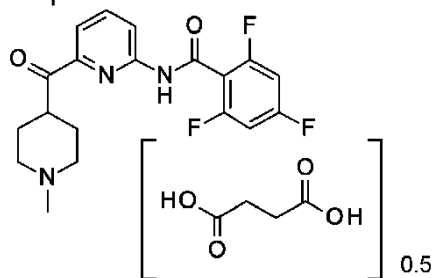


1. Un proces de preparare a compusului cu formula:

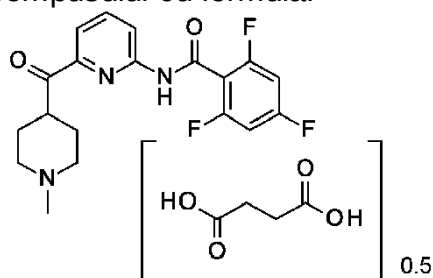


care conține următoarele etape:

- i.) Tratarea acidului de piperidină-4-carboxilic în condiții de aminare reductivă, cuprinzând formaldehidă și acid formic în apă cu tratament ulterior cu HCl apos urmat de distilarea apei și adăugarea de acetonitril, cu diluare/distilare repetată până când conținutul de apă nu depășește 0,2 % prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține clorhidrat solid de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic;
- ii.) Tratarea clorhidratului de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic cu un agent de clorinare, precum clorura de tionil, în clorobenzen, pentru a obține clorură de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic;
- iii.) Tratarea clorurii de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic cu N,N-dietilamină în clorobenzen care conține trietilamină cu spălare ulterioară a bazei și tratarea ulterioară cu HCl apos în izopropanol pentru a obține clorhidrat solid de hidrat de N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidă;
- iv.) Tratarea clorhidratului de hidrat de N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidă cu o bază minerală, precum NaOH apos, într-un solvent nepolar, precum eterul de metil-terț-butil, cu spălare ulterioară cu apă, separarea fazelor și distilarea solventului organic până când conținutul de apă nu depășește 0,1 % în greutate prin analiza Karl Fischer pentru a obține N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidă;
- v.) Tratarea ulterioară a N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidei cu (6-bromo-2-piridil)litiu într-un solvent organic nepolar, precum eterul metil-terț-butil, cu extracția ulterioară a amestecului rezultat cu apă și un solvent organic adecvat, cum ar fi *n*-butanolul, separarea fazelor și distilarea repetată a solventului organic până când conținutul de apă nu depășește 0,2 % în greutate prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă;
- vi.) Tratarea (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonei cu HBr apos și extragerea ulterioară cu *n*-butanol urmată de distilarea repetată a solventului organic până când conținutul de apă nu depășește 0,3 % prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține bromhidrat de (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă solid;
- vii.) Tratarea bromhidratului de (6-brom-2-piridil-1-metil-4-piperidil)metanonă cu o soluție de NH₃ în etilenglicol în prezența catalizatorului Cu₂O la aproximativ 80 °C timp de aproximativ 2 ore, cu spălări ulterioare cu apă, NaCl apos saturat și NaOH apos 20 % și extragerea ulterioară cu un solvent aprotic nepolar, cum ar fi eterul de metil-terț-butil, separarea fazelor, și tratarea fazei organice cu 5 % în greutate carbon;
- viii.) Filtrarea amestecului de mai sus, diluarea cu un solvent alcoolic polar adecvat, precum izopropanolul, și distilarea repetată a solventului organic până când conținutul de apă nu depășește 0,2 % prin analiza Karl-Fischer, cu tratarea ulterioară a rezidului rezultat cu izopropanol, apă și 20 % HCl în greutate, în care concentrația de apă a suspensiei rezultate este de cel puțin 2 %, filtrarea suspensiei rezultate și uscarea sub vid la 40 °C timp de 16-24 ore pentru a obține diclorhidrat de (6-amino-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă dihidrat solid;
- ix.) Tratarea diclorhidratului de (6-amino-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă dihidrat în clorobenzen cu 6 % greutate/greutate NaOH în apă la aproximativ 54 °C

timp de aproximativ 30 de minute, cu separarea fazelor ulterioare și distilarea în vid a soluției apoase pentru a obține (6-amino-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă;
 x.) Tratarea ulterioară a (6-amino-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonei cu clorură de acid 2,4,6-trifluorobenzoic în clorobenzen la aproximativ 100 °C timp de aproximativ 4 ore, cu răcirea ulterioară, încărcarea cu acetonitril și încălzirea suspensiei rezultate la 80 °C timp de aproximativ 1 oră și colectarea ulterioară a solidului rezultat prin filtrare, pentru a obține clorhidrat de 2,4,6-trifluor-N-[6-(1-metilpiperidin-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă solid;
 xi.) Tratarea clorhidratului de 2,4,6-trifluor-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă cu soluție apoasă saturată de Na₂CO₃ în eter de metil-terț-butil;
 xii.) Tratarea amestecului din pasul xi de mai sus cu SiO₂ cu filtrarea ulterioară, tratarea cu carbon, filtrarea și evaporarea, diluarea cu etanol și distilarea până când conținutul de apă nu depășește 1 % prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține 2,4,6-trifluor-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă;
 xiii.) Tratarea 2,4,6-trifluoro-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil] benzamidei în etanol cu o soluție de 0,5 echivalenți de acid succinic în etanol la aproximativ 55 °C timp de cel puțin 3 ore la temperatura camerei și colectarea ulterioară a solidului prin filtrare, pentru a obține hemisuccinat solid de 2,4,6-trifluor-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă.

2. Un proces de preparare a compusului cu formula:



care conține următoarele etape:

- i.) Tratarea acidului de piperidină-4-carboxilic în condiții de aminare reductivă, cuprinzând formaldehidă și acid formic în apă cu tratament ulterior cu HCl apos urmat de distilarea apei și adăugarea de acetonitril, cu diluare/distilare repetată până când conținutul de apă nu depășește 0,2 % prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține clorhidrat solid de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic;
- ii.) Tratarea clorhidratului de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic cu un agent de clorinare, precum clorura de tionil, în clorobenzen, obținerea clorurii de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic;
- iii.) Tratarea clorurii de acid 1-metilpiperidină-4-carboxilic cu N,N-dietilamină în clorobenzen care conține trietilamină cu spălare ulterioară a bazei și tratarea ulterioară cu HCl apos în izopropanol pentru a obține clorhidrat solid de hidrat de N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidă;
- iv.) Tratarea clorhidratului de N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidă cu o bază minerală, precum NaOH apos, într-un solvent nepolar, precum eterul de metil-terț-butil, cu spălare ulterioară cu apă, separarea fazelor și distilarea solventului organic până când conținutul de apă nu depășește 0,1 % în greutate prin analiza Karl Fischer pentru a obține N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidă;
- v.) Tratarea ulterioară a N,N-dietil-1-metil-piperidină-4-carboxamidei cu (6-bromo-2-piridil)litiu într-un solvent organic nepolar, precum eterul metil-terț-butil, cu extracția ulterioară a amestecului rezultat cu apă și un solvent organic adecvat, cum ar fi *n*-butanolul, separarea fazelor și distilarea repetată a solventului organic până când

conținutul de apă nu depășește 0,2 % în greutate prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă;

vi.) Tratarea (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonei cu HBr apos și extragerea ulterioară cu *n*-butanol urmată de distilarea repetată a solventului organic până când conținutul de apă nu depășește 0,3 % prin analiza Karl-Fischer, pentru a obține bromhidrat de (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă solid;

vii.) Tratarea bromhidratului de (6-bromo-2-piridil-1-metil-4-piperidil)metanonă într-un amestec bifazic de apă și toluen cu KOH solid timp de aproximativ 3 ore, cu separarea ulterioară a stratului organic și evaporarea solventului pentru a obține (6-bromo-2-piridil-1-metil-4-piperidil)metanonă;

viii.) Tratarea (6-bromo-2-piridil-1-metil-4-piperidil)metanonei cu 2,4,6-trifluorbenzamidă în toluen conținând K_2CO_3 , apă, $Pd(OAc)_2$ și Xantphos la aproximativ 70 °C timp de aproximativ 12 ore, până când conținutul de (6-bromo-2-piridil)-(1-metil-4-piperidil)metanonă nu este mai mare de 0,1 % prin HPLC, cu diluarea ulterioară a amestecului de reacție cu apă și EtOAc, tratarea ulterioară cu gel de siliciu modificat cu tiouree la 60 °C timp de aproximativ 8 ore, cu filtrare ulterioară pentru a obține o soluție de 2,4,6-trifluor-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă;

ix.) Tratarea unei soluții de 2,4,6-trifluoro-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă în EtOAc cu o soluție de aproximativ 0,5 echivalenți de acid succinic dizolvat în EtOH la 55 °C timp de aproximativ 3 ore, cu răcire ulterioară la temperatura camerei timp de aproximativ 10 ore și colectarea solidelor rezultate prin filtrare, pentru a obține hemisuccinat solid de 2,4,6-trifluor-N-[6-(1-metilpiperidină-4-carbonil)-2-piridil]benzamidă.

3. Un proces în conformitate cu Revendicarea 1 sau 2, în care reacțiile sunt realizate utilizând metodologia de procesare în loturi.

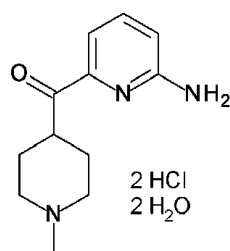
4. Un proces în conformitate cu Revendicarea 3 în care lotul produs este la scală de proces.

5. Un proces în conformitate cu Revendicarea 4 în care lotul produs este de cel puțin 1 kilogram.

6. Un proces în conformitate cu Revendicarea 4 în care lotul produs este de cel puțin 10 kilograme.

7. Un proces în conformitate cu Revendicarea 4 în care lotul produs este de cel puțin 100 de kilograme.

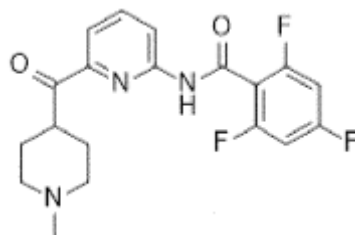
8. Un compus cu formula:



9. Compusul în conformitate cu Revendicarea 8, care este cristalin și care este **caracterizat printr-un** model de difracție pulbere cu raze X care utilizează radiație $CuK\alpha$, cu un vârf

intens la unghiul de difracție 2-teta de $8,3^\circ$ în combinație cu unul sau mai multe vârfuri selectate din grupa formată din $16,6^\circ$, $23,5^\circ$ și $33,7^\circ$ (respectiv $\pm 0,2^\circ$).

10. Utilizarea compusului în conformitate cu Revendicarea 8 la prepararea unui compus cu formula:



sau o sare acceptabilă farmaceutic a acesteia.

11. Utilizarea compusului în conformitate cu Revendicarea 8 la prepararea unui compus cu formula:

