórmula (XV), o una sal del mismo, R³ es un grupo protector de nitrógeno monovalente.

18. El método de la Reivindicación 17, en donde la conversión del compuesto de la fórmula (XV), o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XII), o una sal del mismo, comprende las etapas de:

1) convertir el compuesto de la fórmula (XV):

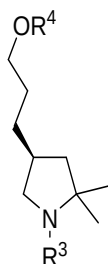


(XV),

o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XIV):

Resolución N° 21039

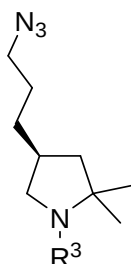
Ref. Expediente N° NC2022/0002637



(XIV),

o una sal del mismo;

2) convertir el compuesto de la fórmula (XIV), o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XIII):



(XIII),

o una sal del mismo; y

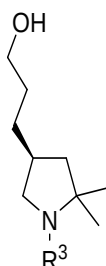
3) convertir el compuesto de la fórmula (XIII), o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XII), o una sal del mismo,

en donde en los compuestos de las fórmulas (XIII)-(XV), o una sal de los mismos, R^3 es un grupo protector de nitrógeno monovalente; y en donde en el compuesto de la fórmula (XIV), o una sal del mismo:

R^4 es $-SO_2R$; y

R se selecciona de -alquilo C_{1-10} , -haloalquilo C_{1-10} , y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C_{1-10} , -haloalquilo C_{1-10} , halo, o nitro.

19. El método de la Reivindicación 18, en donde el compuesto de la fórmula (XV):

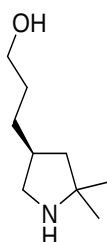


(XV),

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 2:

Resolución N° 21039

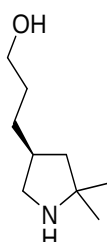
Ref. Expediente N° NC2022/0002637



2,

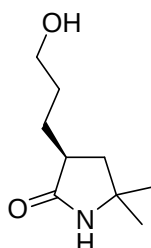
o una sal del mismo, en el compuesto de la fórmula (XV), o una sal del mismo.

20. El método de la Reivindicación 19, en donde el compuesto 2:



2,

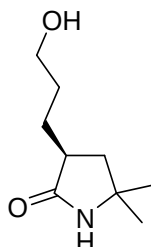
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 3:



3,

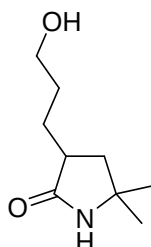
o una sal del mismo, en el compuesto 2, o una sal del mismo.

21. El método de la Reivindicación 20, en donde el compuesto 3:



3,

o una sal del mismo, se prepara mediante resolución quiral del compuesto (±)-3:



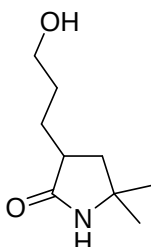
Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

(±)-3,

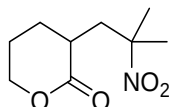
o una sal del mismo.

22. El método de la Reivindicación 21, en donde el compuesto (±)-3:



(±)-3,

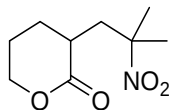
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto (±)-4:



(±)-4,

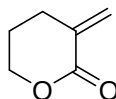
o una sal del mismo, en el compuesto (±)-3, o una sal del mismo.

23. El método de la Reivindicación 22, en donde el compuesto (±)-4:



(±)-4,

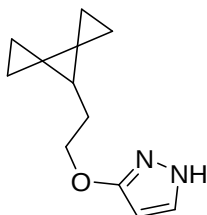
o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación del compuesto 5:



5,

o una sal del mismo, con 2-nitropropano para producir el compuesto (±)-4, o una sal del mismo.

24. El método de la Reivindicación 2, en donde el compuesto 1:

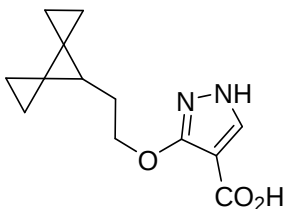


1,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 6:

Resolución N° 21039

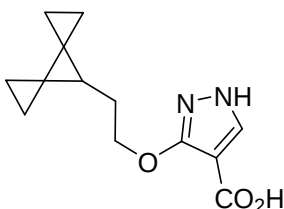
Ref. Expediente N° NC2022/0002637



6,

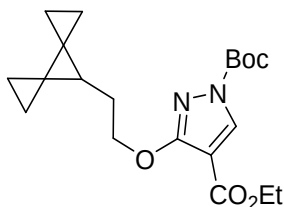
o una sal del mismo, en el compuesto 1, o una sal del mismo.

25. El método de la Reivindicación 24, en donde el compuesto 6:



6,

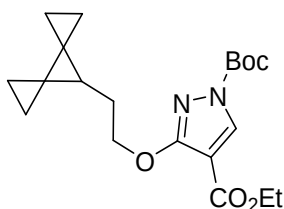
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 7:



7,

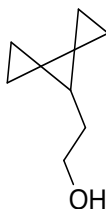
o una sal del mismo, en el compuesto 6, o una sal del mismo.

26. El método de la Reivindicación 25, en donde el compuesto 7:



7,

o una sal del mismo, se prepara mediante la combinación del compuesto 8:

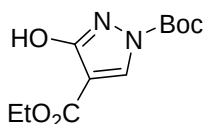


8,

o una sal del mismo, con el compuesto 9:

Resolución N° 21039

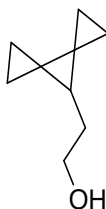
Ref. Expediente N° NC2022/0002637



9,

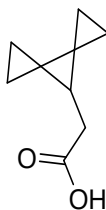
o una sal del mismo, para producir el compuesto 7, o una sal del mismo.

27. El método de la Reivindicación 26, en donde el compuesto 8:



8,

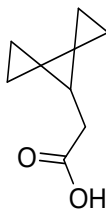
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 10:



10,

o una sal del mismo, en el compuesto 8, o una sal del mismo.

28. El método de la Reivindicación 27, en donde el compuesto 10:



10,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto 11:



11,

o una sal del mismo, en el compuesto 10, o una sal del mismo.

29. El método de la Reivindicación 28, en donde el compuesto 11:

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637



11,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **12**:



12,

o una sal del mismo, en el compuesto **11**, o una sal del mismo.

30. El método de la Reivindicación 29, en donde el compuesto **12**:



12,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **13**:



13,

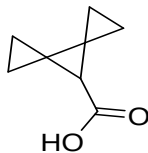
o una sal del mismo, en el compuesto **12**, o una sal del mismo.

31. El método de la Reivindicación 30, en donde el compuesto **13**:



13,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **14**:



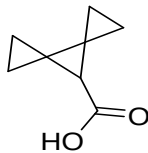
14,

o una sal del mismo, en el compuesto **13**, o una sal del mismo.

Resolución N° 21039

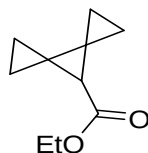
Ref. Expediente N° NC2022/0002637

32. El método de la Reivindicación 31, en donde el compuesto **14**:



14,

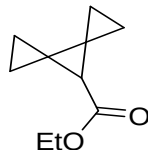
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **15**:



15,

o una sal del mismo, en el compuesto **14**, o una sal del mismo.

33. El método de la Reivindicación 32, en donde el compuesto **15**:



15,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **16**:



16,

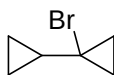
o una sal del mismo, en el compuesto **15**, o una sal del mismo.

34. El método de la Reivindicación 33, en donde el compuesto **16**:



16,

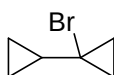
o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **17**:



17,

o una sal del mismo, en el compuesto **16**, o una sal del mismo.

35. El método de la Reivindicación 34, en donde el compuesto **17**:

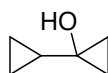


17,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **18**:

Resolución N° 21039

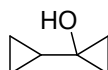
Ref. Expediente N° NC2022/0002637



18,

o una sal del mismo, en el compuesto **17**, o una sal del mismo.

36. El método de la Reivindicación 35, en donde el compuesto **18**:



18,

o una sal del mismo, se prepara mediante la conversión del compuesto **19**:



19,

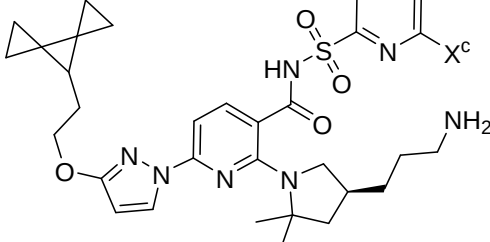
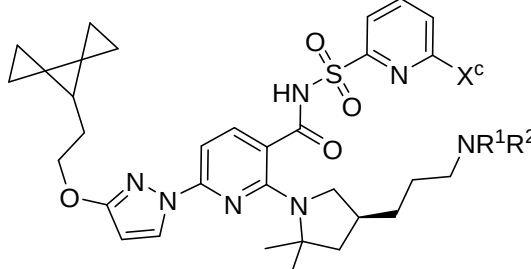
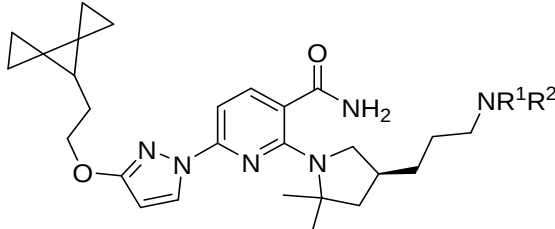
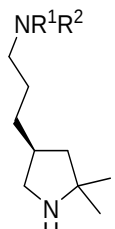
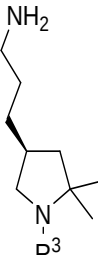
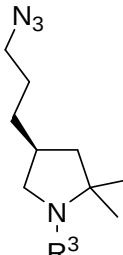
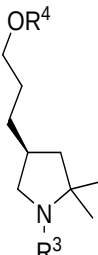
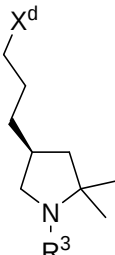
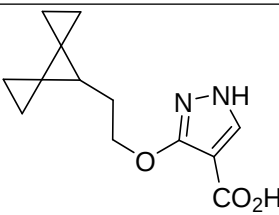
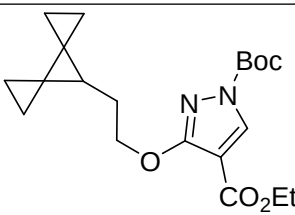
o una sal del mismo, en el compuesto **18**, o una sal del mismo.

37. Un compuesto seleccionado de:

(I),	(II),
(III),	(IV),
(VI),	(VI),

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

 (VIII),	 (IX),
 (X),	 (XI),
 (XII),	 (XIII),
 (XIV),	 (XIVa),
 6, y	 7,

y sales de los mismos,

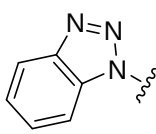
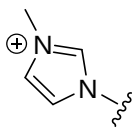
en donde:

X^a se selecciona de F, Cl, Br, I, y -OSO₂R;

R se selecciona de -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C₁₋₁₀, -haloalquilo C₁₋₁₀, halo, o nitro;

Resolución N° 21039

Ref. Expediente N° NC2022/0002637

X^b se selecciona de Cl, F, $-\text{OC}_6\text{F}_5$, , y ;

X^c se selecciona de F, Cl, Br, e I;

X^d se selecciona de F, Cl, Br, e I;

R^3 es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R^4 es $-\text{SO}_2\text{R}$; y

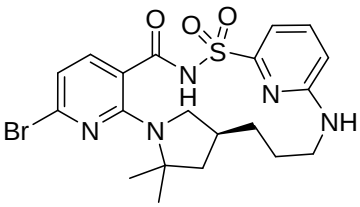
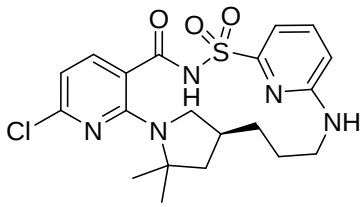
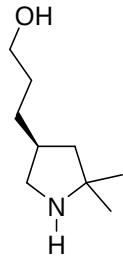
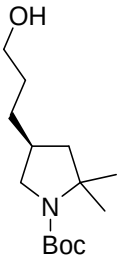
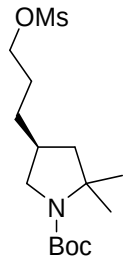
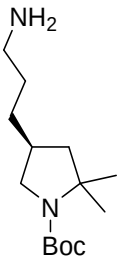
R se selecciona de -alquilo C_{1-10} , -haloalquilo C_{1-10} , y arilo opcionalmente sustituido con -alquilo C_{1-10} , -haloalquilo C_{1-10} , halo, o nitro; y

en donde:

R^1 es hidrógeno y R^2 es un grupo protector de nitrógeno monovalente;

R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de los grupos protectores de nitrógeno monovalentes; o

R^1 y R^2 , junto con los átomos a los que se unen, forman un grupo protector de nitrógeno; y en donde el compuesto no es:

 40,	 41,
 2,	 42,
 43, o	 44,

o una sal del mismo.