PRESENTA OBSERVACIÓN DE TERCEROS

Ref: Solicitud AR 121285 A1 (P210100320).

Buenos Aires, 22 de junio de 2022.-

Señora Presidenta del
Instituto Nacional de la Propiedad Industrial
Dra Mónica Gay
Señor Comisario Administración Nacional de Patentes
Instituto Nacional de la Propiedad Intelectual
Dr. Eduardo Arias.
S / D

DI BELLO, JOSÉ MARÍA, DNI 20.521.423, en mi caracter de Presidente de la Fundación Grupo Efecto Positivo, Nro. de Personería Jurídica 0000627 inscripta en la Inspección General de Justicia con domicilio en calle Alberti 293 5to A de Ciudad Autónoma de Buenos Aires, con el patrocinio letrado de la **Dra. MARÍA LORENA DI GIANO**, abogada, inscripta al T° 060 F° 508 de la CFAMDP, matrícula de Agente INPI PI 2249; venimos a presentar una "Observación de Terceros" art 28 ley 24481, contra la procedencia de la solicitud de patente "N4-HIDROXICITIDINA Y SUS DERIVADOS Y USOS ANTIVIRALES RELACIONADOS CON LA MISMA" fue presentada por EMORY UNIVERSITY en Argentina el 08-02-2021, con fecha de publicación 04-05-2022 y demanda prioridad entre Solicitudes Provisionales Estadounidenses Nos. 62/971.559 (presentada el 07-02-2020), 62/988.133 (presentada el 11-03-2020), 62/994.604 (presentada el 25-03-2020) y 63/006.625 (presentada el 07-04-2020).

1.- Objeto del Llamado de Atención:

Venimos por este medio a solicitar a la **Administración Nacional de Patentes que rechace la solicitud de referencia** atento que como se demostrará más adelante, la materia reivindicada no cumple con los requisitos de patentabilidad, novedad, actividad inventiva como asimismo carece de suficiente claridad y precisión descriptiva y por lo tanto no cumple con las prescripciones de la ley de Patentes de Invención y Modelos de Utilidad Nro. 24.481 y su decreto reglamentario 260/96 conforme arts.4; 12 inc.b punto 3 y art. 20 y razones de hecho de derecho que a continuación se describen.

2.- Urgencia en la resolución de este pedido. Relevancia sanitaria de la droga que se pretende reivindicar:

Venimos a solicitar la URGENTE resolución de la solicitud de patente referenciada ya que se trata de un producto farmacéutico MULNUPINAVIR actualmente aprobada como uso

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

de emergencia para el tratamiento de casos graves de COVID-19 de gran incidencia en la salud pública de la población Argentina.

El COVID-19 es la enfermedad infecciosa causada por el coronavirus SARS- Cov-2 que se ha descubierto a principios del año 2020. Con fecha 11 de marzo de 2020 la Organización Mundial de la Salud declaró al COVID-19 como una pandemia global luego de que el número de personas infectadas se extendiera a mas de 110 países.

El nuevo coronavirus SARS-CoV-2, que provoca la enfermedad COVID-19, continúa extendiéndose por el planeta. El colapso de los sistemas de salud que ha provocado el coronavirus SARS- Cov-2 ha puesto en alerta al mundo entero e impulsó a repensar el rol del Estado. El desafío actual frente a esta pandemia no solo implica asegurar la disponibilidad de salas de emergencia o mejorar condiciones laborales del personal del sector, también es imprescindible garantizar el acceso a medicamentos e insumos como herramientas básicas para tratar la enfermedad.

Será de vital importancia a nivel del país contar con este medicamento en dominio público para que pueda ser producido localmente o bien importado y así garantizar la disponibilidad que garantice el acceso universal para todos los ciudadanos y ciudadanas que no necesiten.

3.- Legitimación-Personería-Oportunidad:

Conforme con el art. 28, último párrafo de la ley 24481 y modif. (T.O Dec. 60/96) "cualquier persona" puede formular observaciones fundadas respecto de una solicitud de patente publicada. Estas observaciones deberán consistir en la falta o insuficiencia de los requisitos legales para su concesión (en la falta de novedad, falta de aplicación industrial, falta de actividad inventiva o ilicitud del objeto de la solicitud).

La Ley de Patentes de Invención otorga legitimación a personas jurídicas para actuar en defensa de derechos e intereses colectivos y difusos, como es el caso de la organización oponente.

La legitimación para presentar el presente llamado de atención surge del estatuto de la organización presentante (que se acompaña con la presente) y se agrega además que la Fundación Grupo Efecto Positivo tiene amplia experiencia en el área del acceso a medicamentos en la región Latinoamericana y principalmente trabaja en promover y garantizar que las personas que viven con vih/sida accedan a tratamientos asequibles y de calidad.

Fundación Grupo Efecto Positivo (Fundación GEP), es una organización civil sin fines de lucro, con Nro. de Personería Jurídica 0000627 inscrita en la Inspección General de Justicia, del Ministerio de Justicia y Derechos Humanos de la Nación Argentina. Los objetivos de la fundación son: 1. Contribuir a reducir el riesgo de transmisión del vih y otras enfermedades de transmisión genital desde una perspectiva de salud integral, respetando el

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C.A.M.D.P.
Tº 060 Fº 508 C.F.A.M.D.P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

enfoque de género y en el marco de los Derechos Humanos; 2. Incidir en el ámbito político para mejorar la calidad de vida de las personas con vih; 3. Promover el debido ejercicio de los Derechos Humanos de las personas con vih y otras personas afectadas; 4. Promover la inclusión social de las personas más vulnerables al vih y al sida; 5. Reducir el estigma y la discriminación asociados con el vih-sida; 6. Promover el acceso a la información, a los insumos de prevención y tratamiento del vih, y sus coinfecciones; y 7. Contribuir a mejorar la adherencia a los tratamientos del vih y co-infecciones, infecciones concomitantes, y otras infecciones de transmisión genital. 8. Promover y garantizar el acceso a medicamentos y tratamientos asequibles y de calidad.www.redlam.org.

4.- Fundamentos químicos del Llamado de Atención:

La presente divulgación se relaciona con composiciones farmacéuticas comprendiendo ciertos derivados de N4-hidroxicitidina, y métodos relacionados con los mismos, en particular se refiere al tratamiento o profilaxis del coronavirus humano 2019-nCoV/SARS-CoV-2.

A) Consideraciones iniciales:

La presente solicitud pretende proteger composiciones farmacéuticas comprendiendo derivados de N4-hidroxicitidina (o EIDD-1931) para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 y métodos de tratamiento o prevención de esta. Los compuestos incluyen compuestos de Fórmulas Markush (I-VI, VIa-f, VII-XVIII, XIX, XXI) y compuestos seleccionados entre EIDD-1931, EIDD-2801, EIDD-2800 o EIDD-2898. EIDD-2801 es también conocido como Molnupiravir (o MK-4482).

Molnupiravir es una prodroga o profármaco del análogo de nucleósido denominado N4-hidroxicitidina (también llamado EIDD-1931), cuyo mecanismo de acción se basa en la introducción de errores en el genoma viral conduciendo a la mutagénesis letal. EIDD-1931 fue descripto por primera vez en el año 1980 como potente mutágeno en bacterias[1] y bacteriofagos[2]. La actividad antiviral de amplio espectro del compuesto ha sido ampliamente

[1] Salganik RE, Vasjunina EA, Poslovina AS, Andreeva ES. Mutagenic action of *N*4-hydroxycytidine on *Escherichia coli* B cyt- Mutat Res, 20 1973, pp. 1-5
Popowska E, Janion C. N4-hydroxycytidine-a new mutagen of a base analogue type. Biochem Biophys Res Commun. 1974 Jan 23;56(2):459-66. doi: 10.1016/0006-291x(74)90864-x.
[2] Janion C, Kajtaniak E. Mutagenesis induced in amber P22 phages by base analogues. Mutat Res. 1979 Aug;62(1):191-5. doi: 10.1016/0027-5107(79)90232-x.

Mag. M. Lodeda Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 090 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

divulgada desde entonces contra varios tipos de virus de RNA, incluyendo Coronavirus[3].

De la misma forma que otros análogos de nucleósidos, Molnupiravir ejerce su acción sobre la enzima RNA-polimerasa dependiente de RNA (RdRp). El mecanismo de acción del Molnupiravir incluye su conversión a EIDD-1931 en el cuerpo y su posterior fosforilación por quinasas celulares para adquirir su forma activa, denominada EIDD-1931-trifosfato (Figura 1). Luego, EIDD-1931-trifosfato actúa como un sustrato alternativo/competitivo de la enzima RdRp del virus, generando una acumulación de mutaciones en las copias virales[4].

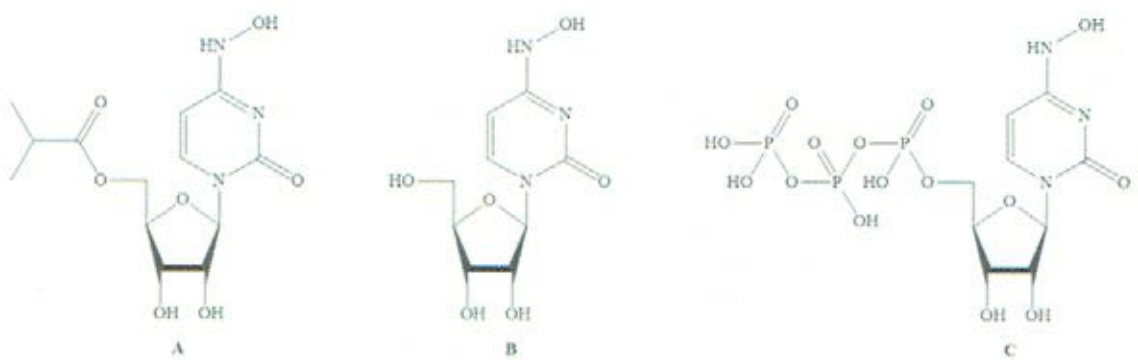


Figura 1 – (A) Molnupiravir; (B) EIDD-1931 o *N4*-hidroxicitidina (C) EIDD-1931-trifosfato o EIDD-2016

La solicitud cuenta con **77 reivindicaciones** (rvs., ver Anexo I), a continuación se presenta un resumen de las mismas:

TIPO DE PROTECCIÓN	RVS.	DETALLES
Composición para el tratamiento de una infección viral	1-3; 6,7	Una composición para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 que comprende compuestos de **Fórmula XXI** (Markush); o compuestos seleccionados EIDD-1931 (rv. 2), EIDD-2801 (**Molnupiravir**) (rv. 3); EIDD-2800 (rv, 6); EIDD-2898 (rv. 7).
Composición para el tratamiento de una enfermedad	4-5	Una composición para el tratamiento de la COVID-19 que comprende a los compuestos EIDD-1931 (rv. 4) o EIDD-2801 (**Molnupiravir**) (rv. 5).

[3] M. L. Agostini, A. J. Pruijssers, J. D. Chappell, et al. Small-molecule antiviral β-D-*N*4-hydroxycytidine inhibits a proofreading-intact coronavirus with a high genetic barrier to resistance. *J. Virol.* **93**, e01348-19 (2019).

[4] Imran, M., Kumar Arora, M., Asdaq, S., et al. (2021). Discovery, Development, and Patent Trends on Molnupiravir: A Prospective Oral Treatment for COVID-19. *Molecules (Basel, Switzerland)*, *26*(19), 5795. https://doi.org/10.3390/molecules26195795

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Composición para el tratamiento de una infección viral	8-41	Una composición para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 que comprende compuestos de **Fórmulas Markush I-VI, VIa-f, VII-XVIII, XIX**; sustituciones de la Fórmula I y compuestos seleccionados (rvs 9-16, dependientes de 8); sustituciones de la Fórmula II (rvs. 18 y 19, dependientes de la rv. 17); sustituciones de la Fórmula III (rv. 21, dependientes de la rv. 20); compuestos seleccionados de la Fórmula VI (rv. 26 dependiente de 24) y sustituciones de la misma (rv. 41 dependiente de rvs. 24 y 25); sustituciones de la Fórmula XIX (rvs. 39, dependiente de la rv. 38); sustituciones de cualquiera de las Fórmulas II-XIX (rv. 40, dependientes de las rvs. 8, 11, 12, 17-23, 26-38)
Composición (combinación)	57, 58	Una composición de acuerdo con cualquiera de las rvs. 1-43, que comprende además uno o más agentes antivirales.
Composición para el tratamiento de una infección viral (combinación)	59-62; 71-72	Una composición para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 que comprende los siguientes compuestos en **combinación con otros antivirales**: EIDD-1931 (rvs 59, 60); EIDD-2801 (rvs 61, 62); EIDD-2898 (rv 71) y EIDD-2800 (rv 72).
Composición para el tratamiento de una enfermedad (combinación)	63-66	Una composición para el tratamiento de la COVID-19 que comprende los siguientes compuestos en **combinación con otros antivirales**: EIDD-1931 (63, 64); EIDD-2801 (rvs 65, 66)
Composición	42-43	La composición de cualquier de las rvs. 1-41, que comprende además un propelente (aire comprimido, etanol, nitrógeno, dióxido de carbono, óxido nitroso, hidrofluoroalcanos (HFA), 1,1,1,2,-tetrafluoroetano, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano o combinaciones de los mismos).
Recipiente que comprende una composición	44-45	Un recipiente presurizado (pulverizador de bomba manual, inhalador, inhalador dosificado por medidor, inhalador de polvo seco, nebulizador, nebulizador de malla vibratoria, nebulizador de chorro o nebulizador de ondas ultrasónicas) que comprende una composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las rvs. 1-41.
Método de tratamiento	46, 49-50, 74-75	Un método para el tratamiento o prevención de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, con los compuestos de las rvs. 1-43 (rv. 46), compuesto EIDD-2800 (rv. 49), EIDD-2898 (rv. 50), EIDD-2801 (rv. 74) or EIDD-1931 (rv. 75).

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. B.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Método de tratamiento	47-48, 67-68	Un método para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, con los compuestos EIDD-1931 (rv. 47) y en combinación con otros compuestos antivirales (rv. 67), EIDD-2801 (rv. 48) y en combinación con otros compuestos antivirales (rv. 68),
Método de tratamiento	51-52; 69-70	Un método para el tratamiento de la COVID con los compuestos EIDD-1931 (rv. 51) o EIDD-2801 (rv. 52) **solos o en combinación** con otros compuestos antivirales (rvs. 69, 70)
Método de tratamiento	53, 54	Un método para la prevención de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 con los compuestos EIDD-1931 (rv. 53) y EIDD-2801 (rv. 54)
Método de tratamiento	55, 56	Un método para la prevención de la COVID-19 con los compuestos EIDD-1931 (rv. 55) y EIDD-2801 (rv. 56)
Método de tratamiento	73	Un método para el tratamiento o prevención de las infecciones causadas por 2019-nCoV/SARS-CoV-2 que comprende administrar una combinación de acuerdo a las rvs. 57-65 o 71-72.
Método de tratamiento	76-77	Un método para tratar una infección viral del SNC en un paciente, con la composición de las rvs. 1-43, 57-65 o 71-72.

La presente solicitud hace referencia a composiciones farmacéuticas y métodos de tratamiento que comprenden a EIDD-1931 y sus respectivas prodrogas. Según las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas", (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 546/2012, Anexo punto 3, viii): *(viii) Profármacos: Existen compuestos inactivos denominados "profármacos" (o "prodrogas") que cuando se hidrolizan o metabolizan en el organismo, pueden dar origen al principio terapéuticamente activo. En algunos casos, las reivindicaciones de patentes protegen la droga y su/s profármaco/s. Un profármaco podría producir beneficios si puede ser administrado con mayor facilidad que el compuesto activo. Las patentes sobre profármacos, si se conceden, deben excluir de la reivindicación al principio activo como tal, si éste ya fue divulgado o si es no patentable. Como todo objeto reivindicado en una patente, un profármaco debe estar respaldado de manera suficiente por la información provista en la memoria descriptiva. Debe cumplir con los requisitos de novedad, actividad inventiva y aplicación industrial y una descripción del mejor método de obtención con una caracterización suficiente del producto obtenido. Además, deberá constar en la solicitud evidencia de que el profármaco es inactivo o menos activo que el compuesto originado, que la generación del compuesto*

Ma. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 503 C. F. A. M. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

activo (en el organismo) asegura un nivel eficaz del mismo, además de minimizar el metabolismo directo del profármaco." En este sentido, las prodrogas de la presente solicitud no cumplen con los requisitos de patentabilidad, y tampoco se excluye de las reivindicaciones al principio activo como tal.

El artículo 4 de la Ley 24.481 que establece que: *"Serán patentables las invenciones de productos o de procedimientos, siempre que sean nuevas, entrañen una actividad inventiva y sean susceptibles de aplicación industrial:*

a) A los efectos de esta ley se considerará invención a toda creación humana que permita transformar materia o energía para su aprovechamiento por el hombre.

b) Asimismo, será considerada novedosa toda invención que no esté comprendida en el estado de la técnica.

c) Por estado de la técnica deberá entenderse el conjunto de conocimientos técnicos que se han hecho públicos antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida, mediante una descripción oral o escrita, por la explotación o por cualquier otro medio de difusión o información, en el país o en el extranjero.

d) Habrá actividad inventiva cuando el proceso creativo o sus resultados no se deduzcan del estado de la técnica en forma evidente para una persona normalmente versada en la materia técnica correspondiente

e) Habrá aplicación industrial cuando el objeto de la invención conduzca a la obtención de un producto industrial, entendiendo al término industria como comprensivo de la agricultura, la industria forestal, la ganadería, la pesca, la minería, las industrias de transformación propiamente dichas y los servicios."

Las reivindicaciones **1-45, 57-66 y 71-72** se refieren a composiciones farmacéuticas para tratar infecciones por 2019nCoV/SARS-CoV-2 (o COVID-19) que comprenden el compuesto N4-hidroxicitidina o sus derivados. Las pautas para examinar patentes establecen que *"Las técnicas de formulación y el conjunto de componentes que se pueden utilizar para desarrollar productos farmacéuticos en sus diferentes formas, son elementos bien conocidos para una persona capacitada en la técnica. (...) Las formulaciones y composiciones nuevas como también los procesos para su preparación se deben considerar por regla general obvios teniendo en cuenta el arte previo. La misma regla se aplica en relación con composiciones o formulaciones relacionadas con polimorfos"* (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 542/2012, Anexo punto 4, ix).

Las reivindicaciones **46-56, 67-70 y 73-77** son reivindicaciones de métodos de tratamiento médico aplicados a un humano que así lo necesite. Resulta pertinente aclarar

Mg. M. Luisa di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

que, los métodos terapéuticos están expresamente excluidos y no se consideran invenciones de conformidad con el artículo 6 de la Ley 24.281 que expresa: *"No se considerarán invenciones para los efectos de esta Ley:..e) Los métodos de tratamiento quirúrgico, terapéutico o de diagnóstico aplicables al cuerpo humano*". A su vez, los métodos terapéuticos carecen del requisito de aplicación industrial, por lo que no puede ser protegido por una patente, tal como lo establece el artículo 4 de la Ley 24.281, inciso e).

Como será demostrado en detalle en los fundamentos para el rechazo de cada reivindicación en particular, las composiciones farmacéuticas y los métodos de tratamiento reivindicados no cumplen con los requisitos de novedad, actividad inventiva y aplicación industrial establecidos en el art 4 de la Ley 24.481, necesarios para su patentabilidad. De modo importante, las rvs. no definen el objeto para el que se solicita protección de forma clara, ni presentan suficiencia descriptiva de acuerdo a los artículos 20 y 22 de la Ley 24.481.

Por lo tanto, con las bases del presente análisis, se sugiere el rechazo de la solicitud (la totalidad de sus rvs.) por lesionar lo establecido en los art. 4, 6, 20 y 22 de la Ley 24.481.

El presente análisis se acompaña de los siguientes documentos respaldatorios:

- **D1: WO2019/113462 "N4-hydroxycytidine and derivatives and anti-viral uses related thereto" Fecha de publicación 13-06-2019.**
  La solicitud de patente se refiere a derivados de N4-hidroxicitidina, composiciones farmacéuticas que los comprenden, y métodos de tratamiento. Particularmente se refiere a métodos de tratamiento o profilaxis de infecciones virales, tales como encefalitis equina del este, oeste y venezolana, fiebre de Chikungunya, Ébola, Influenza, RSV, virus del Zika virus y coronavirus.
  D1 divulga los mismos compuestos que la presente solicitud (Fórmula Markush y compuestos seleccionados) para tratar infecciones virales, incluyendo coronavirus. Así como composiciones farmacéuticas que los comprenden.

- **D2: WO2016/106050A1 "N4-hydroxycytidine and derivatives and anti-viral uses related thereto" Fecha de publicación 30-06-2016.**
  La solicitud de patente divulga al compuesto N4-hidroxicitidina y derivados del mismo, composiciones farmacéuticas y métodos para prevenir o tratar infecciones virales.

- **D3: Rowe, RC; Sheskey, PJ; Owen, SC (Eds.). Handbook of Pharmaceutical Excipients. 5th Edition, Pharmaceutical Press and American Pharmacists Association, 2006.**

Dra. M. Lorena Di Chiano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

El manual es una guía detallada de los usos, propiedades y aspectos de seguridad de distintos excipientes farmacéuticos. En particular, provee monografías de excipientes que son normalmente utilizados en distintas formas farmacéuticas. Además, describe diferentes aspectos de las propiedades físicas así como de sus posibles aplicaciones, con el objetivo de brindar información al potencial formulador acerca de los materiales disponibles para desarrollar una nueva forma farmacéutica. En general, varios de los excipientes que se describen han sido utilizados con propósitos similares pero en diversas formas de dosificación.

- **D4: Pilcer, G., & Amighi, K.. Formulation strategy and use of excipients in pulmonary drug delivery. *International journal of pharmaceutics*, 392(1-2), 1-19, 2010.**
  Este artículo de revisión discute los enfoques y excipientes utilizados para el desarrollo de formulaciones de ingredientes farmacéuticamente activos (API) para administración pulmonar. Describe los diferentes sistemas de inhalación y dispositivos relacionados, así como los excipientes utilizados y las técnicas para obtener el API en partículas específicas adecuadas para la formulación.

- **D5: Barnard, D. L.et al. (2004). Inhibition of severe acute respiratory syndrome-associated coronavirus (SARSCoV) by calpain inhibitors and β-D-N4-hydroxycytidine. *Antiviral Chemistry and Chemotherapy,* 15(1), 15-22.**
  Este artículo original demuestra la actividad antiviral *in vitro* de diversos compuestos, incluyendo EIDD-1931 (o N4-hidroxicitidina), contra SARS-CoV.

- **D6: Agostini ML, Pruijssers AJ, Chappell JD, et al. Small-Molecule Antiviral β-d-*N*4-Hydroxycytidine Inhibits a Proofreading-Intact Coronavirus with a High Genetic Barrier to Resistance. J Virol. 2019 Nov 26;93(24):e01348-19. doi: 10.1128/JVI.01348-19. PMID: 31578288; PMCID: PMC6880162.**
  Este artículo original demuestra la actividad antiviral *in vitro* de EIDD-1931 (N4-hidroxicitidina, NHC) contra el virus de la hepatitis viral murina (MHV) y Síndrome respiratorio por coronavirus de Oriente Medio (MERS-CoV), dos coronavirus genéticamente divergentes. El trabajo señala la relevancia de este compuesto como un compuesto antiviral de amplio espectro para tratar infecciones causadas por coronavirus.

B) Análisis de las reivindicaciones. Fundamentación para su rechazo

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

1. COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS PARA EL TRATAMIENTO DE UNA INFECCIÓN VIRAL (2019nCoV/SARS-CoV-2) O DE UNA ENFERMEDAD (COVID-19) (Reivindicaciones 1-41).

Las reivindicaciones 1-41 se refieren a una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 (rvs. 1-3, 6-41), o bien para el tratamiento de la COVID-19 (rvs. 4-5), que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de Fórmula Markush I-VI, VIa-f, VII-XVIII, XIX o XXI; o un compuesto seleccionado entre EIDD-1931, EIDD-2801; EIDD-2800 o EIDD-2898.

Las reivindicaciones están redactadas de manera que pretenden proteger tanto a un producto (composición) como a su indicación médica (tratamiento de una infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 o de COVID-19). De está forma, las reivindicaciones no son claras en cuanto al objeto que se pretende proteger lesionando lo establecido en el artículo 22 de la Ley 24.481 "*Las reivindicaciones definirán el objeto para el que se solicita la protección, debiendo ser claras y concisas. Podrán ser una o más y deberán fundarse en la descripción sin excederla. La primera reivindicación se referirá al objeto principal debiendo las restantes estar subordinadas a la misma*". A pesar de esto, la patentabilidad de las reivindicaciones fue analizada igualmente, siguiendo la racionalidad de análisis: 1) Compuestos (Fórmulas Markush y compuestos seleccionados); 2) Composición farmacéutica y 3) indicación médica.

1.1. Falta de novedad y suficiencia descriptiva de los compuestos

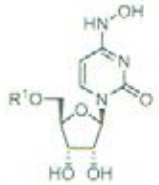
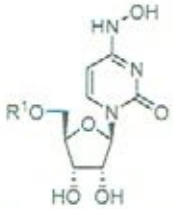
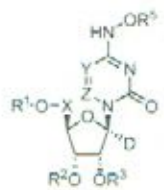
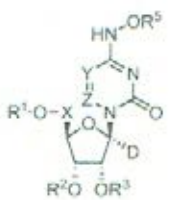
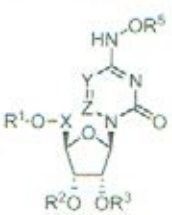
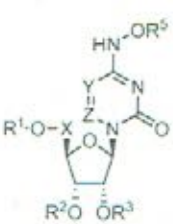
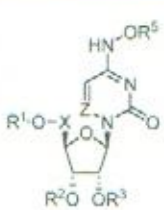
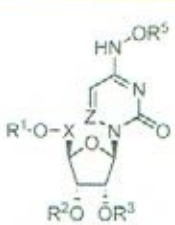
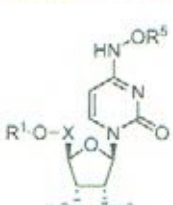
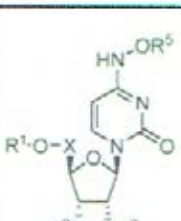
1.1.1. Compuestos de Fórmulas Markush

Las reivindicaciones **1, 8-12 y 17-41** se refieren a composiciones farmacéuticas para el tratamiento de una infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprenden un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de Fórmula Markush I-VI, VIa-f, VII-XVIII, XIX o XXI; o un tautómero o una sal farmacéutica o sal fisiológica de los mismos.

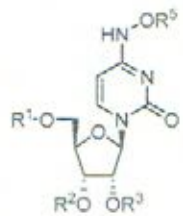
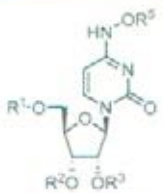
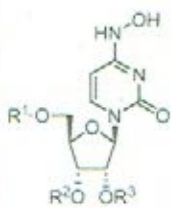
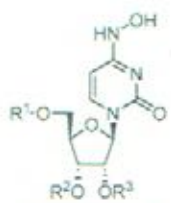
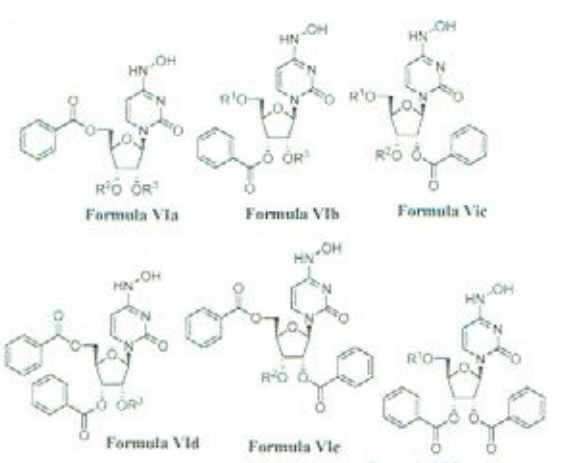
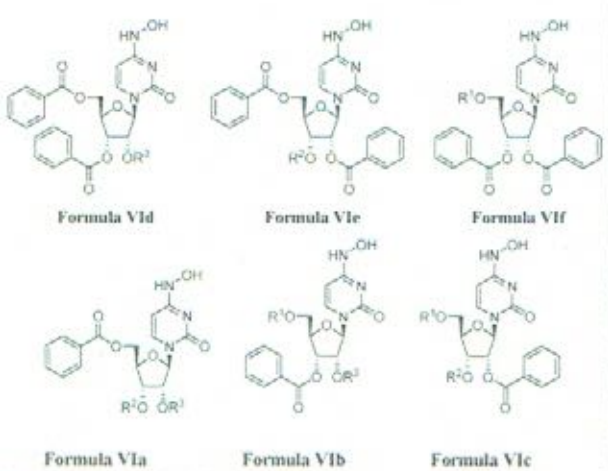
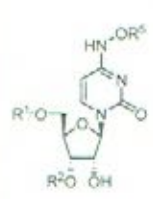
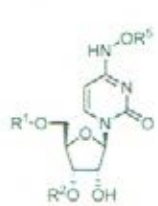
La solicitud de patente **WO2019/113462**, de aquí en más referida como **D1,** divulga composiciones farmacéuticas para el tratamiento de infecciones virales que comprenden un excipiente farmacéuticamente aceptable y un compuesto de Fórmula I-XIX. Las fórmulas Markush de la presente solicitud ya fueron divulgadas en D1 como se demuestra en la siguiente tabla (Tabla 1):

Tabla 1 - Comparación entre las fórmulas Markush fórmulas de la presente solicitud con las divulgadas en D1.

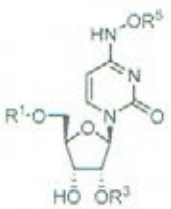
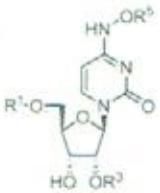
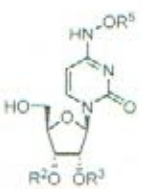
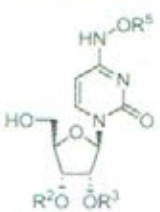
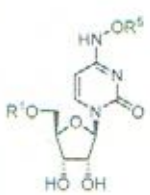
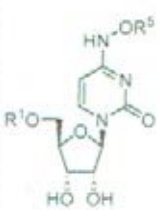
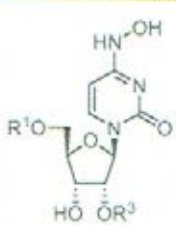
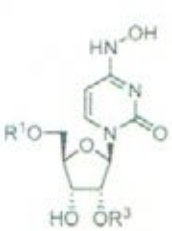
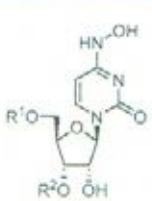
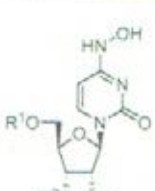
Eug. M. Lorena Di Biase
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Solicitud actual (AR121285A1)	D1 (WO2019/113462)
 **Formula XXI** Reivindicación 1	 **Formula XVIII** Reivindicación 19
 **Formula I** Reivindicación 8	 **Formula I** Reivindicación 1
 **Formula II** Reivindicación 17	 **Formula II** Reivindicación 2
 **Formula III** Reivindicación 20	 **Formula III** Reivindicación 3
 **Formula IV** Reivindicación 22	 **Formula IV** Reivindicación 4

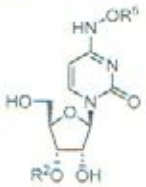
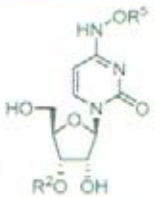
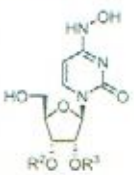
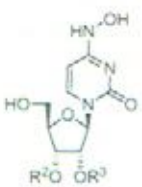
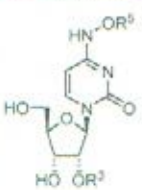
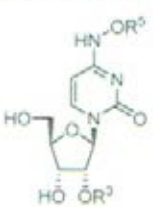
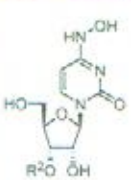
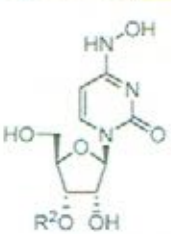
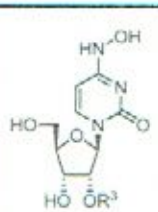
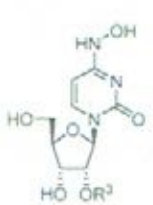
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Solicitud actual (AR121285A1)	D1 (WO2019/113462)
 Formula V Reivindicación 23	 Formula V Reivindicación 5
 Formula VI Reivindicación 24	 Formula VI Reivindicación 6
 Formula VIa Formula VIb Formula Vic Formula VId Formula VIe Formula VIf or a tautomer Reivindicación 25	 Formula VId Formula VIe Formula VIf Formula VIa Formula VIb Formula VIc Reivindicación 7
 Formula VII Reivindicación 27	 Formula VII Reivindicación 8

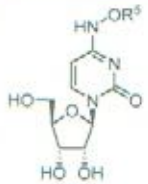
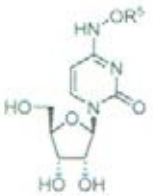
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Solicitud actual (AR121285A1)	D1 (WO2019/113462)
 **Formula VIII** Reivindicación 28	 **Formula VIII** Reivindicación 9
 **Formula IX** Reivindicación 29	 **Formula IX** Reivindicación 10
 **Formula X** Reivindicación 30	 **Formula X** Reivindicación 11
 **Formula XI** Reivindicación 31	 **Formula XI** Reivindicación 12
 **Formula XII** Reivindicación 32	 **Formula XII** Reivindicación 13

Sra. M. Luisa Di Biano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
nº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

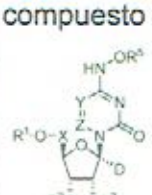
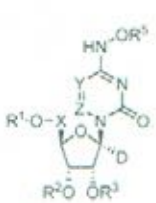
Solicitud actual (AR121285A1)	D1 (WO2019/113462)
 **Formula XIII** Reivindicación 33	 **Formula XIII** Reivindicación 14
 **Formula XIV** Reivindicación 34	 **Formula XIV** Reivindicación 15
 **Formula XV** Reivindicación 35	 **Formula XV** Reivindicación 16
 **Formula XVI** Reivindicación 36	 Reivindicación 17
 **Formula XVII** Reivindicación 37	 **Formula XVII** Reivindicación 18

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Solicitud actual (AR121285A1)	D1 (WO2019/113462)
 Formula XIX Reivindicación 38	 Formula XIX Reivindicación 20

Las posibles sustituciones de las fórmulas Markush también fueron divulgadas en D1, en la Tabla 2 se muestra un ejemplo para la Fórmula I de la presente solicitud con la Fórmula I de D1 (las diferencias se encuentran subrayadas). El mismo análisis fue realizado para el resto de las Fórmulas Markush (ver Anexo II).

Tabla 2. Comparación de las sustituciones reivindicadas en la presente solicitud* y en D1. El idioma seleccionado de la publicación de **WO2019/113462** fue el inglés, si bien no se realiza la traducción libre para el siguiente análisis, pueden observarse claramente las escasas diferencias entre ambas reivindicaciones.

Reivindicación 8 de la solicitud AR121285A1	Reivindicación 1 D1 (WO2019/113462)
8. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula I,  Formula I	1. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula I,  Formula I
o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque X es CH_2, $CHCH_3$, $C(CH_3)_2$, CHF, CF_2, o CD_2;	or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein X is CH_2, $CHCH_3$, $C(CH_3)_2$, CHF, CF_2, or CD_2;
Y es N o CR';	Y is N or CR';
Z es N o CR";	Z is N or CR";
R' es hidrógeno, deuterio, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heteroarilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, cicloalquilo, heterociclilo, o carbonilo, en el que R' está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	R' is hydrogen, deuterium, halogen, hydroxyl, amino, thiol, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, cycloalkyl, heterocyclyl, or carbonyl, wherein R' is optionally substituted with one or more, the same or

Mag. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicación 8 de la solicitud AR121285A1	Reivindicación 1 D1 (WO2019/113462)
R" es hidrógeno, deuterio, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heteroarilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, cicloalquilo, heterociclilo, hidroxilo, tiol o carbonilo, R" está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	different, R10; R" is hydrogen, deuterium, halogen, hydroxyl, amino, thiol, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, cycloalkyl, heterocyclyl, hydroxyl, thiol, or carbonyl, wherein R' is optionally substituted with one or more, the same or different, R10;
R1, R2, R3 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de H, o junto con el oxígeno al cual ellos están enlazados forman ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido,	R1, R2, R3, and R5 are each independently selected from H, optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R2, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10;

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C.A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicación 8 de la solicitud AR121285A1	Reivindicación 1 D1 (WO2019/113462)
tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R2, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	
R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	R^{10} is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfinyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R^{10} is optionally substituted with one or more, the same or different, R^{11}; R^{11} is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfinyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.

*Los términos subrayados son aquellos diferentes en comparación con D1.

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 069 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Las únicas diferencias entre los sustituyentes reivindicados en la presente solicitud en comparación con D1 son:

- Se incluye la palabra "tautómero" de cualquiera de los compuestos.
- Como posibles sustituyentes de R^1, R^2, R^3, R^4 y/o R^5 se incluye a tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, éster de oximetoxi amino, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)éter, éster de PEG, PEG carbonato (Tabla 2).
- Como posible sustituyente de R^{10} y R^{11} se incluye a hidrógeno (Tabla 2).

Se denomina "Tautómeros" a dos isómeros que se diferencian sólo en la posición de un grupo funcional. El propio solicitante detalla en la pág 22 que *"Los expertos en la técnica reconocerán que ciertos compuestos, y en particular los compuestos que contienen ciertos heteroátomos y los enlaces dobles o triples pueden ser tautómeros, isómeros estructurales que se interconvierten fácilmente. Por lo tanto, los compuestos tautoméricos se pueden extraer de varias formas diferentes que sean equivalentes."* En este sentido, parece haber un error en la traducción dado que la solicitud internacional vinculada a AR121285A1 refiere a que "*Por lo tanto, los compuestos tautoméricos se pueden dibujar de varias formas diferentes que son equivalentes."* (traducción literal de "*Thus, tautomeric compounds can be drawn in a number of different ways that are equivalent*" (page 11)). Debido al equilibrio existente entre las diferentes formas de los compuestos, las formas tautoméricas ya han sido divulgadas en D1. Además, de acuerdo a las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas" refiere respecto de las Sales, ésteres y otros derivados de sustancias conocidas que "*Nuevas sales de principios activos conocidos, ésteres de alcoholes conocidos, y otros derivados de sustancias conocidas (tales como amidas y complejos) se consideran como la misma sustancia ya conocida por el estado de la técnica y no son patentables.*" (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 546/2012, Anexo punto 3, vi).

Respecto a las sutiles diferencias en los sustituyentes de R^1, R^2, R^3 y R^5, podemos decir que los sustituyentes adicionales en la presente solicitud son especificaciones de una definición más amplia ya divulgada en D1:

Dra. M. Loreta Di Biano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

- "tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos," se pueden considerar incluidos como una posible opción dentro de "tiocarbonatos opcionalmente sustituidos" de D1.
- "éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, éster de oximetoxi amino, éster de PEG; (aciloxibencil)éter" se consideran incluidos como una posible opción dentro del gran grupo "ésteres opcionalmente sustituidos" de D1.
- "oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, PEG carbonato" se consideran incluidos como una posible opción dentro de "carbonatos o tiocarbonatos opcionalmente sustituidos" de D1.
- En particular, "sulfato y sulfito" son ésteres de ácido sulfúrico y ácido sulfuroso con características químicas similares, por lo que pueden considerarse incluidos dentro del gran grupo de "ésteres opcionalmente sustituidos" de D1 .
- "Sulfinilo, sulfonilo y sulfonamida opcionalmente sustituidos" están incluidos como posibles sustituyentes de R^1, R^2, R^3 y R^5 en D1 (como R^{10}).

Por último, en relación a D1, la solicitud actual agrega "hidrógeno" como posibilidad de R^{10} y R^{11}. Sin embargo, R^{10} y R^{11} son sustituyentes de $R^{1,2,3,5}$: $R^{1,2,3,5}$ se encuentran opcionalmente sustituidos con R^{10}, y a su vez R^{10} se encuentra opcionalmente sustituido con R^{11}. El término "sustituido" de acuerdo a la presente solicitud se define como:

> El término "sustituido" se relaciona con una molécula en la que por lo menos un átomo de hidrógeno se reemplaza con un sustituyente. Cuando están sustituidos, uno o más de los grupos son "sustituyentes". (pág 17)
>
> El término "opcionalmente sustituido", tal como se usa en el presente documento, significa que la sustitución con un grupo adicional es opcional y, por lo tanto, es posible que el átomo designado no esté sustituido. (pág 18)

Por lo tanto, R^{10} y R^{11} por definición, no pueden ser hidrógeno. Si la posición R^{10} está ocupada por un átomo de hidrógeno, esto equivale a decir que $R^{1,2,3,5}$ no están sustituidos, y, de la misma forma, si la posición R^{11} está ocupada por un átomo de hidrógeno, esto equivale a decir que R^{10} no está sustituido. De modo que no hay diferencias con D1.

En conclusión, las fórmulas Markush y los correspondientes sustituyentes reivindicados en la presente solicitud no presentan novedad respecto a lo divulgado en D1.

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Por otro lado, se pretenden reivindicar 19 fórmulas de tipo Markush, y los distintos sustituyentes posibles, dando lugar a distintos compuestos con el mismo núcleo central, sus tautómeros o sales farmacéuticamente aceptables. Las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas" detallan respecto a las Fórmulas Markush que:

> *"2. Los compuestos representados por la fórmula "Markush" serán admitidos siempre que se demuestre la existencia de unidad de invención, que cumplan los requisitos de patentabilidad (novedad, actividad inventiva y aplicación industrial) y que la memoria descriptiva de la solicitud presente una descripción suficiente para obtener todos los compuestos previstos en la fórmula "Markush" reivindicada. Cuando una invención involucre múltiples compuestos correspondientes a una fórmula tipo "Markush", deberá requerirse una relación razonablemente lógica y proporcional entre la amplitud de las reivindicaciones y el contenido de la descripción en la que ella se funda. La memoria descriptiva deberá presentar procedimientos experimentales que, contemplando las combinaciones de distintos sustituyentes o de sus equivalentes racionalmente aceptables, sean representativos de la totalidad del alcance del campo reivindicado. Si la ejemplificación no fuera lo suficientemente representativa del alcance solicitado para la invención, y por lo tanto lo reivindicado no se encuentre debidamente fundado en la descripción, deberá exigirse que el solicitante lo restrinja.*
>
> *3. Para una descripción suficiente de los compuestos previstos en la fórmula "Markush" reivindicada, las formas de realización de la invención descrita en los ejemplos, deben ser representativas de todos los compuestos a ser protegidos. En todos los casos dichas formas deberán encontrarse perfectamente ejemplificadas consignándose todos los datos que permiten caracterizar el compuesto obtenido mediante técnicas de caracterización fisicoquímicas (tales como punto de fusión, punto de ebullición, espectro infrarrojo -IR-, resonancia magnética nuclear de protones -^{1}HRMN- y de carbono 13 -^{13}CRMN-), indicando si se han detectado compuestos polimórficos.*
>
> *4. De este modo, la protección de las fórmulas "Markush" debe quedar limitada a aquello que, a partir de lo que fue divulgado en el informe descriptivo, puede ser efectivamente reproducido por un técnico en la materia y cuya aplicación industrial surge de manera indubitable de la descripción aportada."* (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 542/2012, Anexo punto 2, iv).

En este sentido, cabe destacar que el solicitante busca reivindicar alrededor de miles compuestos bajo las Fórmulas Markush I-VI, VIa-f, VII-XVIII, XIX, XXI. Sin embargo, en la

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 503 C. P. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

memoria descriptiva de la solicitud se encuentra detallado el método de preparación para solamente 16 (dieciséis) compuestos (Pág 214-246 de la solicitud). A su vez, el art. 20 de la Ley 24.481 establece que *"La invención deberá ser descrita en la solicitud de manera suficientemente clara y completa para que una persona experta y con conocimientos medios en la materia pueda ejecutarla. Asimismo, deberá incluir el mejor método conocido para ejecutar y llevar a la práctica la invención, y los elementos que se empleen en forma clara y precisa".* **Por lo tanto, las fórmulas Markush reivindicadas no se encuentran suficientemente descritas en la solicitud, lesionando el art 20 de la Ley 24.481.**

1.1.2. Falta de novedad de los compuestos seleccionados.

Las reivindicaciones **2-8, 13-16, 26, 59-66** se refieren a composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto seleccionado: EIDD-1931 (rvs. 2 y 4; 59-60, 63-64), EIDD-2801 (rvs. 3 y 5, 61-62, 65-66), EIDD-2800 (rv. 6); EIDD-2898 (rv. 7), compuestos seleccionados derivados de las Fórmulas I o VI: 16 compuestos en la rv. 13, 21 compuestos en la rv. 14 y los mismos son reivindicados en la rv. 15 con diferente configuración espacial, 16 compuestos en la rv. 16, y los mismos 16 compuestos coh H en vez de D en la posición 1´ de la ribosa son reivindicados en la rv. 26.

De modo importante, todos los compuestos seleccionados reivindicados en la presente solicitud ya fueron divulgados en el estado del arte, particularmente D1 y D2:

- EIDD-1931: Divulgado en D1 (Ejemplo 1, pág 124); D2 (Ejemplo 1-3, pág 54-59)
- EIDD-2801: Divulgado en D1 (Ejemplo 10, pág 136)
- EIDD-2800: Divulgado en D1 (Ejemplo 9, pág 135)
- EIDD-2898: Divulgado en D1 (Ejemplo 8, pág 133)
- 16 compuestos reivindicados en la rv. 13: Divulgado en D1 (rv. 39, pág 228).
- 21 compuestos reivindicados en la rv.14: Divulgado en D1 (rv. 34, pág 222).
- 20 compuestos reivindicados en la rv. 15: Divulgado en D1 (rv. 35, pág 223).
- 16 compuestos reivindicados en la rv. 16: Divulgado en D1 (rv. 37, pág 225).
- 16 compuestos reivindicados en la rv. 26: Divulgado en D1 (rv. 36, pág 224).

Por lo tanto, podemos concluir que los compuestos comprendidos en las reivindicaciones 2-8, 13-16, 26, 59-66 no presentan novedad frente a D1 y D2.

1.2 Falta de novedad de las composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto de Fórmula Markush o un compuesto seleccionado.

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060-F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

El solicitante pretende proteger composiciones farmacéuticas para el tratamiento de la COVID-19 o de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo. Como fue descripto en los ítems 1.1.1 y 1.1.2 los compuestos -tanto las Fórmulas Markush como los compuestos seleccionados- ya fueron divulgados en el arte previo (D1 y D2). D1 también refiere a composiciones farmacéuticas que comprenden un excipiente farmacéuticamente aceptable, un compuesto o una sal farmacéutica o fisiológica del mismo.

Acerca de las formulaciones, la presente solicitud detalla lo siguiente (pág 90-95):

> *"En las realizaciones ejemplares, una composición farmacéutica comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico, tal como un vehículo aceptable desde el punto de vista farmacéutico, y un compuesto ejemplar descrito en el presente documento.*
>
> *En ciertas realizaciones ejemplares, la composición farmacéutica comprende, o está en forma de, una sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico, tal como se describe en general a continuación. Algunos ejemplos, pero no limitantes, de ácidos orgánicos y/o inorgánicos aceptables desde el punto de vista farmacéutico adecuados son ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido acético y ácido cítrico, así como otros ácidos aceptables desde el punto de vista farmacéutico conocidos per se (para los cuales se hace las referencias a continuación).*
>
> *Cuando los compuestos ejemplares contienen un grupo ácido y un grupo básico, los compuestos pueden formar sales internas, que pueden también ser usadas en las composiciones y métodos que se describen en el presente documento. Cuando un compuesto ejemplar contiene un heteroátomo donante de hidrógeno (por ejemplo, NH), se contempla que las sales cubran los isómeros formados por la transferencia de dicho átomo de hidrógeno a un grupo o átomo básico dentro de la molécula.*
>
> *Las sales aceptables desde el punto de vista farmacéutico de los compuestos ejemplares incluyen las sales de adición de ácido y de base de los mismos. Las sales de adición de ácido adecuadas se*

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

forman a partir de ácidos que forman sales no tóxicas. Los ejemplos incluyen acetato, adipato, aspartato, benzoato, besilato, bicarbonato/carbonato, bisulfato/sulfato, borato, camsilato, citrato, ciclamato, edisilato, esilato, formiato, fumarato, gluceptato, gluconato, glucuronato, hexafluorofosfato, hibenzato, clorhidrato/cloruro, bromhidrato/bromuro, yodhidrato/yoduro, isetionato, lactato, malato, maleato, malonato, mesilato, metilsulfato, naftilato, 2-napsilato, nicotinato, nitrato, orotato, oxalato, palmitato, pamoato, fosfato/hidrogenofosfato/dihidrogenofosfato, piroglutamato, sales de sacarato, estearato, succinato, tanato, tartrato, tosilato, trifluoroacetato y xinofoato. Las sales básicas adecuadas se forman a partir de bases que forman sales no tóxicas. Los ejemplos incluyen las sales de aluminio, arginina, benzatina, calcio, colina, dietilamina, diolamina, glicina, lisina, magnesio, meglumina, olamina, potasio, sodio, trometamina y zinc. Hemisales de ácidos y bases pueden formarse también, por ejemplo, sales hemisulfato y hemicálcicas. Para una revisión de las sales adecuadas, véase Handbook of Pharmaceutical Salts: Properties, Selection, and Use de Stahl y Wermuth (Wiley-VCH, 2002), que se incorpora en el presente documento como referencia.

Las sales fisiológicamente aceptables de los compuestos ejemplares son aquellas que se forman internamente en un compuesto administrado a un sujeto para el tratamiento o la prevención de una enfermedad. Las sales adecuadas incluyen las sales de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio, manganeso, biliares.

(...)En las realizaciones ejemplares, la composición farmacéutica comprende una cantidad efectiva de un compuesto ejemplar y un vehículo aceptable desde el punto de vista farmacéutico. Generalmente, para uso farmacéutico, los compuestos se pueden formular como una preparación farmacéutica que comprende por lo menos un compuesto y por lo menos un vehículo, diluyente o excipiente y/o adyuvante aceptable desde el punto de vista farmacéutico, y opcionalmente uno o más compuestos farmacéuticamente activos adicionales. Las preparaciones se pueden preparar de una manera conocida per se, lo que normalmente implica mezclar el por lo menos un compuesto de acuerdo con la presente divulgación con uno o más vehículos aceptables desde el punto de vista farmacéutico y, si se

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

desea, en combinación con otros compuestos activos farmacéuticos, cuando sea necesario bajo condiciones asépticas. Se hace referencia nuevamente a la patente estadounidense No. 6.372.778, patente estadounidense No. 6.369.086, patente estadounidense No. 6.369.087 y la patente No. estadounidense 6.372.733 y las referencias adicionales mencionadas anteriormente, así como a los manuales estándar, tales como la última edición de Remington's Pharmaceutical Sciences."

Notablemente, D1 describe exactamente lo mismo respecto a las formulaciones en la memoria descriptiva (pág 106-108, D1). Dado que las composiciones farmacéuticas de D1 comprenden a los mismos compuestos que los referidos en la presente solicitud, las composiciones farmacéuticas de la presente solicitud tampoco presentan novedad.

La única diferencia respecto a D1 es la inclusión de un tautómero de los compuestos, además de una sal fisiológica o farmacéuticamente aceptable. Como ya fue mencionado, se denomina "Tautómeros" a dos isómeros que se diferencian sólo en la posición de un grupo funcional. El propio solicitante detalla en la pág 22 que *"Los expertos en la técnica reconocerán que ciertos compuestos, y en particular los compuestos que contienen ciertos heteroátomos y los enlaces dobles o triples pueden ser tautómeros, isómeros estructurales que se interconvierten fácilmente. Por lo tanto, los compuestos tautoméricos se pueden extraer de varias formas diferentes que sean equivalentes."* En este sentido, parece haber un error en la traducción dado que la solicitud internacional vinculada a AR121285A1 refiere a que *"Por lo tanto, los compuestos tautoméricos se pueden dibujar de varias formas diferentes que son equivalentes."* (traducción literal de *"Thus, tautomeric compounds can be drawn in a number of different ways that are equivalent"* (page 11)). Debido al equilibrio existente entre las diferentes formas de los compuestos, las formas tautoméricas ya han sido divulgadas en D1. Además, de acuerdo a las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas" refiere respecto de las Sales, ésteres y otros derivados de sustancias conocidas que *"Nuevas sales de principios activos conocidos, ésteres de alcoholes conocidos, y otros derivados de sustancias conocidas (tales como amidas y complejos) se consideran como la misma sustancia ya conocida por el estado de la técnica y no son patentables."* (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 546/2012, Anexo, punto 3, vi).

En conclusión, las composiciones farmacéuticas reivindicadas en las rvs. 1-41 no presentan novedad frente a lo divulgado en D1.

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

1.3 Falta de novedad y actividad inventiva de la indicación médica de las composiciones: Tratamiento de SARS-CoV-2

Las reivindicaciones 1-41 se refieren a una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 (rvs. 1-3, 6-41), o bien para el tratamiento de la COVID-19 (rvs. 4-5). Como fue detallado en las secciones anteriores, las mismas composiciones farmacéuticas fueron divulgadas en D1 para tratar infecciones virales. Específicamente, D1 describe que las composiciones pueden ser utilizadas para tratar una infección viral causada por un coronavirus (pág 105, línea 8). Las rvs. 58-60 de D1 se refieren al tratamiento de infecciones causadas por un coronavirus humano, SARS coronavirus, MERS coronavirus utilizando los compuestos EIDD-2800, EIDD-2801 y EIDD-2898, respectivamente. **Dado que el virus 2019nCoV/SARS-CoV-2 pertenece a la categoría "coronavirus", la indicación médica de las composiciones tampoco tiene novedad frente a D1.**

Además, dado que la actividad antiviral del compuesto EIDD-1931 ha sido ampliamente divulgada para distintos tipos virales e incluso D1 divulga la actividad antiviral de este compuesto y sus prodrogas contra "coronavirus" en general, sería obvio para un técnico en la materia pensar que el compuesto pueda ser efectivo también contra el SARS-CoV-2 (cuya emergencia fue posterior a la fecha de prioridad de D1, en diciembre de 2019). Particularmente, D1 provee un ejemplo mostrando la actividad biológica de EIDD-1931 contra varios tipos de virus de la familia *Coronaviridae*, incluyendo SARS (pág 155-156, Figura 2). La actividad antiviral de EIDD-1931 contra miembros de la familia de Coronavirus fue también divulgada en D5 (SARS-CoV) y D6 (MERS-CoV y hepatitis viral murina, MHV). Aún más, D6 anticipa que potenciales coronavirus puedan emerger y causar una enfermedad seria en el futuro, y en está línea, demuestran la actividad antiviral de EIDD-1931 contra dos coronavirus genéticamente divergentes (MHV y MERS-CoV), posicionado al compuesto como un antiviral de amplio espectro para Coronavirus.

Como fue comentado anteriormente, los compuestos en cuestión actúan sobre la enzima RNA polimerasa dependiente de RNA (RdRp) del virus. El gen que codifica para la enzima RdRp es un gen altamente conservado, presente en todos los virus de RNA y es considerado como un marcador genético estable[5]. Notablemente, la enzima RdRp del SARS-CoV-2 presenta un 96% de similitud (de acuerdo a análisis de homología de proteínas) con

[5] Kasibhatla, S. M., Kinikar, M., Limaye, S., Kale, M. M., & Kulkarni-Kale, U. (2020). Understanding evolution of SARS-CoV-2: a perspective from analysis of genetic diversity of RdRp gene. Journal of medical virology, 92(10), 1932-1937. Available at https://onlinelibrary.wiley.com/doi/epdf/10.1002/jmv.25909

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

la enzima RdRp del SARS-CoV (mostrando una divergencia de solo 23 aminoácidos de 932)[6]. **Por lo cual sería obvio y esperable para una persona normalmente versada en la materia que el compuesto N4-hidroxicitidina, y sus derivados, sean efectivos contra SARS-CoV-2, como parte de la familia *Coronaviridae*.**

Figura 2 – Ejemplo de análisis de actividad biológica de EIDD-1931 divulgado en D1

Example 36: N4-hydroxycytidine Coronaviridae Activity

Virus	Cell Line	EC_{50} (μM)	EC_{90} (μM)	CC_{50} (μM)
MERS	Vero E6	<0.80	<0.80	20
SARS	Vero76	<0.4		252
SARS	Vero76	<0.4		144
SARS	Vero76		0.56	76
SARS	Vero76	2.2		76
SARS	Vero E6	<0.80	<0.80	20
HCoV	HEL	1.28		100
HCoV	HEL	5.6		36
HCoV	HEL		<0.128	192
HCoV	HEL	0.228		192
HCoV	Vero76	<0.4		400
HCoV	Vero E6	<0.4		400
HCoV	HEL	1.28		100
HCoV	HEL	4		60
HCoV	HEL		0.4	232
HCoV	HEL	0.212		232
HCov	Vero76	12.8		400
HCoV	Vero76		0.32	44
HCov	Vero76	0.44		44

La indicación médica de las composiciones farmacéuticas de la presente solicitud no presenta novedad ni actividad inventiva lesionando el art. 4 de la Ley 24.481

<u>Conclusión general Reivindicaciones 1-41:</u> Como fue detallado en las secciones anteriores las reivindicaciones 1-41 no son claras respecto al objeto a proteger. Ninguno de los tres aspectos de las rvs. (compuestos, composiciones, indicación médica) cumple con los requisitos de patentabilidad de novedad y actividad inventiva, y tampoco presentan suficiencia descriptiva. Se sugiere el rechazo de las 41 rvs. por lesionar los art. 4, 20 y 22 de la Ley 24.481.

[6] Aftab, S. O., Ghouri, M. Z., Masood, M. U., Haider, Z., Khan, Z., Ahmad, A., & Munawar, N. (2020). Analysis of SARS-CoV-2 RNA-dependent RNA polymerase as a potential therapeutic drug target using a computational approach. Journal of translational medicine, 18(1), 275. https://doi.org/10.1186/s12967-020-02439-0)

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

2. COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS PARA EL TRATAMIENTO DE UNA INFECCIÓN VIRAL (2019nCoV/SARS-CoV-2) O DE UNA ENFERMEDAD (COVID-19) QUE COMPRENDEN LOS COMPUESTOS EN COMBINACIÓN CON OTROS ANTIVIRALES (Reivindicaciones 57-66; 71-72).

Las rvs. **57 y 58** se refieren a una composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-43, que comprende además uno o más agentes antivirales. Las rvs. **59-62** y **71-72** se refieren a composiciones para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 que comprende al compuesto EIDD-1931 (rvs. 59, 60), EIDD-2801 (rvs. 61, 62), EIDD-2898 (rv. 71) o EIDD-2800 (rv. 72); en combinación con otros antivirales. Las rvs. 63-66 se refieren a composiciones para el tratamiento de la COVID-19 que comprende al compuesto EIDD-1931 (63, 64) o EIDD-2801 (rvs. 65, 66) en combinación con otros antivirales.

2.1. Exclusión de patentabilidad

Como se detalló en la sección anterior, los compuestos comprendidos en las composiciones farmacéuticas de la presente solicitud no presentan novedad frente a lo divulgado en D1 y D2. Se pretende proteger una combinación de dichos compuestos con una lista de antivirales que también son compuestos conocidos[7] aprobados comercialmente o bajo investigación para tratar infecciones virales. De modo que se trata de una combinación de productos conocidos, que de acuerdo al art. 6 de la Ley 24.481 no es patentable: "*f) La yuxtaposición de invenciones conocidas o mezclas de productos conocidos, su variación de forma, de dimensiones o de materiales, salvo que se trate de su combinación o fusión de tal manera que no puedan funcionar separadamente o que las cualidades o funciones características de las mismas sean modificadas para obtener un resultado industrial no obvio para un técnico en la materia*".

Además, las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas" recomiendan respecto a las combinaciones de productos: "*Las reivindicaciones sobre combinaciones de principios activos previamente conocidos, en algunos casos indican cuáles son los compuestos específicos que comprenden y las cantidades que cubren, mientras que en otros sólo se hace referencia a una categoría de compuestos terapéuticos, tales como antiácidos y antivirales, sin especificar cuáles son los*

[7] See *Drugs repurposed as Antivirals* available at https://bioinfo.imtech.res.in/manojk/drugrepv/browse_main.php?db=category2

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

compuestos que incluye. La mayoría de las combinaciones ya han sido probadas en la práctica médica administrando los componentes en forma separada. Las reivindicaciones de combinaciones de principios activos previamente conocidos en términos prácticos equivalen a reivindicaciones sobre tratamientos médicos cuya patentabilidad está excluida" (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 546/2012, Anexo punto 4, x).

2.2. Falta de actividad inventiva y suficiencia descriptiva

Por otro lado, la combinación de distintos compuestos antivirales es ampliamente utilizada en el tratamiento de infecciones causadas por diversos virus. En este sentido, resulta obvio para una persona normalmente versada en la materia, evaluar la combinación de al menos dos compuestos con probada actividad antiviral para tratar la infección causada por 2019nCoV/SARS-CoV-2 o COVID-19. En este caso, el solicitante nombra una serie de potenciales compuestos para utilizar en combinación con los referidos en la presente solicitud, sin aportar mayores especificaciones técnicas, ni ensayos biológicos que analicen la actividad antiviral de las combinaciones propuestas en el tratamiento de infecciones o enfermedades causadas por coronavirus. De modo que las reivindicaciones 57-66, 71-72 no presentan actividad inventiva.

Conclusión: Las reivindicaciones 57-66, 71-72 no cumplen con el requisito de patentabilidad de actividad inventiva establecido en el art. 4 de la Ley 24.481 y, dado que son combinaciones de compuestos conocidos, están expresamente excluidos de acuerdo al art. 6 de la Ley 24.481.

3. COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS PARA EL TRATAMIENTO DE UNA INFECCIÓN VIRAL (2019nCoV/SARS-CoV-2) O DE UNA ENFERMEDAD (COVID-19) QUE COMPRENDEN UN PROPELENTE (Reivindicaciones 42-43).

En las rvs. 42 y 43 el solicitante intenta reivindicar diferentes composiciones farmacéuticas incluyendo los compuestos de las Reivindicaciones 1-41, que comprende además un propelente (rv. 42), donde el propelente es aire comprimido, etanol, nitrógeno, dióxido de carbono, óxido nitroso, hidrofluoroalcanos (HFA), 1,1,1,2,-tetrafluoroetano, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano o combinaciones de los mismos (rv. 43).

3.1. Falta de novedad, actividad inventiva y suficiencia descriptiva

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Las Rvs. 42-43 pretenden reivindicar composiciones farmacéuticas conteniendo cualquiera de los compuestos de las Rvs. 1-41 y distintos propelentes. A continuación, se demostrará que las mismas carecen de novedad y actividad inventiva en vista de lo previamente divulgado en D1. D1 divulga los mismos componentes de la composición farmacéutica que se intenta reivindicar en las Rvs. 42-43 de la presente solicitud, tal como se detalla en la Tabla 3:

Tabla 3 – Comparación de las Rvs. 42-43 de la presente solicitud y Rvs. 43-44 de D1.

Nota: El idioma original de la publicación WO2019/113462 es inglés, aquí se realiza una traducción libre de las Rvs. mencionadas al español y a su vez se adjunta el documento original (dichas Rvs. se encuentran en las pág 229 de D1).

AR121285A1	D1 (WO2019/113462)
42. La composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 41, que comprende además un propelente.	43. La composición farmacéutica de cualquiera de las Reivindicaciones 1-42 que comprende además un propelente.
43. La composición farmacéutica de acuerdo con la Reivindicación 42, caracterizada porque el propelente es aire comprimido, etanol, nitrógeno, dióxido de carbono, óxido nitroso, hidrofluoroalcanos (HFA), 1,1,1,2,-tetrafluoroetano, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano o combinaciones de los mismos.	44. La composición farmacéutica de la Reivindicación 43 donde el propelente es aire comprimido, etanol, nitrógeno, dióxido de carbono, óxido nitroso, hidrofluoroalcanos (HFA), 1,1,1,2,-tetrafluoroetano, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano o combinaciones de los mismos.

En este mismo sentido, en la reivindicación 43, el solicitante divulga la identidad de las sustancias utilizadas como propelentes: *aire comprimido, etanol, nitrógeno, dióxido de carbono, óxido nitroso, hidrofluoroalcanos (HFA), 1,1,1,2,- tetrafluoroetano, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano o combinaciones de los mismos.*

Las sustancias que el solicitante intenta reivindicar como propelentes de la composición farmacéutica pertenecen al estado de la técnica, por lo tanto, una persona versada en la materia podría haber seleccionado dichas sustancias como propelentes. Cómo elemento probatorio, se adjunta el documento D3 (Manual de excipientes farmacéuticos) el cual puede servir como elemento de consulta para cualquier persona versada en la materia para la selección de excipientes específicos. En dicho manual, se pueden encontrar monografías de distintas sustancias específicas y sus usos potenciales como excipientes en formulaciones farmacéuticas. En la Tabla 4 podemos encontrar el listado de sustancias que el solicitante intenta reivindicar en la Rv. 43 de la presente solicitud, junto con sus posibles aplicaciones

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

como propelentes que fueron previamente divulgadas y forman parte del estado del arte para el desarrollo de composiciones farmacéuticas de formato inhalatorio.

Tabla 4– Aplicación de distintas sustancias presentes en D3 como excipientes

Sustancia	Posibles aplicaciones en formulaciones farmacéuticas	Página en D3
Nitrógeno	Traducción libre: "**Nitrógeno** y otros aires comprimidos como el dióxido de carbono y óxido nitroso son usados como **propelentes** para aerosoles farmacéuticos tópicos." Original: "**Nitrogen** and other compressed gases such as carbon dioxide and nitrous oxide are used as **propellants** for topical pharmaceutical aerosols."	488
Dióxido de carbono	Traducción libre: "**Dióxido de carbono** y otros gases comprimidos como el nitrógeno y el óxido nitroso son usados como **propelentes** para aerosoles farmacéuticos tópicos." Original: "**Carbon dioxide** and other compressed gases such as nitrogen and nitrous oxide are used as **propellants** for topical pharmaceutical aerosols."	116
Oxido Nitroso	Traducción libre: "**Óxido nitroso** y otros gases comprimidos como el dióxido de carbono y el nitrógeno son usados como **propelentes** para aerosoles farmacéuticos tópicos." Original: "**Nitrous oxide** and other compressed gases such as carbon dioxide and nitrogen are used as **propellants** for topical pharmaceutical aerosols."	489
1,1,1,2,-tetrafluoroetano, hidrofluoroalcano (HFA)	Traducción libre: "**Tetrafluoroetano** es un hidrofluorocarbono (HFC) o **hidrofluoroalcano (HFA)** propelente de aerosoles (contiene hidrógeno, flúor, y carbono) en contraste con un CFC (cloro, flúor y carbono)." Original:"**Tetrafluoroethane** is a hydrofluorocarbon (HFC) or **hydro-fluoroalkane (HFA) aerosol propellant** (contains hydrogen, fluorine, and carbon) as contrasted to a CFC (chlorine, fluorine, and carbon)."	772

Dra. M. Roberta Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano	Traducción libre: "**Heptafluoropropano** (P-227) es clasificado como un hidrofluorocarbono (HFC) **propelente de aerosoles** dado que la molécula consiste en sólo carbono, flúor y átomos de hidrógeno". Original:"**Heptafluoropropane** (P-227) is classified as a hydrofluorocarbon (HFC) **aerosol propellant** since the molecule consists only of carbon, fluorine, and hydrogen atoms."	321

Fuente: D3

Por otra parte, las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas", (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 546/2012, Anexo punto 4, ix) Formulaciones y composiciones, explicitan: *"(...) Como excepción, las reivindicaciones sobre una formulación podrían ser aceptables cuando se resuelve, de manera no obvia, un problema de larga data. En este caso se deberá consignar en la memoria la descripción de los ensayos realizados y los resultados obtenidos.(...)"*. En este sentido, el solicitante no divulga que las composiciones farmacéuticas que intenta reivindicar resuelvan un problema de larga data. El solicitante divulga ejemplos de administración de algunos de los compuestos de las rvs. 1-41 en la memoria descriptiva, pero en dichos ejemplos ninguna de las vías de administración de los compuestos en cuestión es inhalatoria (pág 250-296). Por lo tanto, las rvs. 42-43 no se encuentran debidamente soportadas por la memoria descriptiva.

Conclusión: De este modo, en vista de lo divulgado previamente en D1 podemos concluir que las rvs. 42 y 43 carecen de novedad; y en vista de las enseñanzas de D3, una persona versada en la materia hubiera considerado las sustancias divulgadas como propelentes para incluir en una composición farmacéutica inhalatoria. Por otra parte, el solicitante falla en demostrar que las composiciones reivindicadas vengan a resolver un problema de larga data. Por lo tanto, las reivindicaciones 42 y 43 carecen de novedad, actividad inventiva y no se encuentran debidamente soportadas por la memoria descriptiva, lesionando el art. 4 y 20 de la Ley 24.481.

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 509 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

4. RECIPIENTE PRESURIZADO QUE CONTIENE COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS PARA EL TRATAMIENTO DE UNA INFECCIÓN VIRAL (2019nCoV/SARS-CoV-2) O DE UNA ENFERMEDAD (COVID-19) QUE COMPRENDEN (Reivindicaciones 44-45).

En las rvs. 44-45 el solicitante intenta reivindicar un recipiente presurizado que comprende composiciones farmacéuticas incluyendo los compuestos de las Reivindicaciones 1-41:

44. Un recipiente presurizado que comprende una composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 41.

45. El recipiente de acuerdo con la Reivindicación 44, que es un pulverizador de bomba manual, inhalador, inhalador dosificado por medidor, inhalador de polvo seco, nebulizador, nebulizador de malla vibratoria, nebulizador de chorro o nebulizador de ondas ultrasónicas.

4.1. Falta de novedad, actividad inventiva y suficiencia descriptiva

Las rvs. 44-45 pretenden reivindicar recipientes de distintas características conteniendo composiciones farmacéuticas de las rvs. 1-41. A continuación, se demostrará que las mismas carecen de novedad y actividad inventiva en vista de lo previamente divulgado en D1. D1 divulga el mismo tipo de reivindicación de recipiente comprendiendo la composición farmacéutica que se intenta reivindicar en las rvs. 44-45 de la presente solicitud tal como se detalla en la Tabla 5:

Tabla 5– Comparación de las Rvs. 44-45 de la presente solicitud y Rvs. 45-46 de D1.
Nota: El idioma original de la publicación WO 2019/113462 es inglés, aquí se realiza una traducción libre de las Rvs. mencionadas al español y a su vez se adjunta el documento original (dichas Rvs. se encuentran en las pág.229 de D1).

AR121285A1	D1 (WO2019/113462)
44. Un recipiente presurizado que comprende una composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 41.	45. Un envase presurizado que comprende una composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-42.
45. El recipiente de acuerdo con la Reivindicación 44, que es un pulverizador de bomba manual, inhalador, inhalador dosificado por medidor, inhalador de polvo seco, nebulizador, nebulizador de malla vibratoria,	46. El envase de acuerdo a la reivindicación 45 que es un pulverizador de bomba manual, inhalador, inhalador dosificado por medidor, inhalador de polvo seco, nebulizador, nebulizador de malla vibratoria, nebulizador

Mtra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

nebulizador de chorro o nebulizador de ondas ultrasónicas.	de chorro o nebulizador de ondas ultrasónicas.

Por otra parte, D4 divulga una revisión de distintos sistemas de formulación para drogas de administración pulmonar. Dicho documento describe 3 (tres) categorías para dispositivos de administración pulmonar: nebulizadores, inhaladores dosificados por medidor e inhaladores de polvo seco. Según D4, la primera categoría que estuvo disponible en el mercado para este tipo de dispositivos fueron los nebulizadores. Luego, los inhaladores dosificados por medidor estuvieron disponibles desde los alrededores de 1950. Además, según Crompton y col.[8], el primer inhalador de polvo seco (llamado "Spinhaler®") fue lanzado alrededor de 1960.

Por lo tanto, y en vista de lo divulgado en D4, una persona versada en la materia consideraría a los nebulizadores, inhaladores presurizados dosificados por medidor e inhaladores de polvo seco como opción para dispositivo de administración pulmonar de drogas. De acuerdo a las "Pautas para el examen de Patentabilidad de Patentes sobre Invenciones Químico-Farmacéuticas", *"Las formulaciones y composiciones nuevas como también los procesos para su preparación se deben considerar por regla general obvios teniendo en cuenta el arte previo...Como excepción, las reivindicaciones sobre una formulación podrían ser aceptables cuando se resuelve, de manera no obvia, un problema de larga data. En este caso se deberá consignar en la memoria la descripción de los ensayos realizados y los resultados obtenidos."* (Resolución conjunta INPI 107/2012 MI 118/2012 MS 546/2012, Anexo punto 4, ix). En este caso, el solicitante no declara que alguno de estos recipientes venga a resolver un problema de larga data que justifique su reivindicación.

Por otra parte, el solicitante, en la memoria descriptiva, no divulga ningún ejemplo que demuestre que el empleo de alguno de estos recipientes conteniendo alguno de los compuestos presentes en las rvs. 1-41. En este sentido, la única vía de administración ensayada en el estudio de fase I es la oral (Ejemplo 37, pág. 281-295). Si bien el solicitante aclara que "*Se pretende que la memoria descriptiva y los ejemplos se consideren únicamente a modo ejemplar, indicándose el verdadero alcance y espíritu de la invención mediante las siguientes reivindicaciones*" (pág. 296 de la presente solicitud), las reivindicaciones de la

[8] Crompton, G. (2006). A brief history of inhaled asthma therapy over the last fifty years. Primary care respiratory journal, 15(6), 326-331.

Dra. M. Lorena Di Lauro
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

solicitud deben estar lo suficientemente soportadas por la memoria descriptiva de acuerdo a lo establecido en el artículo 20 de la Ley 24.481.

Conclusión: De este modo, en vista de lo divulgado previamente en D1 y D4 podemos concluir que las rvs. 44 y 45 carecen de novedad y actividad inventiva. Además carecen de suficiencia descriptiva por no estar debidamente respaldadas por la memoria. Las reivindicaciones lesionan por lo antedicho el art. 4 y 20 de la Ley 24.481.

5. MÉTODOS DE TRATAMIENTO PARA EL TRATAMIENTO O PREVENCIÓN DE UNA INFECCIÓN VIRAL (2019nCoV/SARS-CoV-2) O DE UNA ENFERMEDAD (COVID-19) (Reivindicaciones 46-56, 67-70 y 73-77).

Estas reivindicaciones pueden englobarse en la categoría de "Métodos de tratamiento", mediante las cuales el solicitante intenta proteger distintas aplicaciones médicas de compuestos. Pueden agruparse de la siguiente manera:

- Tratamiento:
  - Rvs. 47-48; 67-68: Un método para el **tratamiento** de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, con los compuestos EIDD-1931 (rv. 47) y en combinación con otros compuestos antivirales (rv. 67), EIDD-2801 (rv. 48) y en combinación con otros compuestos antivirales (rv. 68),
  - Rvs. 51-52; 69-70: Un método para el **tratamiento** de la COVID-19 con los compuestos EIDD-1931 (rv. 51) o EIDD-2801 (rv. 52) solos o en combinación con otros compuestos antivirales (rvs. 69, 70).
  - Rvs. 76-77: Un método **para tratar una infección** viral del SNC en un paciente, con la composición de las rvs. 1-43, 57-65 o 71-72

- Prevención:
  - Rvs. 53-54: Un método para la **prevención** de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 con los compuestos EIDD-1931 (rv. 53) y EIDD-2801 (rv. 54).
  - Rvs. 55-56: Un método para la **prevención** de la COVID-19 con los compuestos EIDD-1931 (rv. 55) y EIDD-2801 (rv. 56).

- Tratamiento o Prevención:

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

- Rv. 73: Un método para el **tratamiento o prevención** de las infecciones causadas por 2019-nCoV/SARS-CoV-2 que comprende administrar una combinación de acuerdo a las rvs. 57-65 o 71-72.
- Rvs. 46, 49-50, 74-75: Un método para el **tratamiento o prevención** de las infecciones causadas por 2019-nCoV/SARS-CoV-2 con los compuestos de las rvs. 1-43 (rv. 46), compuesto EIDD-2800 (rv. 49), EIDD-2898 (rv. 50), EIDD-2801 (rv. 74) or EIDD-1931 (rv. 75).

5.1. Exclusión de patentabilidad y falta de aplicación industrial

Las reivindicaciones **46-56, 67-70 y 73-77** se refieren a métodos de tratamiento médico aplicados a un humano que así lo necesite. Ninguna de estas reivindicaciones se refiere a un producto o un proceso, sino a la forma en que son utilizados para obtener determinados efectos. En este caso, los efectos son producidos en el cuerpo del paciente, por lo que carecen de aplicación industrial. El artículo 6 de la Ley 24.481 deja en claro que los procedimientos o métodos terapéuticos aplicados al cuerpo humano no constituyen una invención: *"No se considerarán invenciones para los efectos de esta Ley:..e) Los métodos de tratamiento quirúrgico, terapéutico o de diagnóstico aplicables al cuerpo humano*".

Por otra parte, las reivindicaciones **67-70, 76-77** divulgan métodos de tratamiento que comprenden la combinación de los compuestos EIDD-1931 o EIDD-2801 (o los compuestos de las rvs. 1-43), con otros agentes antivirales. Como fue detallado en la **Sección 2** del presente análisis, se trata de una combinación de productos conocidos, que de acuerdo al art. 6 de la Ley 24.481 no es patentable: *"f) La yuxtaposición de invenciones conocidas o mezclas de productos conocidos, su variación de forma, de dimensiones o de materiales, salvo que se trate de su combinación o fusión de tal manera que no puedan funcionar separadamente o que las cualidades o funciones características de las mismas sean modificadas para obtener un resultado industrial no obvio para un técnico en la materia"*.

5.2. Falta de novedad, actividad inventiva y suficiencia descriptiva

Los métodos de tratamientos reivindicados en la presente solicitud comprenden la administración de los compuestos de las rvs. 1-43, que no presentan novedad frente a lo divulgado en D1 y D2 (Detallado en la **Sección 1** del presente análisis). Notablemente, D1 también divulga métodos de tratamiento:

- Rv. 47 de D1: Un método para el tratamiento o prevención de una infección viral comprendiendo la administración de una cantidad efectiva de un compuesto de cualquiera de las rvs 1-42 a un sujeto que lo necesite.
- Rv. 50 de D1: El método de la rv. 47, donde la infección viral es un coronavirus.

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 350 Fº 508 C. F. A. M. P. B.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

- Rv. 51 de D1: El método de la rv. 50, donde la infección viral es un coronavirus humano, SARS coronavirus, y MERS coronavirus.
- Rv. 58, 59 y 60 de D1: Un método para el tratamiento o prevención de una infección viral causada por un coronavirus humano, SARS coronavirus, MERS coronavirus, (...) comprendiendo la administración de una cantidad efectiva de un compuesto a un sujeto que lo necesite con la estructura: EIDD-2800 (Rv. 58); EIDD-2801 (Rv. 59); EIDD-2898 (Rv. 60)

De modo que métodos de tratamiento comprendiendo la administración de los compuestos divulgados en la presente solicitud para tratar infecciones causadas por distintos miembros de la familia *Coronaviridae* ya fueron divulgados en D1. Particularmente, D1 provee un ejemplo mostrando la actividad biológica de EIDD-1931 contra varios tipos de virus de la familia Coronaviridae, incluyendo SARS (D1, Ejemplo 36, pág 155-156).

Además, la actividad antiviral del compuesto EIDD-1931 contra miembros de la familia de Coronavirus fue también divulgada en D5 (SARS-CoV) y D6 (MERS-CoV y hepatitis viral murina, MHV). D6 incluso anticipa que potenciales coronavirus puedan emerger y causar una enfermedad seria en el futuro, y en está línea, demuestran la actividad antiviral EIDD-1931 contra dos coronavirus genéticamente divergentes (MHV and MERS-CoV), posicionado al compuesto como un antiviral de amplio espectro para Coronavirus. Por lo tanto, sería obvio para un técnico en la materia pensar que el compuesto pueda ser efectivo también contra el SARS-CoV-2 (cuya emergencia fue posterior a la fecha de prioridad de D1, en diciembre del año 2019).

La presente solicitud proporciona 20 ejemplos relacionados con la actividad antiviral o farmacocinética de los compuestos (Ejemplos 18-37, pág 247-295) de los cuales 18 ejemplos (Ejemplos 18-35) son exactamente los mismos que los divulgados en D1 (Ejemplos 36, 42-45, 48-55, 60-73 de D1). El ejemplo 36 de D1 (ejemplo 18 de la presente solicitud) provee un ejemplo mostrando la actividad biológica de EIDD-1931 contra varios tipos de virus de la familia Coronaviridae, incluyendo SARS (Ejemplo 36, pág 155-156). Los ejemplos 42-45 y 48-55 de D1 refieren a estudios farmacocinéticos de los compuestos EIDD-1931 y sus prodrogas EIDD-2800, EIDD-2801, EIDD-2898, EIDD-2776 en modelos animales (hurones, ratones, ratas, perros, monos) (ejemplos 19-28 de la presente solicitud). D1 también divulga los mismos ensayos *in vivo* en modelos de ratón de infección por SARS o MERS para evaluar el tratamiento profiláctico o terapéutico de EIDD-2801 (Ejemplos 60-65 de D1, pág 167-171; Ejemplos 29-31 de la presente solicitud, pág 160-164). Los ejemplos 66-73 de D1 (pág 171-174) se refieren a la evaluación de la captación y metabolismo celular de EIDD-2801 en

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

distintas líneas celulares, y los mismos ejemplos son proporcionados en la presente solicitud como Ejemplos 32-35 (pág 164-167).

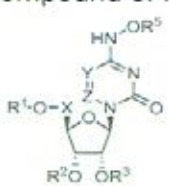
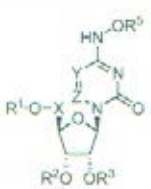
La única diferencia entre los ejemplos proporcionados por la solicitud actual y D1 es la adición de los ejemplos 36 y 37, siendo el ejemplo 36 (pág 167) el único que hace mención específica a SARS-CoV-2. El ejemplo 36 analiza la actividad in vitro de EIDD-1931 contra SARS-CoV-2 utilizando el mismo protocolo que en el ejemplo 18 (o 36 de D1), mientras que el ejemplo 37 se refiere a un ensayo clínico de fase I con EIDD-2801 para evaluar la seguridad y farmacocinética en voluntarios sanos. Cabe destacar que durante el desarrollo de una droga, para ingresar a la fase clínica, primero se realiza la fase preclínica en modelos animales; y estos datos ya fueron divulgados en D1. El ingreso de una droga a fase clínica no involucra un paso inventivo, especialmente si la efectividad de la misma contra Coronavirus ya formaba parte del estado de la técnica.

Con respecto a las reivindicaciones que intentan reivindicar un método para la prevención de la infección por 2019-nCoV/SARS-CoV-2 o de la COVID-19 (rvs. 46, 49-50, 53-56, 73-75), la memoria descriptiva aclara definiciones generales de los términos "prevenir y previniendo": *"Tal como se utiliza en el presente documento, los términos "prevenir" y "previniendo" incluyen la prevención de la recurrencia, propagación o aparición. No se pretende que la presente divulgación se limite a la prevención completa. En algunas realizaciones, el inicio se retrasa o se reduce la gravedad de la enfermedad"* (pág. 10). Sin embargo, no se dan más detalles sobre los alcances y condiciones del término "prevención completa" efectiva por los métodos que se intentan divulgar. En relación a estas descripciones, el único ejemplo que existe en la memoria descriptiva que intenta respaldar este tipo de reivindicaciones es el Ejemplo 29 (pág. 268-271) en donde se ensaya la administración oral (por sonda) del compuesto EIDD-2801 (únicamente) en un grupo de ratones (machos y hembras) durante 5 días, previo a "la inoculación intranasal de 1.10^4 unidades formadoras de placas (UFP) del virus SARS CoV MA15". De manera adicional a la falta de novedad de dichos ensayos (que fueron ya divulgados en D1), los mismos carecen de suficiencia descriptiva para respaldar la "profilaxis" en humanos ya que lo descripto en estos ensayos no permitiría a un técnico en la materia reproducir dichas condiciones para lograr los efectos reivindicados en las rvs. 46, 49-50, 53-56, 73-75. En este sentido, tampoco se detalla, en ninguno de los ejemplos, como alguna de las múltiples combinaciones que se intentan reivindicar serán efectivas al efecto de "prevenir" infección por 2019-nCoV/SARS-CoV-2 o de la COVID-19.

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2942

Conclusión: La patentabilidad de las reivindicaciones 46-56, 67-70 y 73-77 está expresamente excluida de acuerdo al art. 6 de la Ley 24.481. Además, tampoco cumplen con los requisitos de novedad, actividad inventiva, aplicación industrial y suficiencia descriptiva establecidos en los art. 4 y 20 de la Ley 24.481.

Comparación de sustituciones reivindicadas en la presente solicitud* y en D1.
*Los términos subrayados corresponden a las diferencias con respecto a D1.

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	**Reivindicaciones de D1 WO2019113462**
17. A pharmaceutical composition <u>for the treatment of 2019nCoV/SARS-CoV-2 infection</u>, wherein the compound is a compound of Formula II,  **Formula II** or a <u>tautomer thereof,</u> or a pharmaceutical salt or physiological salt thereof, wherein	2. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula II,  **Formula II** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein
X es CH2, CHCH3, C(CH3)2, CHF, CF2 o CD2;	X is CH2, CHCH3, C(CH3)2, CHF, CF2, or CD2;
Y es N o CR';	Y is N or CR';
Z es N o CR";	Z is N or CR";
R' es <u>hidrógeno,</u> deuterio, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heteroarilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, cicloalquilo, heterociclilo, o carbonilo, caracterizada porque R' está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	R' is deuterium, halogen, hydroxyl, amino, thiol, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, cycloalkyl, heterocyclyl, or carbonyl, wherein R' is optionally substituted with one or more, the same or different, R10;
R" es hidrógeno, deuterio, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heteroarilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, cicloalquilo, heterociclilo, hidroxilo, tiol o carbonilo, R" está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	R" is hydrogen, deuterium, halogen, hydroxyl, amino, thiol, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, cycloalkyl, heterocyclyl, hydroxyl, thiol, or carbonyl, wherein R' is optionally substituted with one or more, the same or different, R10;

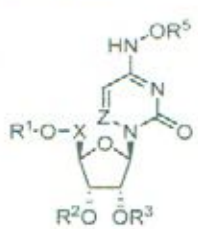
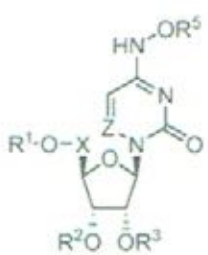
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
R1, R2, R3 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de H, o, junto con el oxígeno al cual ellos están enlazados, forman ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de D-aminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de L-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,N-disustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato	R1, R2, R3, and R5 are each independently selected from H, optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R2, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10;

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R2, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	
con la condición de que R1, R2, R3 y R5 no sean todos H;	with the proviso that R1, R2, R3, and R5 are not all H;
R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11;	R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11;
R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio,	R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino,

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
20. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de Fórmula III,  **Formula III** o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque X es CH2, CHCH3, C(CH3)2, CHF, CF2 o CD2; Z es N o CR"; R" es hidrógeno, deuterio, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heteroarilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, cicloalquilo, heterociclilo, hidroxilo, tiol o carbonilo, R" está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente,R10; R1, R2, R3 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de H, o, junto con el oxígeno al cual ellos están enlazados, forman ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres	3. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula III,  **Formula III** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein X is CH2, CHCH3, C(CH3)2, CHF, CF2, or CD2; Z is N or CR"; R" is deuterium, halogen, hydroxyl, amino, thiol, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, cycloalkyl, heterocyclyl, hydroxyl, thiol, or carbonyl, wherein R"" is optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R1, R2, R3, and R5 are each independently selected from H, optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally

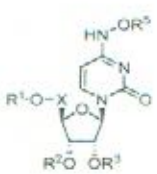
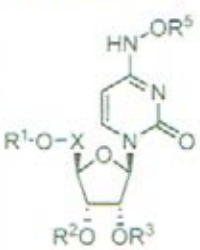
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de aminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB,	substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2049

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
caracterizada porque R1, R2, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; con la condición de que R1, R2, R3 y R5 no sean todos H;	wherein R1, R2, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; with the proviso that R1, R2, R3, and R5 are not all H;
R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11;	R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11;
R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo;	R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl,
Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un	

Ma. M. Loreta Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
lípido tal como se describe en el presente documento.	sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
22. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula IV,  Formula IV o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque X es CHCH3, C(CH3)2, CHF, CF2 o CD2; R1, R2, R3 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de H, o, junto con el oxígeno al cual ellos están enlazados, forman ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido,	4. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula IV,  Formula IV or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein X is CHCH3, C(CH3)2, CHF, CF2, or CD2; R1, R2, R3, and R5 are each independently selected from H, optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted

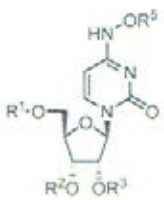
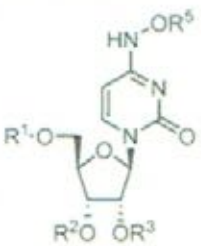
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 50 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido,oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R2, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; con la condición de que R1, R2, R3 y R5 no sean todos H; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi,carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino,	oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R2, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; with the proviso that R1, R2, R3, and R5 are not all H; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
(alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11;	aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11;
R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo;	R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and
Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento. .	Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
23. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por	5. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically

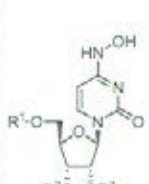
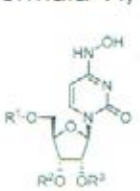
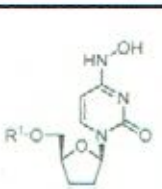
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula V,  **Formula V** o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque	acceptable excipient and a compound of Formula V,  **Formula V** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein
-O-R1, -O-R2, -O-R3, y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de L-	R1, R2, R3, and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
aminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R2, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo,	esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R2, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. P. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbociclitio, heterocarbociclitio, ariltio, heteroariltio, heterociclitio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo;y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
24. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula VI,  Formula VI	6. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula VI,  Formula VI  Formula VI

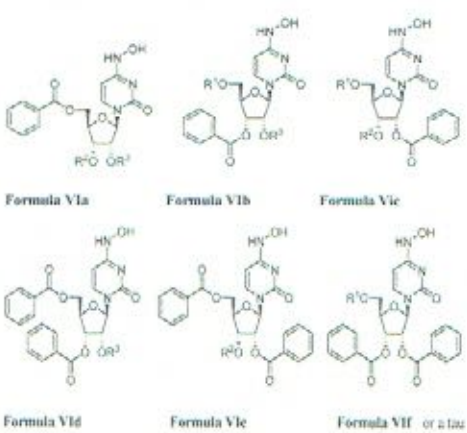
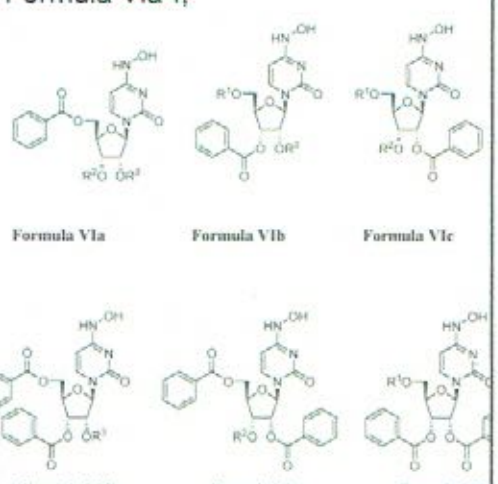
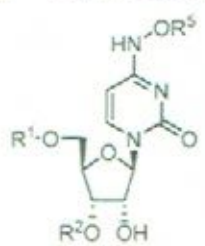
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R1, -O-R2, y -O-R3 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, ésteres de L-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,N-disustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, éster de oximetoxi amino, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato pcionalmente	or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R1, R2, and R3 are each independently selected from the following: optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally

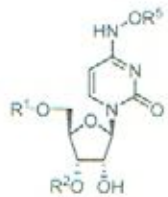
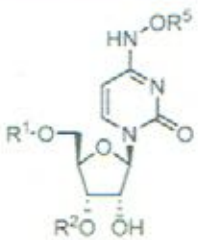
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2349

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R2 y R3 están opcionalmente sustituidos con uno o más, igual o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi,carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo;	substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R2, and R3 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 5049

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
25. La composición farmacéutica de acuerdo con la Reivindicación 24, caracterizada porque el compuesto tiene la Fórmula VIa-f,  Formula VIa Formula VIb Formula VIc Formula VId Formula VIe Formula VIf or a tau o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o fisiológica del mismo	7. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula VIa-f,  Formula VIa Formula VIb Formula VIc Formula VId Formula VIe Formula VIf or a pharmaceutical or physiological salt thereof
27. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula VII	8. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula VII,  Formula VII

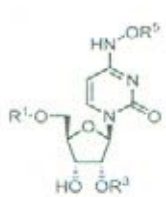
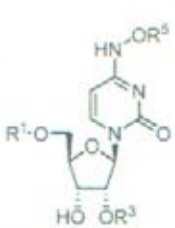
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
 Formula VII	 Formula VII
o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque	or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein
-O-R1, -O-R2, y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, Stiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente	R1, R2, and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R2 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R2, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10;
R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11;	R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11;
R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino,	R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
(alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11- C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
28. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula VIII,  **Formula VIII** o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R1, -O-R3, y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-	9. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula VIII,  **Formula VIII** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R1, R3, and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates,

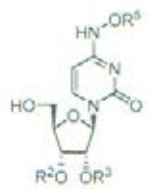
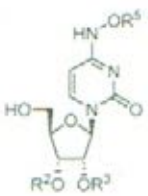
Dra. M. Lorena Di Cicco
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, Stiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente ustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil) ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo,	optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, eterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo;y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupon alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
29. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula IX,	10. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula IX,

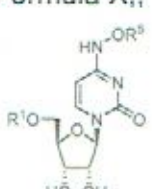
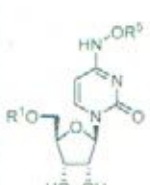
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2349

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
 Formula IX	 Formula IX
un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque	or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein
-O-R2, -O-R3, y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, Stiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos,éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo	R2, R3, and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil) ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil) ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada orque R2, R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R2, R3, and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10;
R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo,caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11;	R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11;
R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino,	R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
(alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
30.Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula X,,  Formula X o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R1 y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato	11. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula X,  Formula X or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R1 and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates,

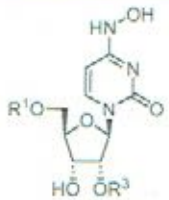
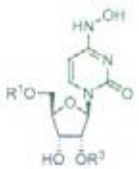
M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2248

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil) ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi,	optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1 and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C.A.M.D.P.
T° 060 F° 508 C.F.A.M.D.P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2948

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi,heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
31.Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XI,,	12. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XI,

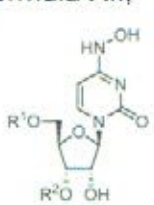
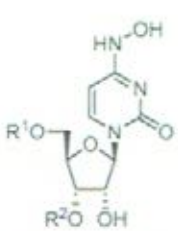
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2349

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
 Formula XI	 Formula XI
un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque	or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein
-O-R1 y -O-R3 son cada uno independientemente seleccionados de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos,	R1 and R3 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted
ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido,	S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 508 C. F. A. M. D.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil) ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil) ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1 y R3 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino,	substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1 and R3 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Matr. 2949

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a Cl 1-C22 higher alkyl, Cl 1-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
32. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XII,  **Formula XII** o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R1 y -O-R2 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos,	13. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XII,  **Formula XII** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R1 and R2 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates,

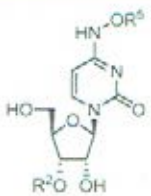
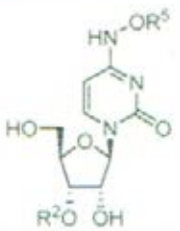
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida pcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R1 y R2 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi,	optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R1 and R2 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2349

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio,heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
33. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XIII	14. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XIII,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
 Formula XIII un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R2 y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de D-aminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo	 Formula XIII or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R2 and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally

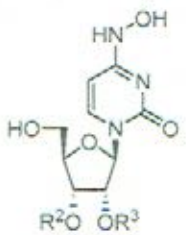
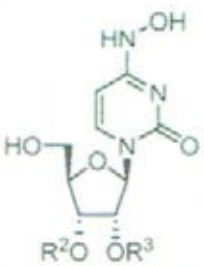
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R2 y R5 son opcionalmente sustituidos con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino,	substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R2 and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy,

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 050 F° 503 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2349

34. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XIV,	15. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XIV,
 **Formula XIV**	 **Formula XIV**
o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque	or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein
-O-R2 y -O-R3 son cada uno independientemente seleccionados de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de	R2 and R3 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates,
sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido,	optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl,
oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido,	optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl,
oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo,	L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid

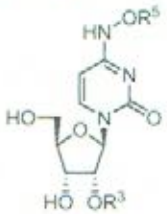
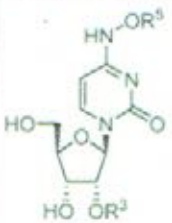
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R2 y R3 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino,	esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R2 and R3 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 050 Fº 508 C. F. A. M. B. A.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2049

(alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.

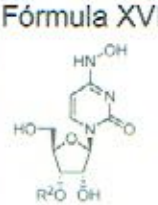
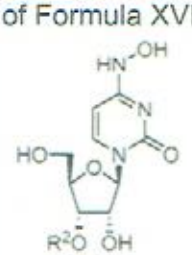
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 503 C. F. A. M. D.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
35. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XV ,  **Formula XV** o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R3 y -O-R5 se seleccionan cada uno independientemente de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonatosustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-	16. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XV,  **Formula XV** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R3 and R5 are each independently selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2949

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R3 y R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo,	esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R3 and R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2998

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
36. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XVI,  Formula XVI o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R2 se selecciona de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo, opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato	17. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XVI,  Formula XVI or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R2 is selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates,

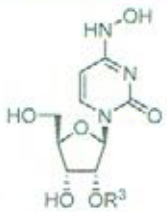
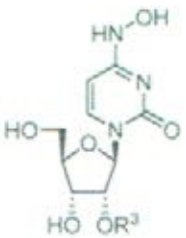
va. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. B. A.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2019

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituido, Stiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R2 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo,	optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxycarbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R2 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 503 C. F. A. M. D. B.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2949

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; y Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
37. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XVII,	18. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XVII,

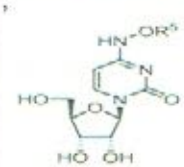
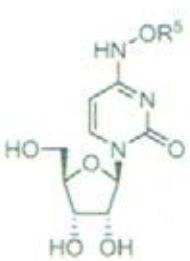
Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
 **Formula XVII** un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R3 se selecciona de los siguientes: ésteres opcionalmente sustituidos, ésteres ramificados opcionalmente sustituidos, carbonatos opcionalmente sustituidos, carbamatos opcionalmente sustituidos, tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, Stiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo	 **Formula XVII** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R3 is selected from the following: optionally substituted esters, optionally substituted branched esters, optionally substituted carbonates, optionally substituted carbamates, optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxycarbonyl, optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 69 C.A.M.D.P.
T° 350 F° 508 C.F.A.M.D.F.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2948

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, emiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R3 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10;	susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R3 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10;
R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11;	R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11;
R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino,	R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy,

Lic. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2949

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
(alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.
38. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2, que comprende un excipiente aceptable desde el punto de vista farmacéutico y un compuesto de la Fórmula XIX,  **Formula XIX** o un tautómero del mismo, o una sal farmacéutica o sal fisiológica del mismo, caracterizada porque -O-R5 se selecciona de los siguientes: tioésteres opcionalmente sustituidos, tioésteres ramificados opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbonatos de sulfenilo, tiocarbonatos de sulfenilo opcionalmente sustituidos, éster de 2-hidroxipropanoato, éster de 2-hidroxipropanoato opcionalmente sustituido, S-tiocarbonato opcionalmente sustituido, ditiocarbonatos opcionalmente sustituidos, tiocarbamatos opcionalmente sustituidos, oximetoxicarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxicarbonato, oximetoxicarbonato opcionalmente sustituido,	20. A pharmaceutical composition comprising a pharmaceutically acceptable excipient and a compound of Formula XIX,  **Formula XIX** or a pharmaceutical or physiological salt thereof, wherein R5 is selected from the following: optionally substituted thioesters, optionally substituted branched thioesters, optionally substituted thiocarbonates, optionally substituted S-thiocarbonate, optionally substituted dithiocarbonates, optionally substituted thiocarbamates, optionally substituted oxymethoxy carbonyl,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
oximetoxitiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetilcarbonilo opcionalmente sustituido, oximetiltiocarbonilo opcionalmente sustituido, oximetoxitiocarbonato, oximetoxitiocarbonato opcionalmente sustituido, ésteres de L-aminoácidos, ésteres de Daminoácidos, éster de oximetoxi amino, ésteres de Laminoácidos N-sustituidos, ésteres de L-aminoácidos N,Ndisustituidos, ésteres de D-aminoácidos N-sustituidos, ésteres de D-aminoácidos N,N-disustituidos, sulfenilo, sulfinilo, sulfonilo, sulfito, sulfato, sulfonamida opcionalmente sustituidos, imidato opcionalmente sustituido, hidrazonato opcionalmente sustituido, oximilo opcionalmente sustituido, imidinilo opcionalmente sustituido, imidilo opcionalmente sustituido, aminal opcionalmente sustituido, hemiaminal opcionalmente sustituido, acetal opcionalmente sustituido, hemiacetal opcionalmente sustituido, carbonimidato opcionalmente sustituido, tiocarbonimidato opcionalmente sustituido, carbonimidilo opcionalmente sustituido, carbamimidato opcionalmente sustituido, carbamimidilo opcionalmente sustituido, tioacetal opcionalmente sustituido, S-acil-2-tioetilo opcionalmente sustituido, (aciloxibencil)éter, (aciloxibencil)éster, éster de PEG, PEG carbonato, bis-(aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, (aciloxibencil)ésteres opcionalmente sustituidos, o ésteres BAB, caracterizada porque R5 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R10; R10 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino,	optionally substituted oxymethoxythiocarbonyl, optionally substituted oxymethylcarbonyl, optionally substituted oxymethylthiocarbonyl, L-amino acid esters, D-amino acid esters, N-substituted L-amino acid esters, N,N-disubstituted L-amino acid esters, N-substituted D-amino acid esters, N,N-disubstituted D-amino acid esters, optionally substituted sulfenyl, optionally substituted imidate, optionally substituted hydrazonate, optionally substituted oximyl, optionally substituted imidinyl, optionally substituted imidyl, optionally substituted aminal, optionally susbstituted hemiaminal, optionally substituted acetal, optionally susbstituted hemiacetal, optionally substituted carbonimidate, optionally substituted thiocarbonimidate, optionally substituted carbonimidyl, optionally substituted carbamimidate, optionally substituted carbamimidyl, optionally substituted thioacetal, optionally substituted S-acyl-2-thioethyl, optionally substituted bis-(acyloxybenzyl)esters, optionally substituted (acyloxybenzyl)esters, and BAB-esters, wherein R5 are optionally substituted with one or more, the same or different, R10; R10 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino,

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
T° IX F° 89 C. A. M. D. P.
T° 060 F° 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Reivindicaciones de la presente solicitud WO2021159044	Reivindicaciones de D1 WO2019113462
cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo, caracterizada porque R10 está opcionalmente sustituido con uno o más, el mismo o diferente, R11; R11 es hidrógeno, deuterio, hidroxi, azido, tiol, amino, ciano, halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, carbociclilo, heterocarbociclilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, carbocicloxi, heterocarbocicloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloxi, cicloalcoxi, cicloalquenoxi, alquilamino, (alquil)2 amino, carbociclamino, heterocarbociclamino, arilamino, heteroarilamino, heterociclamino, cicloalcamino, cicloalquenamino, alquiltio, carbocicliltio, heterocarbocicliltio, ariltio, heteroariltio, heterocicliltio, cicloalquiltio, cicloalqueniltio, alenilo, sulfinilo, sulfamoílo, sulfonilo, lípido, nitro o carbonilo; Lípido es un alquilo superior C11-C22, alcoxi superior C11-C22, polietilenglicol, o arilo sustituido con un grupo alquilo, o un lípido tal como se describe en el presente documento.	cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl, wherein R10 is optionally substituted with one or more, the same or different, R11; R11 is deuterium, hydroxy, azido, thiol, amino, cyano, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, carbocyclyl, heterocarbocyclyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkoxy, carbocycloxy, heterocarbocycloxy, aryloxy, heteroaryloxy, heterocycloxy, cycloalkoxy, cycloalkenoxy, alkylamino, (alkyl)2amino, carbocyclamino, heterocarbocyclamino, arylamino, heteroarylamino, heterocyclamino, cycloalkamino, cycloalkenamino, alkylthio, carbocyclylthio, heterocarbocyclylthio, arylthio, heteroarylthio, heterocyclylthio, cycloalkylthio, cycloalkenylthio, allenyl, sulfmyl, sulfamoyl, sulfonyl, lipid, nitro, or carbonyl; and Lipid is a C11-C22 higher alkyl, C11-C22 higher alkoxy, polyethylene glycol, or aryl substituted with an alkyl group, or a lipid as described herein.

C) Consideraciones finales

La presente solicitud pretende proteger composiciones farmacéuticas comprendiendo el compuesto N4-hidroxicitidina (o EIDD-1931) y prodrogas del mismo, para el tratamiento de la infección por 2019nCoV/SARS-CoV-2 o de la COVID-19; así como métodos de tratamiento o prevención de la misma. Los compuestos incluyen compuestos de Fórmulas Markush (I-VI, VIa-f, VII-XVIII, XIX, XXI) y los compuestos seleccionados EIDD-1931, EIDD-2801; EIDD-2800 o EIDD-2898. También, tanto en las reivindicaciones de composición como en las de métodos de tratamiento, se pretende reivindicar una amplia cantidad de combinaciones de dichos compuestos con otros antivirales comprendidos dentro del estado de la técnica.

El presente análisis ha demostrado que, en resumen, el objeto de la invención no presenta novedad, altura inventiva y no se demuestra un avance real sobre el estado de la

Dra. M. Lorena Di Giano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

técnica no evidente para una persona versada en la materia, en vista del arte previo analizado. En particular, las reivindicaciones 1-41 referidas a composiciones farmacéuticas no son claras en cuanto al objeto que se pretende proteger, y además no cumplen con los requisitos de patentabilidad de novedad, actividad inventiva y suficiencia descriptiva, lesionando lo establecido en los artículos 4, 20 y 22 de la Ley 24.481. Las reivindicaciones 57-66, 71-72 se refieren a una composición que comprende una combinación de los compuestos con otros antivirales conocidos, las mismas no sólo no presentan altura inventiva ni suficiencia descriptiva, sino que están expresamente excluidas de acuerdo al art. 6 de la Ley 24.481 (inciso f)). Las reivindicaciones 42-45 pretenden caracterizar la composición mediante el agregado de un propelente, y que dicha composición esté comprendida en un recipiente presurizado. Como fue detallado en el presente documento, las mismas no presentan novedad, altura inventiva ni suficiencia descriptiva.

Por otro lado, la patentabilidad de las reivindicaciones referidas a métodos de tratamiento o prevención (rvs. 46-56, 67-70 y 73-77), está expresamente excluida de acuerdo al art. 6 de la Ley 24.481; y tampoco cumplen con los requisitos de novedad, actividad inventiva, aplicación industrial y suficiencia descriptiva establecidos en los art. 4 y 20 de la Ley 24.481.

En vista de lo previamente expresado, se sugiere el rechazo de la presente solicitud en su totalidad dado que no cumple con los requisitos de patentabilidad establecidos en la Ley 24.481; lesionando los artículos 4, 6, 20 y 22.

6.- Petitorio:

Por lo expuesto solicitamos:

1) Se nos tenga por presentados en el carácter invocado;

2) Se tenga por presentada la Observación de Terceros contra la procedencia de la solicitud de patente "N4-HIDROXICITIDINA Y SUS DERIVADOS Y USOS ANTIVIRALES RELACIONADOS CON LA MISMA" fue presentada por EMORY UNIVERSITY en Argentina el 08-02-2021, con fecha de publicación 04-05-2022.

3) Se rechace la solicitud en su totalidad por no cumplir con los requisitos de la ley 24481 y normas complementarias.

PROVEER DE CONFORMIDAD QUE,

SERA JUSTICIA. -

JOSE MARIA DI BELLO
DNI 20.521.423

Dra. M. Laura Di Biano
ABOGADA
Tº IX Fº 89 C. A. M. D. P.
Tº 060 Fº 508 C. F. A. M. D. P.
Agente Prop. Industrial
Mat. 2249

Maria Lorena Di Giano - 23224756674
Digitally signed by PORTALTRAMITES - INPI
Date: 2022.06.22 17:24:37 -03:00
Reason: Firmado Digitalmente por el INPI
Location: Buenos Aires, Argentina