

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-121512- -00001-0000

Fecha: 2010-10-28 17:14:44 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 63

Re: PI.-NEREUS PHARMACEUTICALS, INC.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "SÍNTESIS TOTAL DE SALINOSPORAMIDA A Y SUS ANÁLOGOS".-Clase C07D 487/14.-Expediente número 10-121.512.-

1. Me refiero a mi Solicitud de Patente de 30 de Septiembre de 2010.
2. Debidamente autorizado por mi representado, me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar en forma voluntaria un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al originalmente presentado.
3. Modificaciones al Capítulo Reivindicatorio

Sobre este particular, es preciso señalar que en el nuevo capítulo reivindicatorio se han realizado modificaciones principalmente en la redacción de las reivindicaciones con el objetivo de brindar mayor claridad al capítulo reivindicatorio de la solicitud. En consecuencia, de la lectura atenta del nuevo capítulo reivindicatorio se encuentra que la materia objeto reclamada no ha sido sustancialmente modificada.

El nuevo capítulo reivindicatorio consta de 38 reivindicaciones, las cuales encuentran sustento en la solicitud originalmente presentada de la siguiente manera:

- (a) Nueva reivindicación 1. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 1 originalmente presentada.
- (b) Nueva reivindicación 2. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 5 presentada actualmente ante esa oficina.
- (c) Nueva reivindicación 3. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 8 originalmente presentada.
- (d) Nueva reivindicación 4. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 12 originalmente presentada.

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

- (e) Nueva reivindicación 5. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 19 presentada actualmente ante esa oficina.
- (f) Nueva reivindicación 6. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 27 originalmente presentada.
- (g) Nueva reivindicación 7. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 35 originalmente presentada.
- (h) Nueva reivindicación 8. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 38 originalmente presentada.
- (i) Nueva reivindicación 9. Corresponde a la reivindicación 43 presentada actualmente ante ese Despacho.
- (j) Nueva reivindicación 10. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 47 presentada actualmente ante esa oficina.
- (k) Nueva reivindicación 11. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 52 originalmente presentada.
- (l) Nueva reivindicación 12. Corresponde a la reivindicación 57 originalmente presentada.
- (m) Nueva reivindicación 13. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 61 que se encuentra presentada actualmente ante esa oficina.
- (n) Nueva reivindicación 14. Corresponde a la reivindicación 80 presentada actualmente ante ese Despacho.
- (o) Nueva reivindicación 15. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 83 originalmente presentada.
- (p) Nueva reivindicación 16. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 89 presentada originalmente.
- (q) Nueva reivindicación 17. Corresponde a la reivindicación 92 presentada actualmente ante esa oficina.

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

(r) Nuevas reivindicaciones 18 y 19. Estas reivindicaciones encuentran debido sustento en las reivindicaciones 95 y 96 que se encuentran actualmente presentadas ante ese Despacho.

(s) Nueva reivindicación 20. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 99 presentada originalmente.

(t) Nueva reivindicación 21. Corresponde a la reivindicación 102 presentada actualmente ante ese Despacho.

(u) Nueva reivindicación 22. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 107 originalmente presentada.

(v) Nueva reivindicación 23. Esta reivindicación corresponde a la reivindicación 111 actualmente presentada ante esa oficina.

(w) Nueva reivindicación 24. Corresponde a la reivindicación 116 presentada actualmente ante ese Despacho.

(x) Nueva reivindicación 25. Esta reivindicación presenta debido sustento en la reivindicación 120 originalmente presentada.

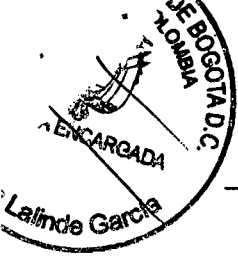
(y) Nuevas reivindicaciones 26 a 29. Estas reivindicaciones corresponden a las reivindicaciones 128 a 131 que se encuentran presentadas actualmente ante ese Despacho.

(z) Nuevas reivindicaciones 30 a 32. Corresponden a las reivindicaciones 138 a 140 que fueron presentadas originalmente.

(aa) Nueva reivindicación 33. Esta reivindicación encuentra debido sustento en la reivindicación 142 presentada actualmente ante esa oficina.

(bb) Nueva reivindicación 34. Corresponde a la reivindicación 144 presentada inicialmente ante ese Despacho.

(cc) Nuevas reivindicaciones 35 a 38. Nuevas reivindicaciones que encuentran debido sustento en la memoria descriptiva de la solicitud que se encuentra actualmente bajo trámite, específicamente en los esquemas 12 y 23 de las páginas 98 y 126, también en las páginas 97 (líneas 13 a 17), 98 a 100 y 126 (líneas 2-7).



JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

En relación con las anteriores modificaciones, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que las mismas **no amplían** de ninguna manera el alcance de la presente invención y que el nuevo capítulo reivindicatorio modificado es el que debe ser tenido en cuenta en el trámite de Fase Nacional.

4. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de correcciones y modificaciones;
- (b) Recibo número 10-78,270, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación; y
- (c) Copia de las páginas **167** a **225** que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de **38** reivindicaciones.

5. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

NOTARIA 41 DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE CUNDINAMARCA
REPUBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: Alicia Lloreda Ricaurte
Identificada (o) con: C.C. 39.690.713 y tarjeta profesional de abogado No. 39.690.713 del Consejo Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella (el) mismo en este escrito.
(Art. 84 C. P. C. Decreto. 2282/89 mod. 36)

Bogotá D.C., 28 OCT 2011

Alicia Lloreda Ricaurte
FIRMA DE LA COMPARECIENTE
ALICIA LLOREDA RICAURTE

C.C. No. 39.690.713 de Usaquén

Jimmy Nataly
Monales Beltrán
C.C. 1.015.393.013
VoBo.



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **NEREUS PHARMACEUTICALS, INC.**,
sociedad existente y organizada de conformidad con
las leyes del Estado de California, Estados Unidos de
América.
Dirección: 10480 Wateridge Circle, San Diego,
CA 92121, Estados Unidos de América.
Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701
E-mail: jllcco@lloredacamacho.com
Domicilio: San Diego, Estado de California, Estados
Unidos de América.

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 5° Piso

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

10-121.512

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones voluntarias al Capítulo
Reivindicatorio presentado en Fase Internacional.

⑥

Comprobante de pago No. 10-78,270

Fecha 20 de Septiembre de 2010

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

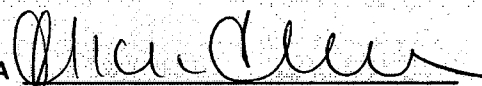
☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 78,270
FECHA : SEPTIEMBRE 20 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-121512- -00001-0000

Fecha: 2010-10-28 17:14:44 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 63

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	383647062	20/09/2010	19,267,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

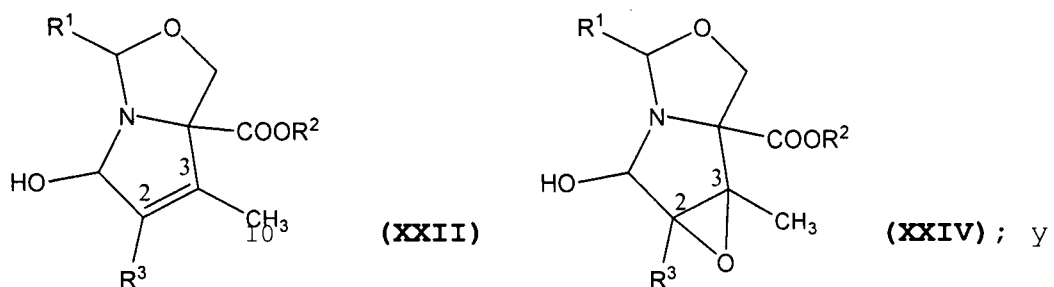
SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

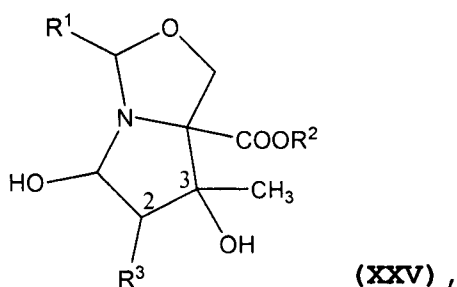
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un método de síntesis química caracterizado porque comprende: (a) oxidar un compuesto de la fórmula (XXII) para formar un compuesto de la fórmula (XXIV):



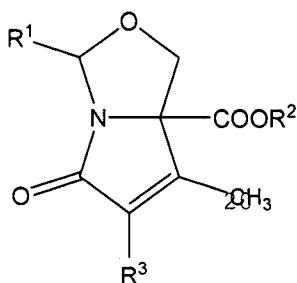
(b) romper el epóxido del compuesto de la fórmula (XXIV) para formar un compuesto de la fórmula (XXV):



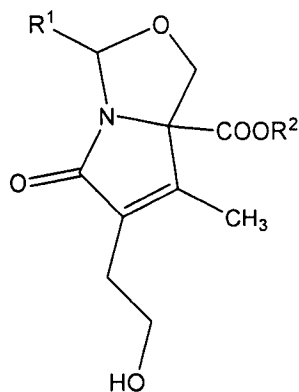
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin

sustituir o sustituido; y R^3 se elige del grupo que consiste de un C_{1-24} alquilo sin sustituir o sustituido, un C_{1-24} alquenilo sin sustituir o sustituido, un C_{1-24} alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C_{3-24} cicloalquilo sin sustituir o sustituido o un C_{3-24} cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C_{3-24} cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un aril(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido y un heteroarilo(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido.

2. El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque además comprende: oxidar R^3 del compuesto de la fórmula (XXII) a un aldehído y reducir el aldehído a un alcohol para formar un compuesto de la fórmula (VII)



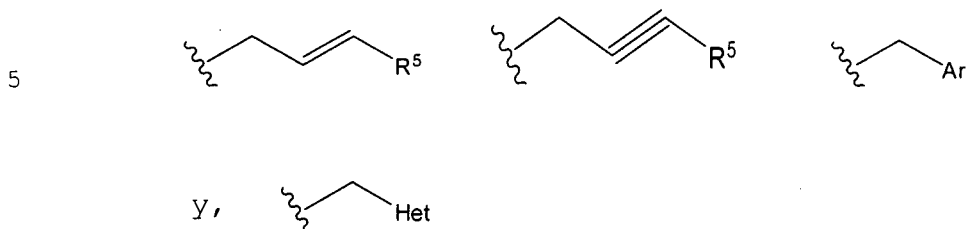
(XXII)



(VII)

en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de

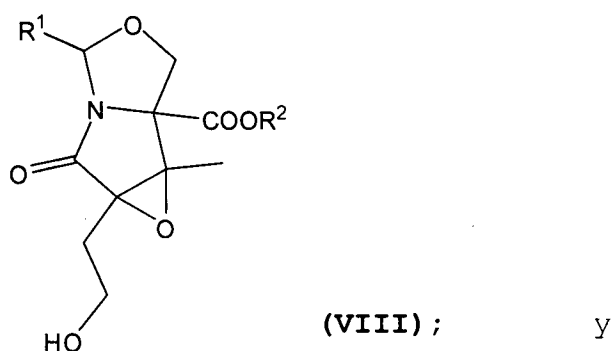
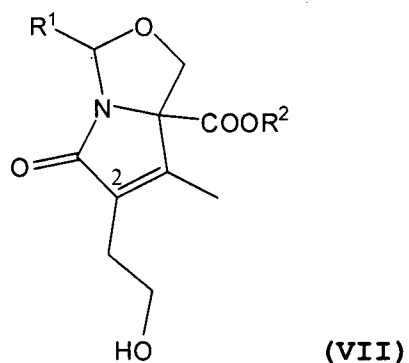
hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; R³ se elige del grupo que consiste de



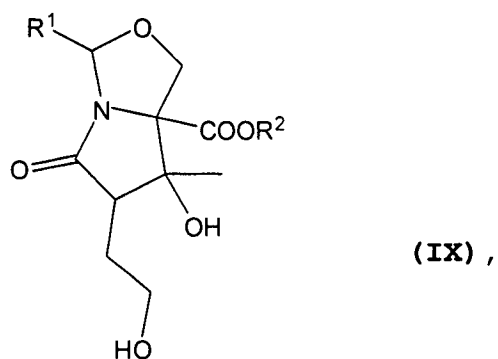
10 en donde Ar es un arilo sin sustituir o sustituido, Het es un heteroarilo sin sustituir o sustituido; y R⁵ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin

15 sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un aril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido y uno heteroarilo (C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido.

20 3. Un método de síntesis química, caracterizado porque comprende: (a) oxidar un compuesto de la fórmula (VII) para formar un compuesto a la fórmula (VIII):



(b) romper el epóxido del compuesto de la fórmula (VIII), para formar un compuesto de la fórmula (IX):

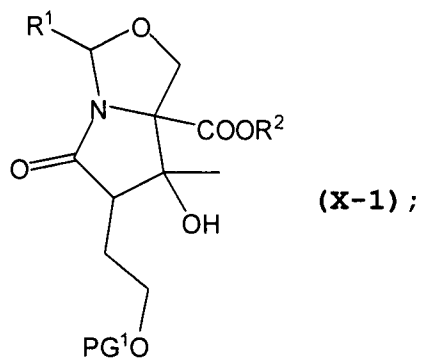


en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin

sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

- 5 4. Un método de síntesis química de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende:
- (a) proteger el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (IX) con PG^1 para formar un compuesto de la fórmula (X-1):

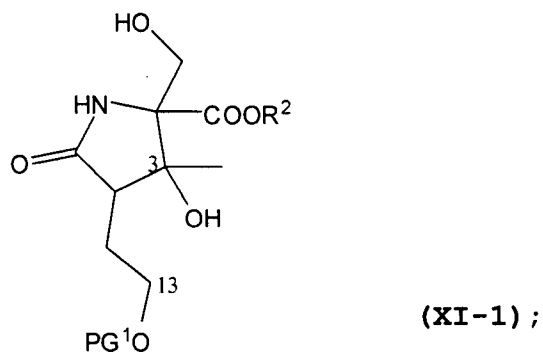
10



15

- (b) romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (X-1) para formar un compuesto la fórmula (XI-1):

20

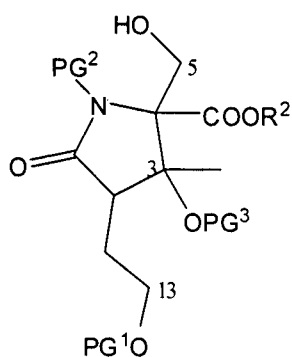


25

(c) proteger el grupo hidroxilo terciario C-3 del compuesto de la fórmula (XI-1) con PG^3 y proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula (XI-1) con PG^2 para formar un compuesto de la fórmula (XII-1):

5

10

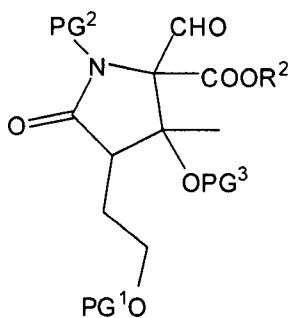


(XII-1);

(d) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-1) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-1):

15

20

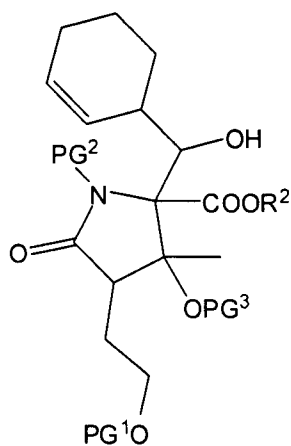


(XIII-1);

25

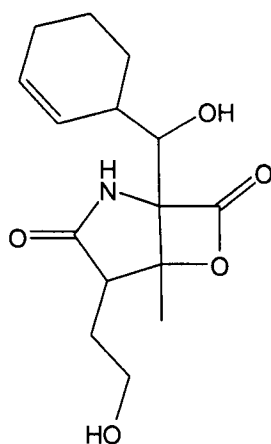
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-1) con una

porción órgano-metálica que comprende una porción ciclohexenilo para formar un compuesto de la fórmula (XIV-1):



(XIV-1); y

(f) retirar los grupos protectores, PG¹, PG² y PG³, de un compuesto de la fórmula (XIV-1) y formar un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la fórmula (XV):

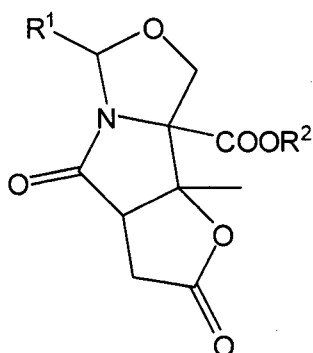


(XV);

en donde: R¹ se elige del grupo del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un

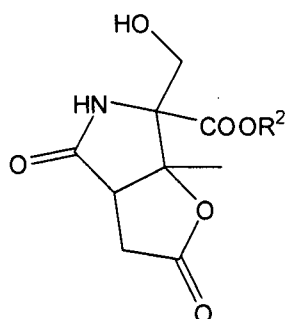
arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y PG^1 , PG^2 y PG^3 cada uno son un grupo protector separado.

5. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) oxidar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (IX) y formar una lactona de 5 miembros mediante una reacción de ciclización intramolecular para dar un compuesto de la fórmula (X-2):



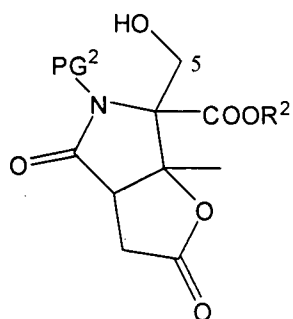
(X-2);

(b) romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (X-2) para formar un compuesto de la fórmula (XI-2):



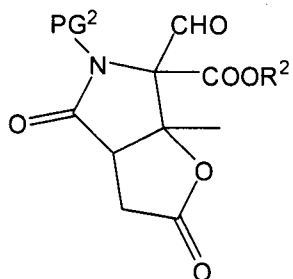
(XI-2);

(c) proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula (XI-2) con PG² para formar un compuesto de la fórmula (XII-2):



(XII-2);

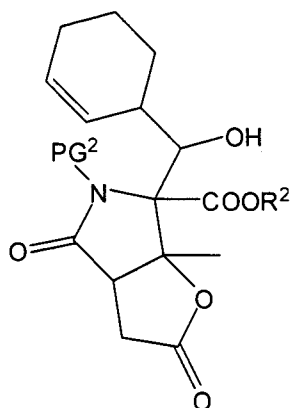
(d) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-2) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-2):



(XIII-2);

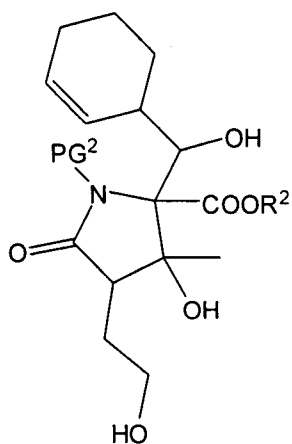
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-2) con una

porción órgano-metálica que comprende una porción ciclohexenilo para formar un compuesto de la fórmula (XIV-2):



(XIV-2);

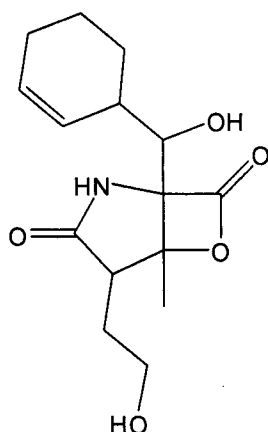
(f) romper la lactona de 5 miembros del compuesto de la fórmula (XIV-2) para formar un compuesto de la fórmula (XVII):



(XVII); y

(g) retirar PG² del compuesto de la fórmula (XVII) y formar

un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la fórmula (XV):



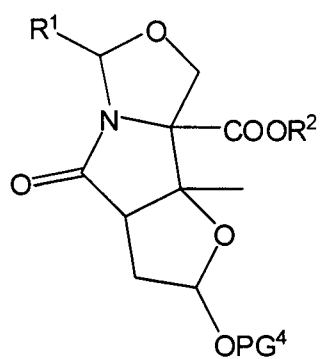
(XV);

10

en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y PG^2 es un grupo protector.

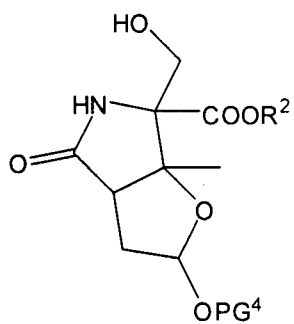
6. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) oxidar el alcohol C-13 a un aldehído y ciclizar el aldehído con el grupo hidroxilo terciario C-3 del compuesto de la fórmula (IX) para formar un anillo hemi-acetal y proteger el grupo hidroxilo secundario del anillo hemi-acetal para formar un compuesto de la fórmula (X-3):

25



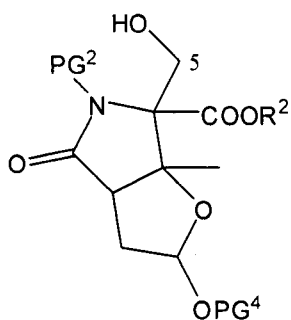
(X-3) ;

(b) romper el grupo aminal del compuesto de la fórmula (X-3) para formar un compuesto de la fórmula (XI-3):



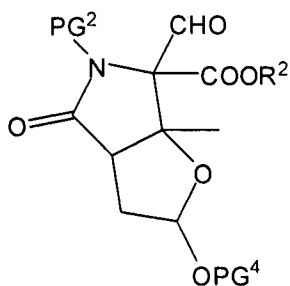
(XI-3) ;

(c) proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula (XI-3) con PG² para formar un compuesto de la fórmula (XII-3):



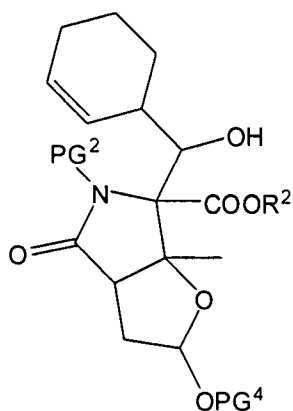
(XII-3) ;

(d) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-3) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-3):



(XIII-3);

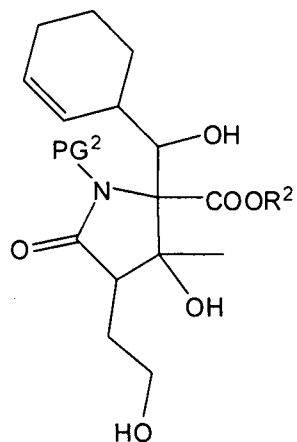
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-3) con una porción órgano-metálica que comprende una porción ciclohexenilo para formar un compuesto de la fórmula (XIV-3):



(XIV-3);

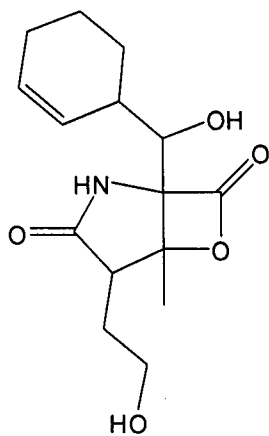
(f) retirar el grupo protector PG⁴ y romper en forma reductiva el anillo hemi-acetal del compuesto de la fórmula

(XIV-3) para formar un compuesto de la fórmula (XVII):



(XVII); y

(g) retirar PG² del compuesto de la fórmula (XVII) y formar un anillo beta-lactona para dar un compuesto la fórmula (XV):

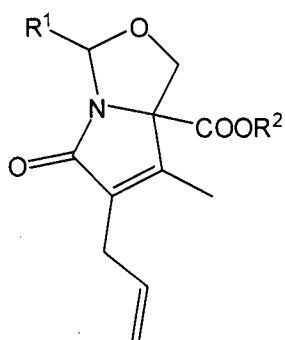


(XV);

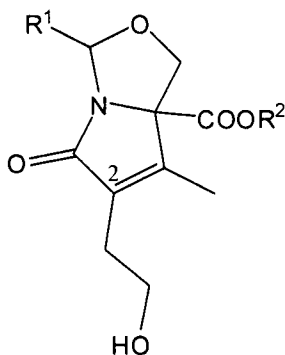
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno,
un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin

sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y PG^2 y PG^4 cada uno son un grupo protector separado.

7. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende oxidar el doble enlace terminal del sustituyente alilo en C-2 de un compuesto la fórmula (VI) a un aldehído y reducir el aldehído a un grupo hidroxí para formar un compuesto de la fórmula (VII):



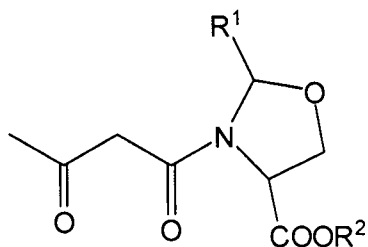
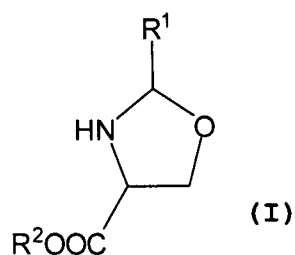
(VI)



(VII)

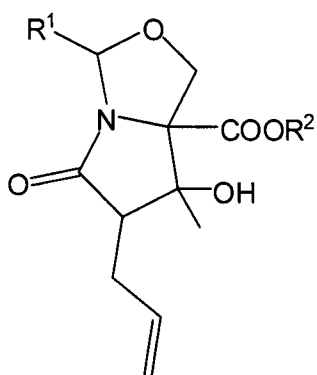
en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

8. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) reaccionar ácido acetoacético con un compuesto de la fórmula (I) para formar un compuesto de la fórmula (III-2):



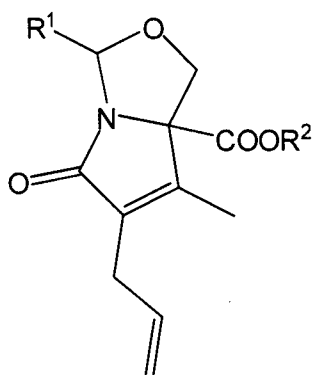
(III-2);

(b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular:



(V); y

(c) deshidratar el compuesto de la fórmula (V) para formar un doble enlace entre C-2 y C-3 y dar un compuesto la fórmula (VI):

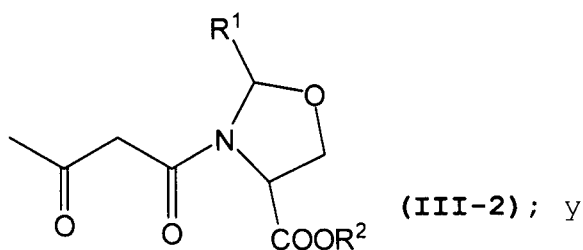
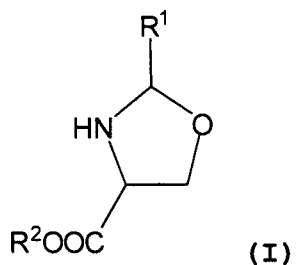


(VI) ,

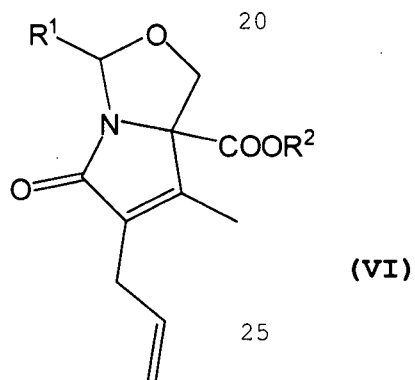
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

9. El método de conformidad con la reivindicación

3, caracterizado porque además comprende: (a) reaccionar ácido acetoacético con un compuesto de la fórmula (I) para formar un compuesto de la fórmula (III-2); y

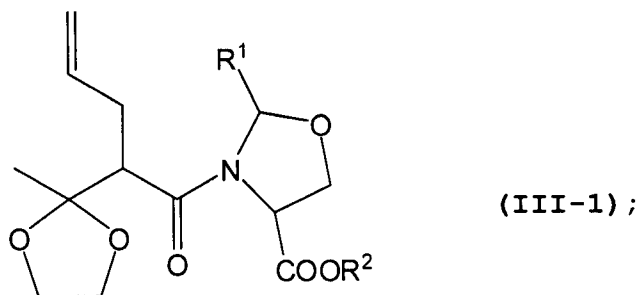
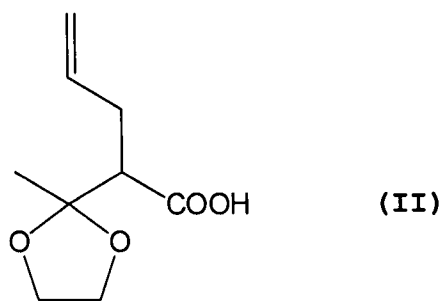
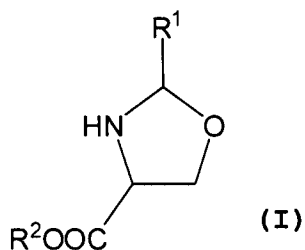


(b) reaccionar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante una reacción de condensación aldol intramolecular:

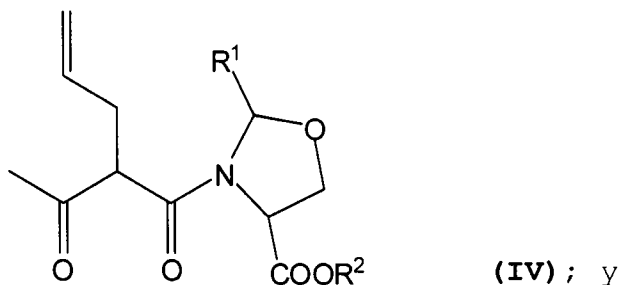


en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

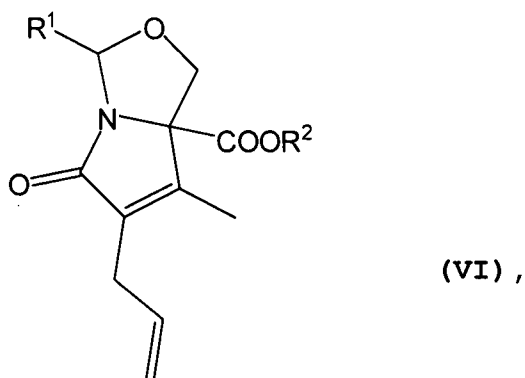
10. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) reaccionar un compuesto de la fórmula (I) con un compuesto de la fórmula (II) para formar un compuesto de la fórmula (III-1);



(b) romper el anillo acetal heterocíclico de 5 miembros del compuesto de la fórmula (III-1) para formar un compuesto de la fórmula (IV):



10 (c) formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante una reacción de condensación aldol intramolecular del compuesto de la fórmula (IV):

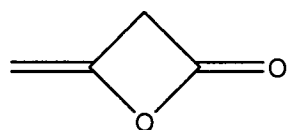


20 en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

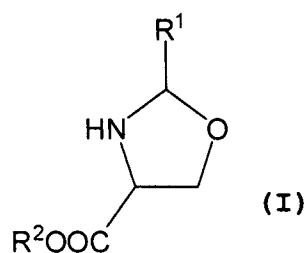
25 11. El método de conformidad con la reivindicación

3, caracterizado porque además comprende: a) agregar diceteno a un compuesto de la fórmula (I) para formar un compuesto de la fórmula (III-2);

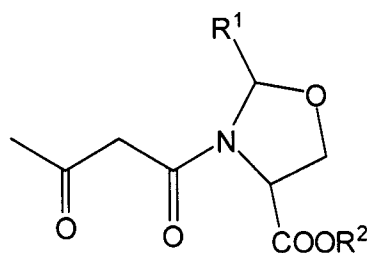
5

**diceteno**

10

**(I)**

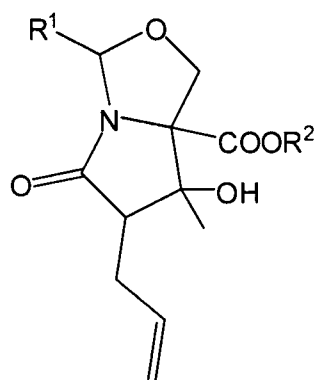
15

**(III-2) ;**

20

(b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular; y

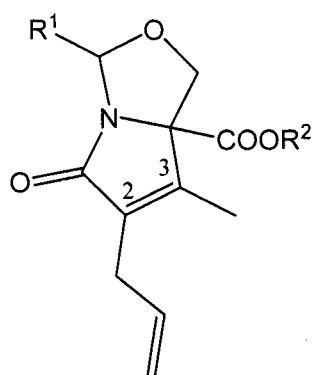
25



(V)

(c) deshidratar el compuesto de la fórmula (V) para formar un doble enlace entre C-2 y C-3 y dar el compuesto de la fórmula (VI):

10

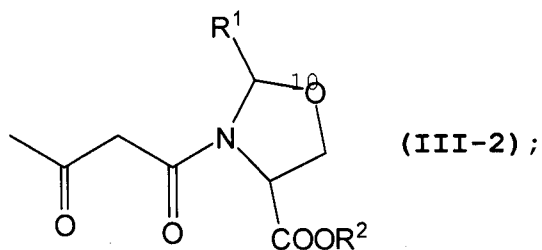
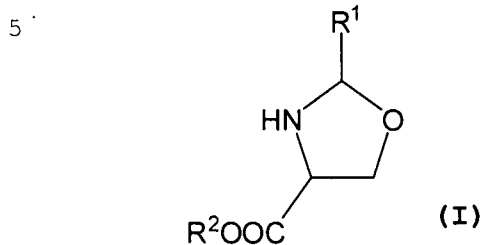
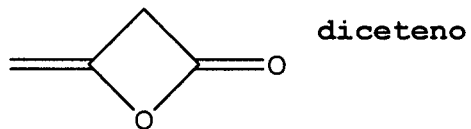


(VI) ,

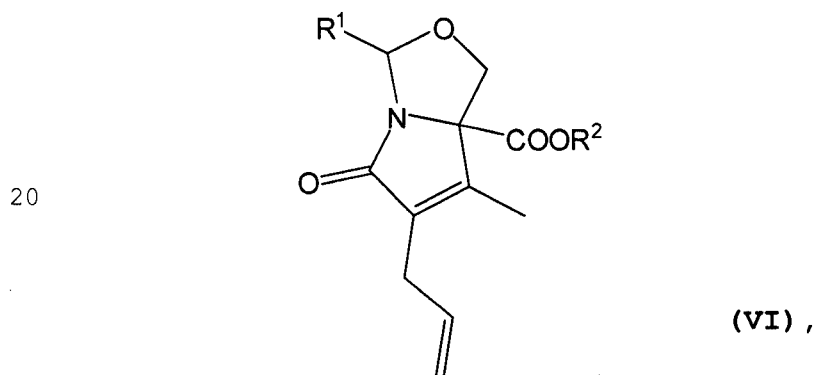
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

12. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) agregar diceteno a un compuesto de la fórmula (I) para formar un

compuesto de la fórmula (III-2); y



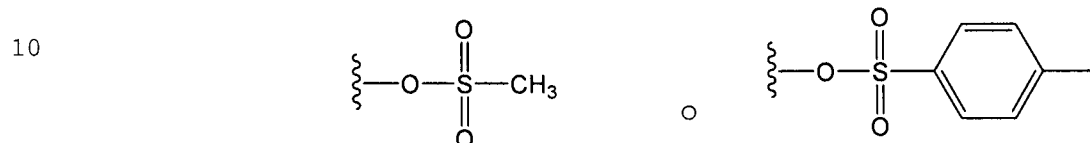
(b) reaccionar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro
15 de alilo y formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante
una reacción de condensación aldol intramolecular:



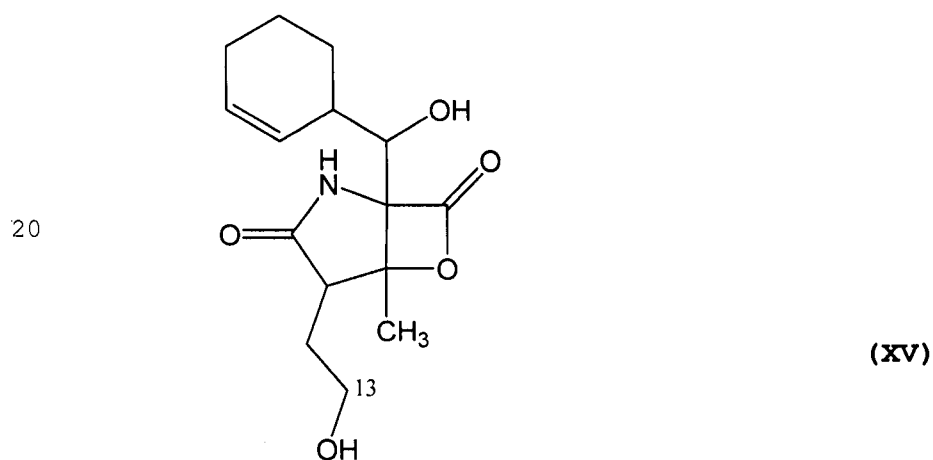
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno,
25 un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin

sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

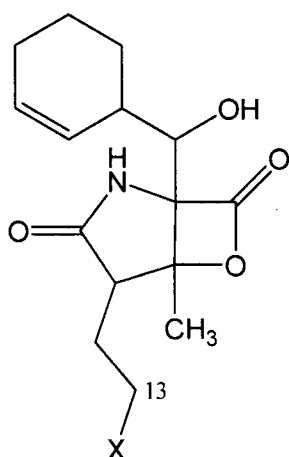
5 13. El método de conformidad con la reivindicación 4, caracterizado porque además comprende reemplazar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XV) con un halógeno,



para formar un compuesto de la fórmula (XVI), en donde el compuesto de la fórmula (XV) y el compuesto de la fórmula
15 (XVI) tienen las siguientes estructuras:



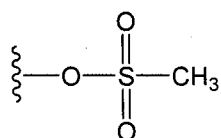
25



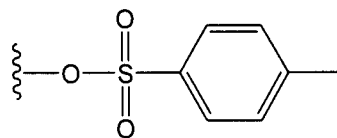
(XVI)

en donde X es un halógeno,

10



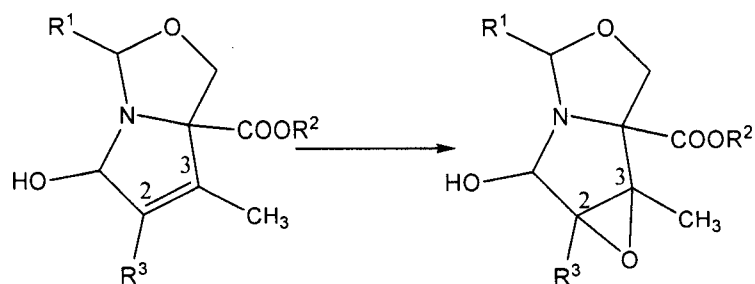
o.



15

14. Un método para formar un compuesto de la fórmula (XXIV), caracterizado porque comprende oxidar un compuesto de la fórmula (XXII) para formar un compuesto de la fórmula (XXIV):

20



(XXII)

(XXIV)

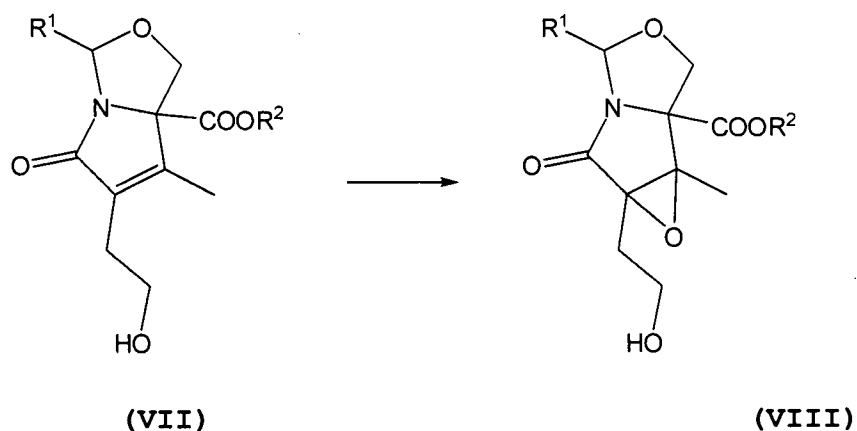
25

en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y R^3 se elige del grupo que consiste de un C_{1-24} alquilo sin sustituir o sustituido, un C_{1-24} alquenilo sin sustituir o sustituido, un C_{1-24} alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C_{3-24} cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C_{3-24} cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C_{3-24} cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un aril(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido y un heteroarilo(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido.

15. Un método para formar un compuesto de la fórmula (VIII), caracterizado porque comprende oxidar un compuesto de la fórmula (VII) para formar un compuesto de la fórmula (VIII):

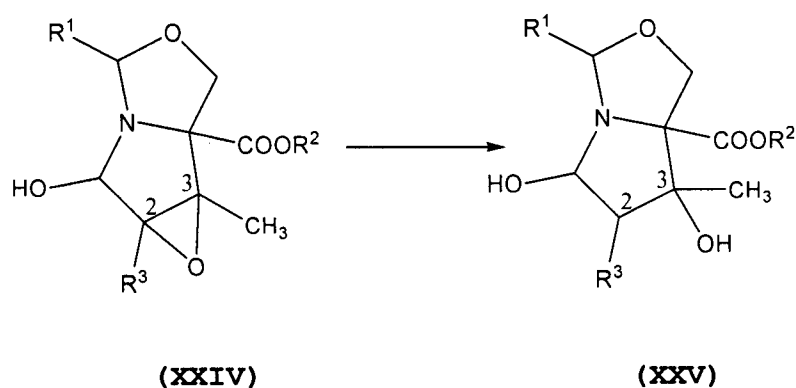
20

25



5 en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin
 10 sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

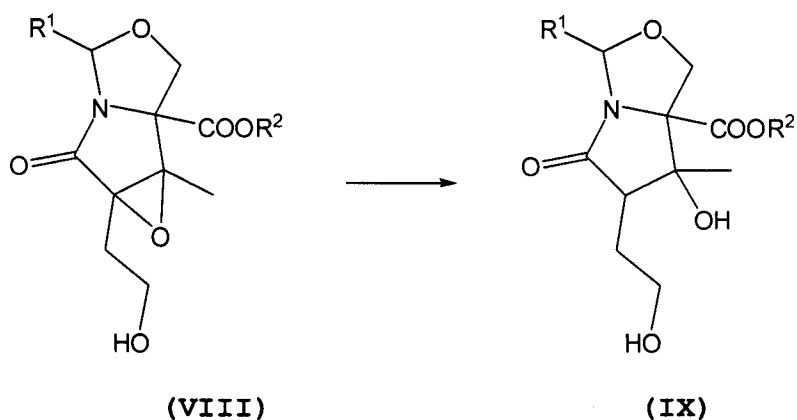
15 16. Un método para formar un compuesto de la fórmula (XXV) caracterizado porque comprende romper el epóxido de un compuesto de la fórmula (XXIV) para formar un compuesto de la fórmula (XXV)



25 en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un

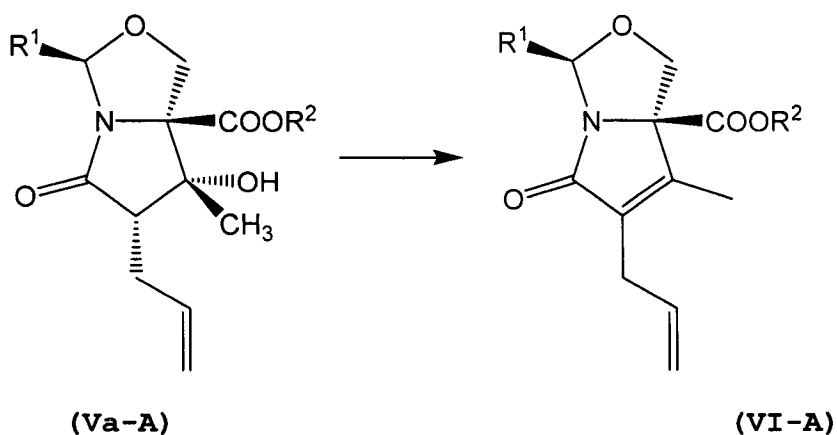
C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y R³ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido y un heteroarilo(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido.

17. Un método para formar un compuesto de la fórmula (IX) caracterizado porque comprende romper el epóxido de un compuesto de la fórmula (VIII) para formar un compuesto de la fórmula (IX)



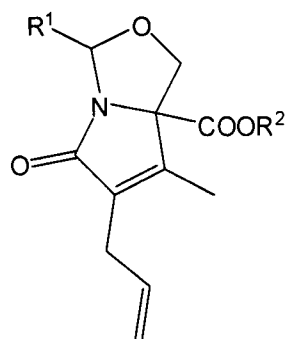
en donde R^1 se elige el grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se selecciona el grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

18. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VI-A) caracterizado porque comprende deshidratar un compuesto de la fórmula (Va-A) para formar un compuesto de la fórmula (VI-A)

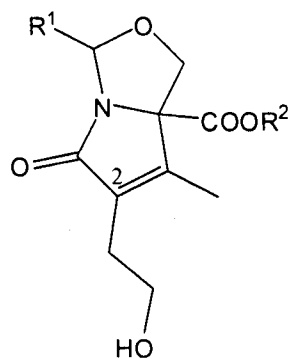


en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

19. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VII) caracterizado porque comprende oxidar el doble enlace terminal del sustituyente alilo en C-2 de un compuesto de la fórmula (VI) a un aldehído y reducir el aldehído a un grupo hidroxilo para formar un compuesto de la fórmula (VII):



(VI)

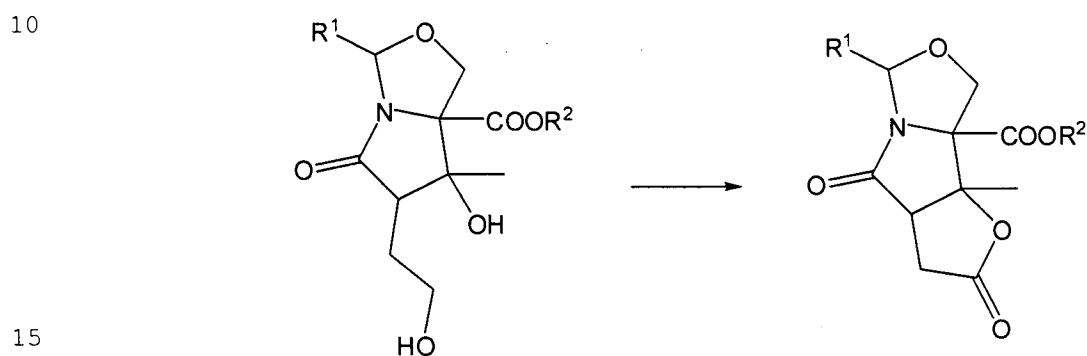


(VII)

en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin

sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

5 20. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (X-2), caracterizado porque comprende oxidar el grupo hidroxilo primario C-13 de un compuesto de la fórmula (IX) y formar una lactona de 5 miembros mediante una reacción de ciclización intramolecular



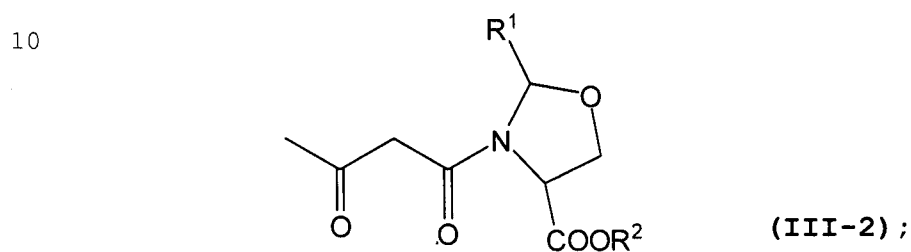
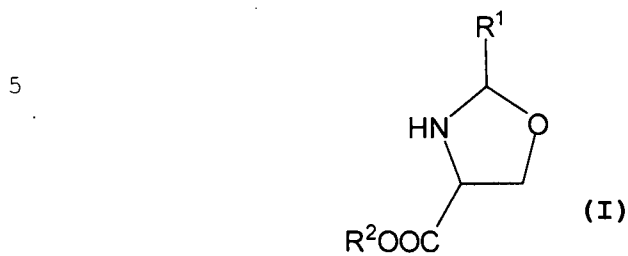
(IX)

(X-2)

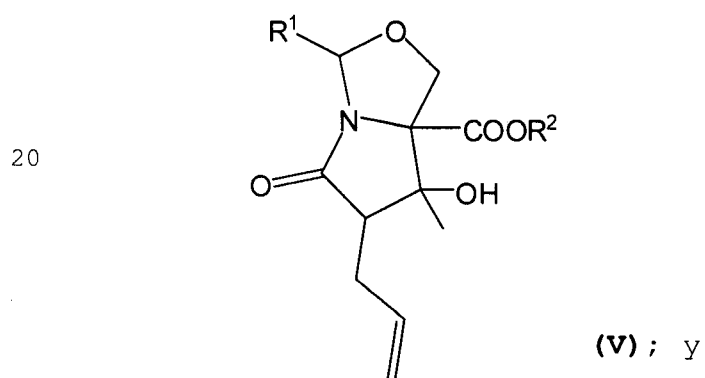
en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

25 21. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VI) caracterizado porque comprende: (a) reaccionar

ácido acetoacético con un compuesto de la fórmula (I) para formar un compuesto de la fórmula (III-2):

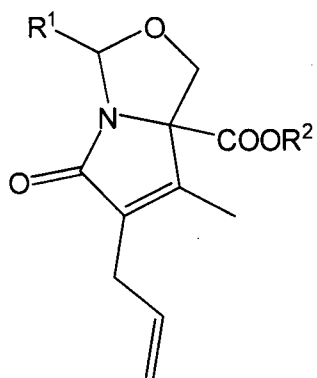


15 (b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular:



25 (c) deshidratar el compuesto de la fórmula (V) para formar un

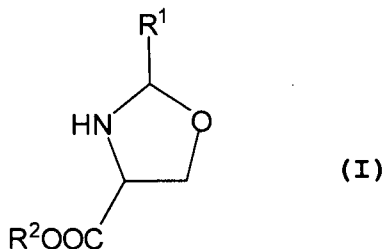
doble enlace entre C-2 y C-3 y dar un compuesto de la fórmula (VI):



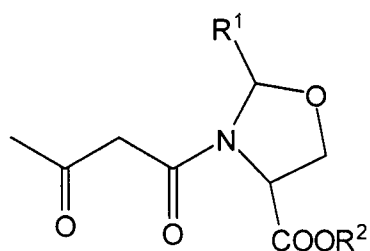
(VI) ,

10 en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin
15 sustituir o sustituido.

22. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VI) caracterizado porque comprende: (a) reaccionar ácido acetoacético con un compuesto de la fórmula (I) para formar un compuesto de la fórmula (III-2); y

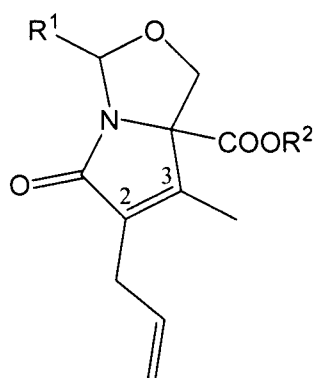


(I)



(III-2); y

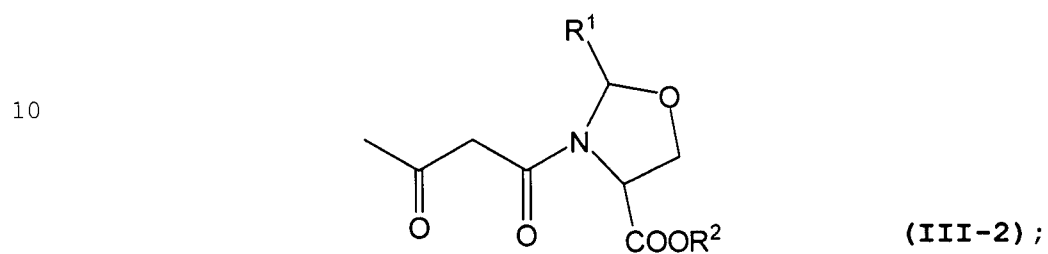
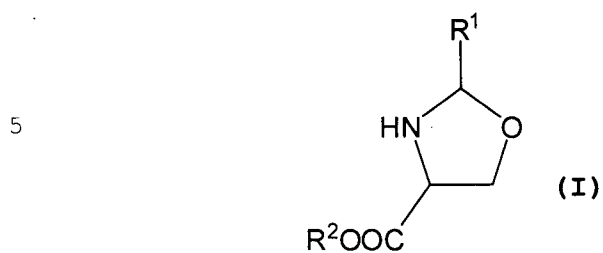
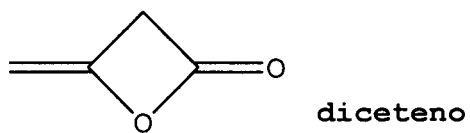
(b) reaccionar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro
 5 de alilo y formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante
 una reacción de condensación aldol intramolecular:



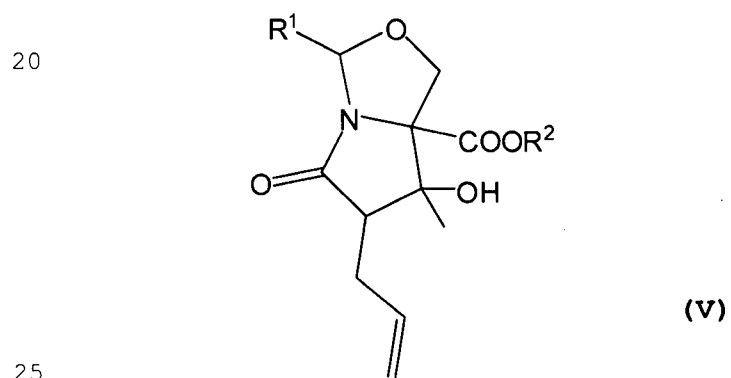
(VI)

10 en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un
 15 C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin
 sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste
 de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un
 arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin
 sustituir o sustituido.

20 23. Un método para preparar un compuesto de la
 fórmula (VI) caracterizado porque comprende: (a) agregar
 diceteno a un compuesto de la fórmula (I) para formar un
 compuesto de la fórmula (III-2);

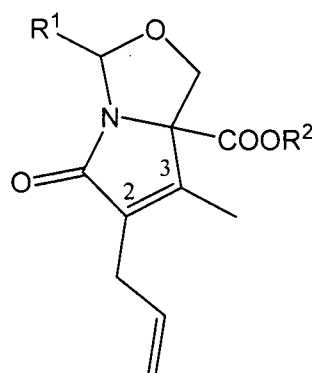


15 (b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo para formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular; y



(c) deshidratar el compuesto de la fórmula (V) para formar un compuesto de la fórmula (VI) para formar un doble enlace entre C-2 y C-3 y dar el compuesto de la fórmula (VI):

5



(VI) ,

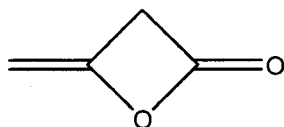
en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

15

24. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VI) caracterizado porque comprende:

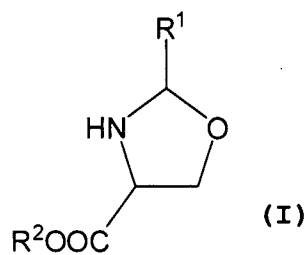
20

(a) agregar diceteno a un compuesto de la fórmula (I) para formar un compuesto de la fórmula (III-2); y

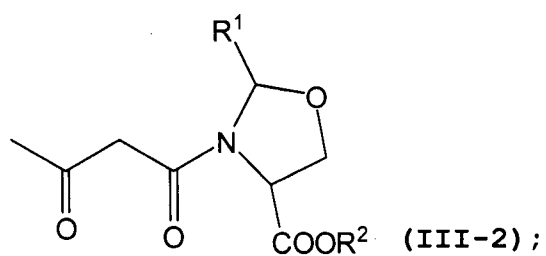


diceteno

25

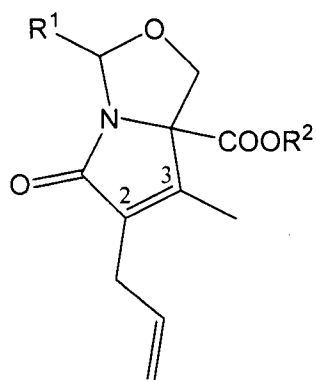


5



(b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante una reacción aldol intramolecular:

15



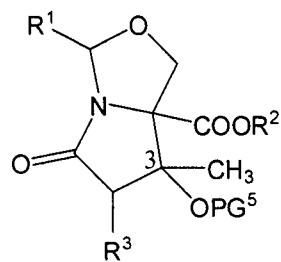
20

(VI) ,

25 en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno,

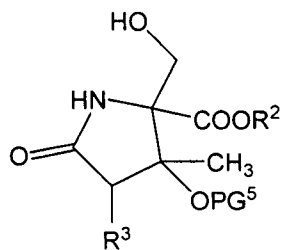
un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

25. El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque además comprende: (c) proteger el alcohol terciario del compuesto de la fórmula (XXV) conectado a C-3 con un grupo protector apropiado para formar un compuesto de la fórmula (XXVI);



(XXVI);

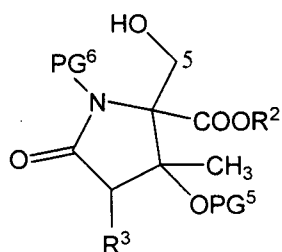
(d) romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (XXVI) para formar un compuesto de la fórmula (XXVII):



(XXVII);

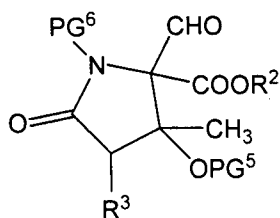
(e) proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula

(XXVII) con PG^6 para formar un compuesto de la fórmula (XXVIII):



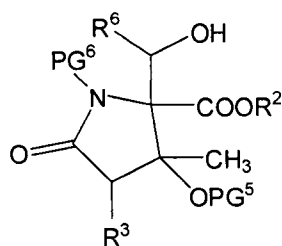
(XXVIII);

(f) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XXVIII) para formar un compuesto de la fórmula (XXIX):



(XXIX);

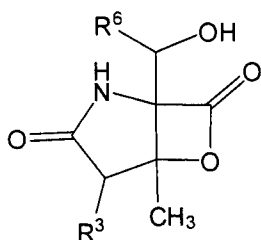
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XXIX) con una porción organometálica que comprende una porción R^6 para formar un compuesto de la fórmula (XXXIII):



(XXXIII); y

(f) retirar PG⁵ y PG⁶ en el compuesto de la fórmula (XXXIII) y formar un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la fórmula (XXXV):

5



(XXXV) ;

10 en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido;

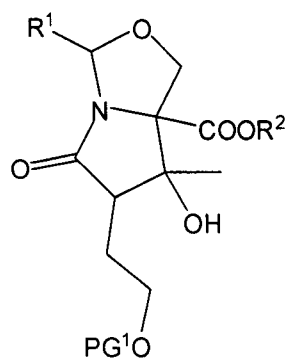
15 R³ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un aril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido y un heteroaril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido;

20 R⁶ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₂₋₂₄ alquenilo sin sustituir o

25

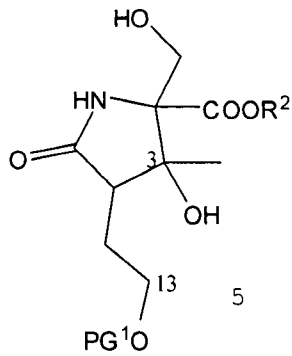
sustituido, un C₂₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un heterociclilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un aril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido, un heteroaril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquil(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido y un heterociclil(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido; y PG⁵ y PG⁶ son cada uno un grupo protector separado.

26. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) proteger el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (IX) con PG¹ para formar un compuesto de la fórmula (X-1):



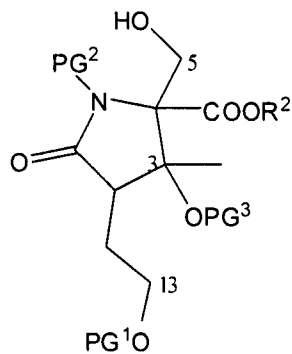
(X-1);

(b) romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (X-1) para formar un compuesto de la fórmula (XI-1):



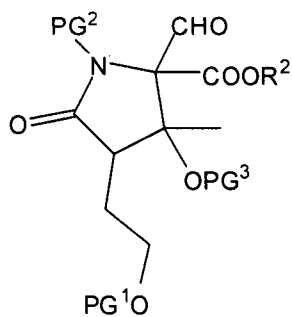
(XI-1);

(c) proteger el grupo hidroxilo terciario C-3 del compuesto de la fórmula (XI-1) con PG³ y proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula (XI-1) con PG² para formar un compuesto de la fórmula (XII-1):



(XII-1);

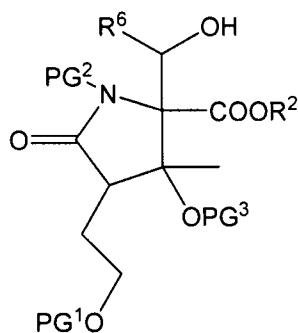
(f) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-1) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-1):



(XIII-1);

(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-1) con una porción organometálica que comprende una porción R^6 para formar un compuesto de la fórmula (XXXII-1):

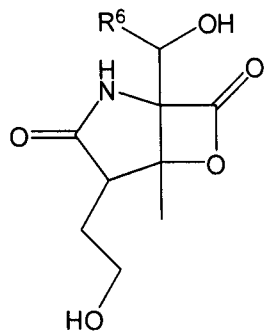
5



(XXXII-1); y

(f) retirar PG^1 , PG^2 y PG^3 de un compuesto de la fórmula (XXXII-1) y formar un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la fórmula (XXXIV):

15

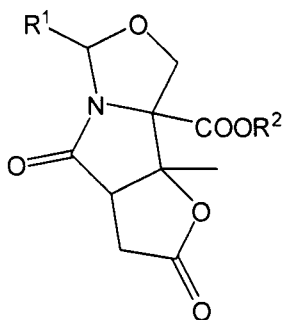


(XXXIV);

20 en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin
25 sustituir o sustituido; R^6 se elige del grupo que consiste de

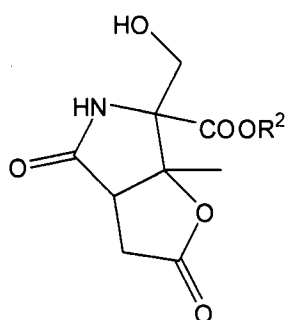
un C_1-C_{24} alquilo sin sustituir o sustituido, un C_2-C_{24} alquenilo sin sustituir o sustituido, un C_2-C_{24} alquinilo sin sustituir o sustituido, un C_3-C_{24} cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C_3-C_{24} cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C_3-C_{24} cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un heterociclilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un aril(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido, un heteroaril(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido, un C_3-C_{24} cicloalquil(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido y un heterociclil(C_{1-6} alquilo) sin sustituir o sustituido; y PG^1 , PG^2 y PG^3 son cada uno un grupo protector separado.

27. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) oxidar el grupo hidroxil primario C-13 del compuesto de la fórmula (IX) y formar una lactona de 5-miembros mediante una reacción de ciclización intramolecular para dar un compuesto de la fórmula (X-2):



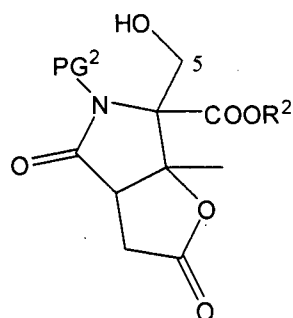
(X-2);

(b) romper el grupo aminor al del compuesto de la fórmula (X-2) para formar un compuesto de la fórmula (XI-2):



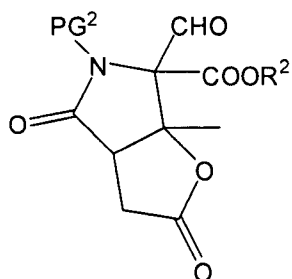
(XI-2);

(c) proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula (XI-2) con PG² para formar un compuesto de la fórmula (XII-2):



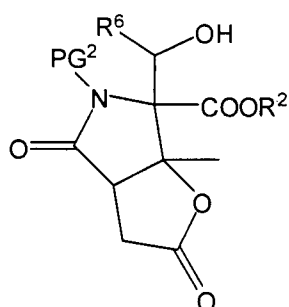
(XII-2);

(d) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-2) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-2):



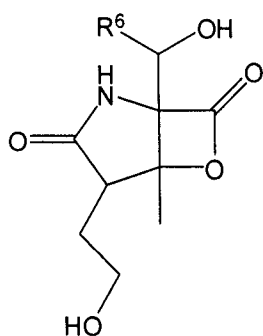
(XIII-2);

(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-2) con una porción organometálica que comprende una porción R^6 para formar un compuesto de la fórmula (XXXII-2):



(XXXIII-2);

(f) romper la lactona de 5-miembros del compuesto de la fórmula (XXXII-2), retirar PG^2 y formar un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la fórmula (XXXIV):

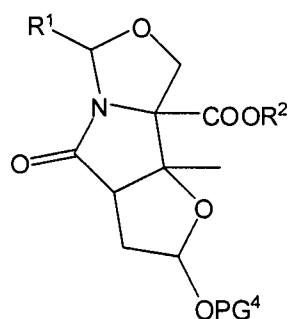


(XXXIV)

en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin

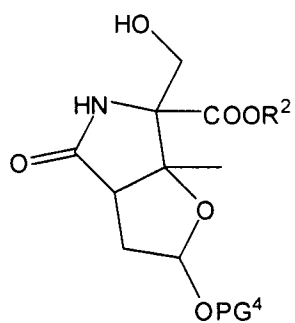
sustituir o sustituido; R6 se elige del grupo que consiste de un C₁-C₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₂-C₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₂-C₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un heterociclilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un aril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido, un heteroaril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquil(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido y un heterociclil(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido; y PG² es un grupo protector.

28. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) oxidar el C-13 alcohol a un aldehído y ciclizar el aldehído con el grupo hidroxil terciario C-3 del compuesto de la fórmula (IX) para formar un anillo hemi-acetal y proteger el grupo hidroxilo secundario del anillo hemi-acetal para formar un compuesto de la fórmula (X-3):



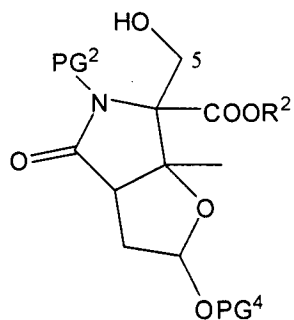
(X-3) ;

(b) romper el grupo aminor del compuesto de la fórmula (X-3) para formar un compuesto de la fórmula (XI-3):



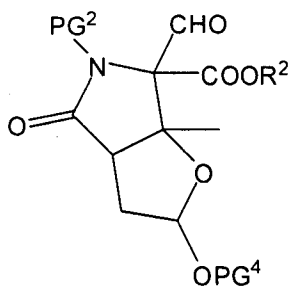
(XI-3);

(c) proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula (XI-3) con PG² para formar un compuesto de la fórmula (XII-3):



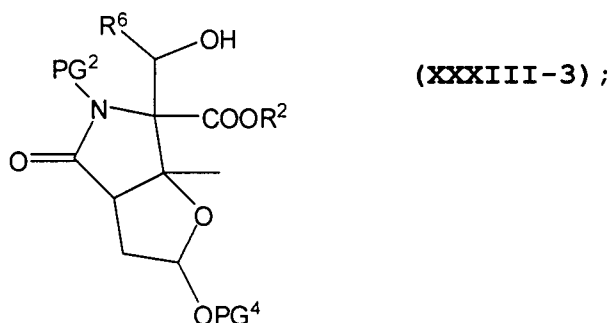
(XII-3);

(d) oxidar el grupo hidroxil primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-3) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-3):



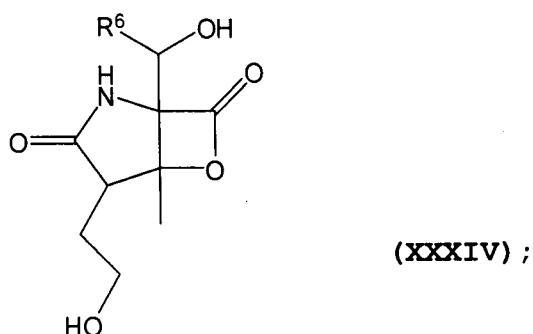
(XIII-3);

(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-3) con una porción organometálica que comprende una porción R^6 para
5 formar un compuesto de la fórmula (XXXII-3):



10

(f) retirar el grupo protector PG^4 y romper el anillo hemiacetal del compuesto de la fórmula (XXXII-3), retirar PG^2 y formar un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la
15 fórmula (XXXIV):

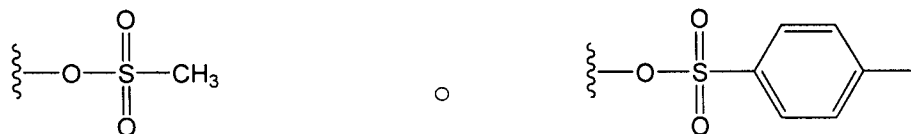


en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de
25 hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un

arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin
 sustituir o sustituido; R6 se elige del grupo que consiste de
 un C₁-C₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₂-C₂₄
 alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₂-C₂₄ alquinilo sin
 5 sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquilo sin sustituir o
 sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o
 sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o
 sustituido, un heterociclilo sin sustituir o sustituido, un
 arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin
 10 sustituir o sustituido, un aril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o
 sustituido, un heteroaril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o
 sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquil(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o
 sustituido y un heterociclil(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o
 sustituido; y PG² y PG⁴ son cada uno un grupo protector
 15 separado.

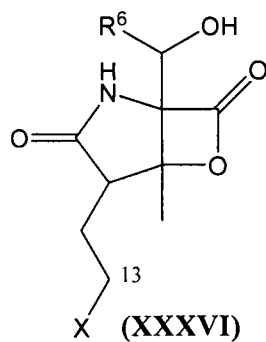
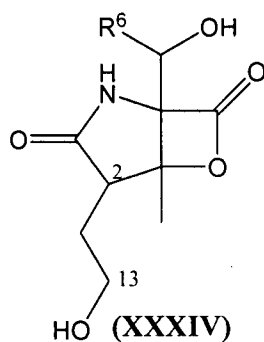
29. El método de conformidad con la reivindicación
 26, caracterizado porque además comprende reemplazar el
 hidroxil C-13 con el grupo hidroxil primario C-13 del compuesto
 de la fórmula (XXXIV) con un halógeno,

20

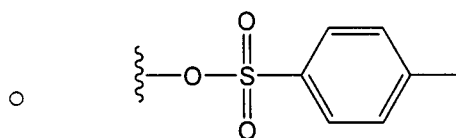
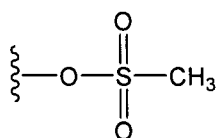


para formar un compuesto de la fórmula (XXXVI), en donde
 25 compuesto de la fórmula (XXXIV) y el compuesto de la fórmula

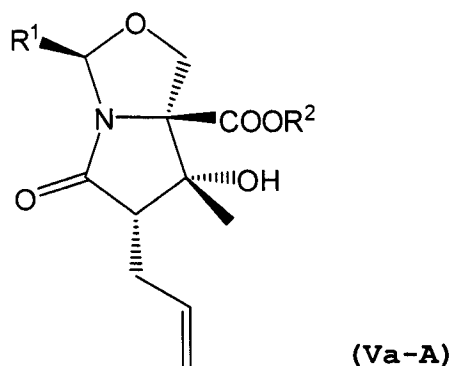
(XXXVI) tienen las siguientes estructuras:



en donde X es un halógeno,



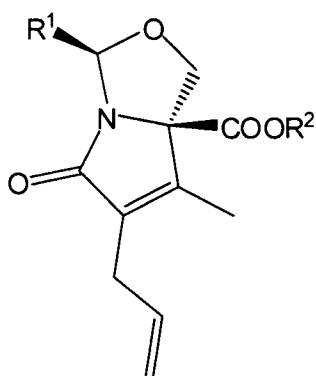
30. Un compuesto de la fórmula (Va-A):



en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que

consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

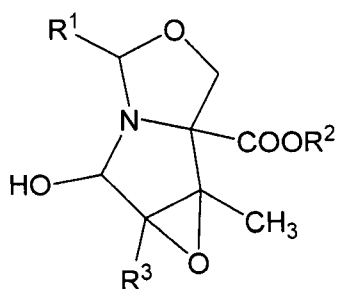
31. Un compuesto de la fórmula (VI-A):



(VI-A)

en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

32. Un compuesto de la fórmula (XXIV):

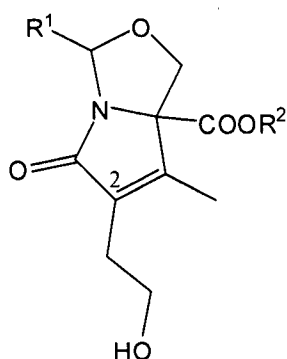


(XXIV)

en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de

hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y R³ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un aril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido, un heteroaril(C₁₋₆ alquilo) sin sustituir o sustituido.

33. Un compuesto de la fórmula (VII):

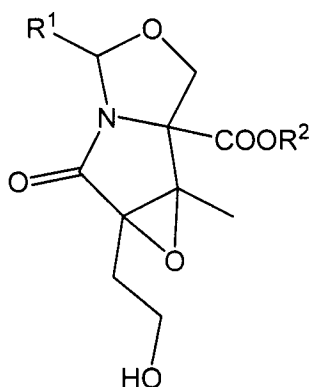


(VII)

en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste

de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

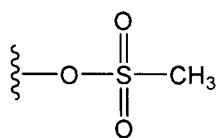
34. Un compuesto de la fórmula (VIII):



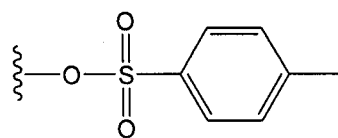
(VIII)

en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

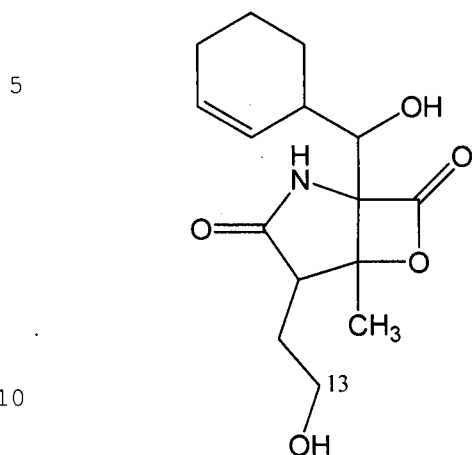
35. El método de conformidad con la reivindicación 5, caracterizado porque además comprende reemplazar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XV) con un halógeno,



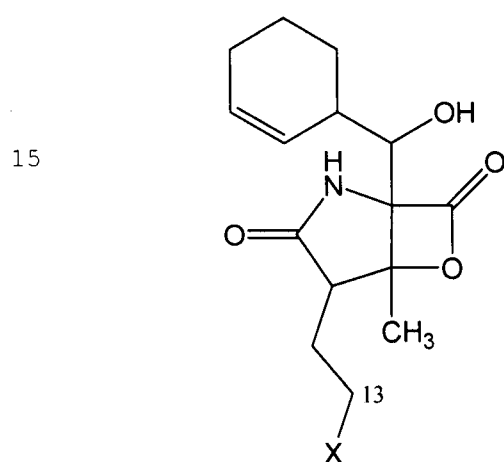
o



para formar un compuesto de la fórmula (XVI), en donde el compuesto de la fórmula (XV) y el compuesto de la fórmula (XVI) tienen las siguientes estructuras:

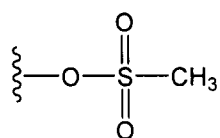


(XV)

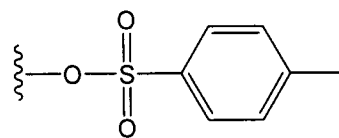


(XVI)

en donde X es un halógeno,

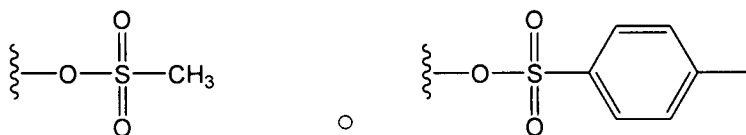


o



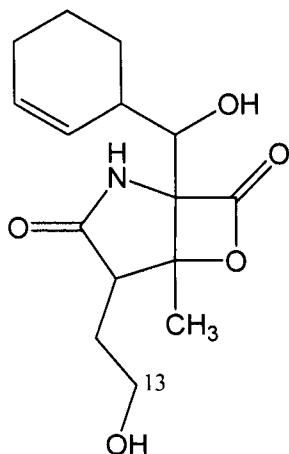
36. El método de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque además comprende reemplazar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XV) con un halógeno,

5



para formar un compuesto de la fórmula (XVI), en donde el
compuesto de la fórmula (XV) y el compuesto de la fórmula
(XVI) tienen las siguientes estructuras:

15

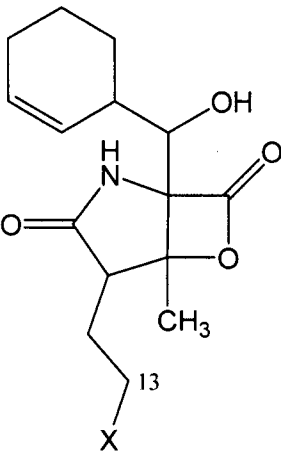


(XV)

20

25

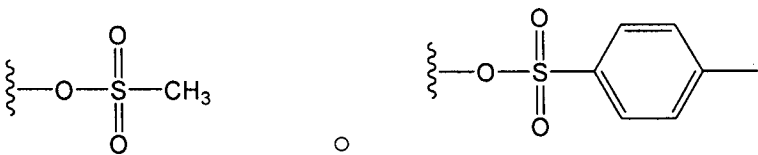
5



(XVI)

en donde X es un halógeno,

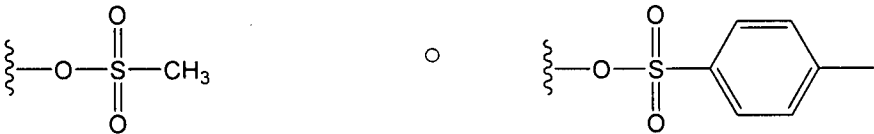
10



15

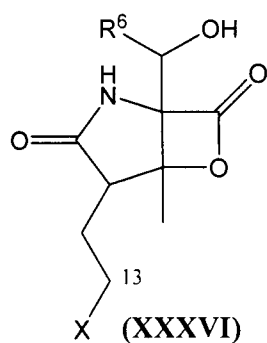
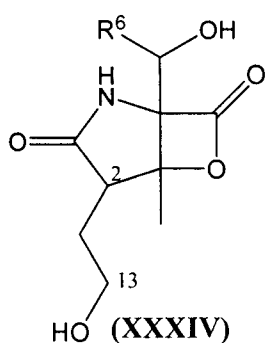
37. El método de conformidad con la reivindicación 27, caracterizado porque además comprende reemplazar el hidroxilo C-13 con el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XXXIV) con un halógeno,

20

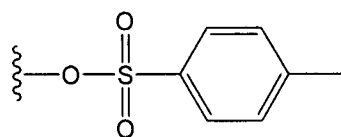
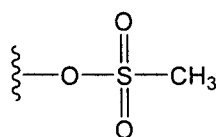


para formar un compuesto de la fórmula (XXXVI), en donde compuesto de la fórmula (XXXIV) y del compuesto de la fórmula (XXXVI) tienen las siguientes estructuras:

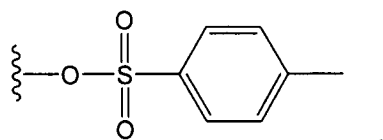
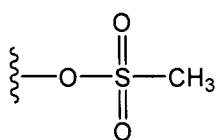
25



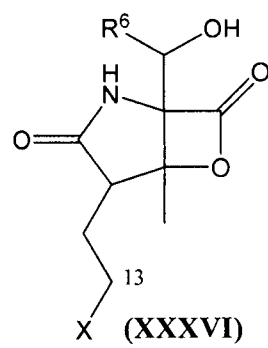
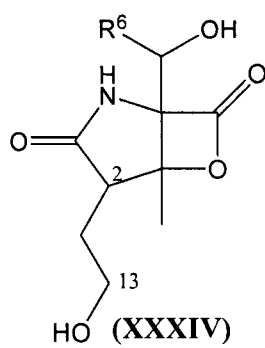
en donde X es un halógeno,



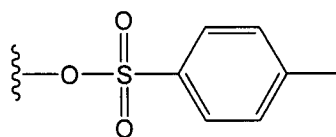
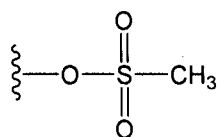
38. El método de conformidad con la reivindicación 28, caracterizado porque además comprende reemplazar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XXXIV) con un halógeno,



para formar un compuesto de la fórmula (XXXVI) en donde compuesto de la fórmula (XXXIV) y el compuesto de la fórmula (XXXVI) tienen las siguientes estructuras:



en donde X es un halógeno,



O