

JOSE LLORED CAMACHO & CO.

ABOGADOS

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-121512-00005-0000

Fecha: 2011-02-24 16:13:42 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 64

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

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 al Oficio No. **00340** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista el 7 de Enero de 2011.

2. Atentamente me permito allegar le recibo de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 11 a 38, las cuales deberán ser estudiadas junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

(a) Recibos número 11-13,803, 11-0011149, 11-0011150 y 11-004682, que acreditan el pago de la tasa mencionada; y

(b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por 38 reivindicaciones.

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 11 - 13,803
FECHA : FEBRERO 15 DE 2011

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-121512- -00005-0000

Fecha: 2011-02-24 16:13:42 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 64

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	DEVOLUCION TASA			904	15/02/2011	554,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
99	OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	554,000.00
TOTAL :		\$ 554,000.00

SON: QUINIENTOS CINCUENTA Y CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0011149

Bogotá D.C., Febrero 07 de 2011 - 12:38:12

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.

NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	142967742	07/02/2011	19.852.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
500	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	20 FOTOCOPIAS (CADA HOJA)	200.00	100.000.00
				\$100.000.00

SON: **CIEN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-121512- -00005-0000

Fecha: 2011-02-24 16:13:42 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 64

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Febrero 7 de 2011 - 12:38:17

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0011150

Bogotá D.C., Febrero 07 de 2011 - 12:38:12

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.

NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	142967742	07/02/2011	19.852.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
500 50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	20 FOTOCOPIAS (CADA HOJA)	200.00	100.000.00
				\$100.000.00

SON: **CIEN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-121512- -00005-0000

Fecha: 2011-02-24 16:13:42 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 64

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Febrero 7 de 2011 - 12:38:17

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 004682

Bogotá D.C., 18 de 2011 - 08:10:03

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.

NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	142967263	17/01/2011	30.809.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1 50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	2.000.00	2.000.00
				\$2.000.00

SON: **DOS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

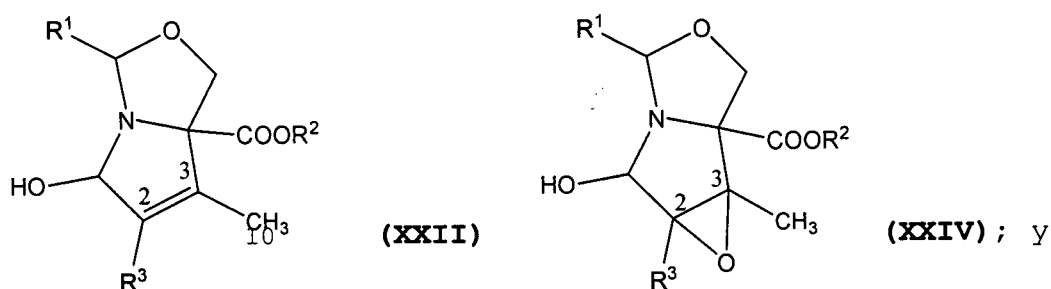


No. 10-121512- -00005-0000

Fecha: 2011-02-24 16:13:42 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 64

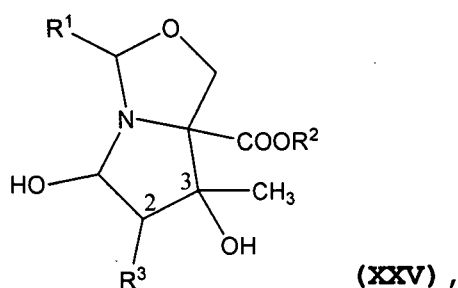
REIVINDICACIONES

1. Un método de síntesis química caracterizado porque comprende: (a) oxidar un compuesto de la fórmula
 5 (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):

15

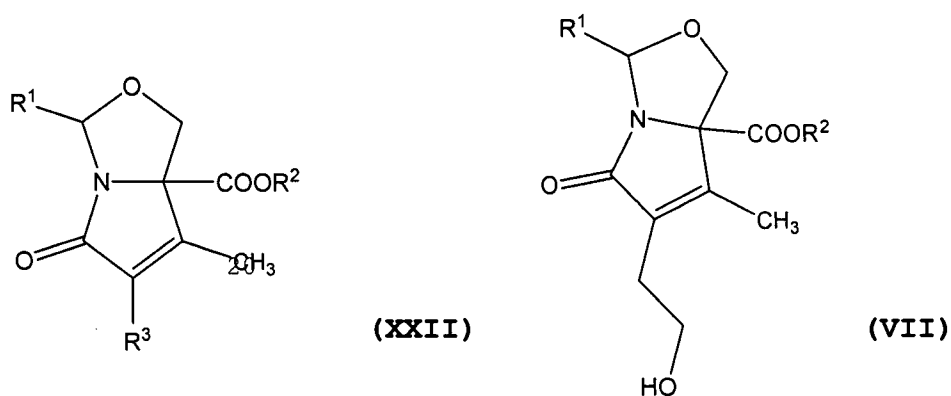


20

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
 25

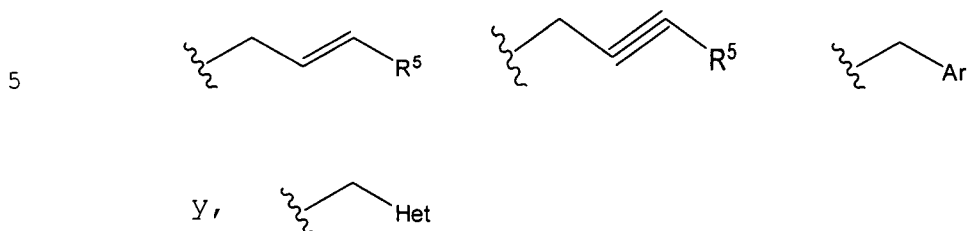
sustituir o sustituido; y R^3 se elige del grupo que consiste de un C_{1-24} alquilo sin sustituir o sustituido, un C_{1-24} alquenilo sin sustituir o sustituido, un C_{1-24} alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C_{3-24}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



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

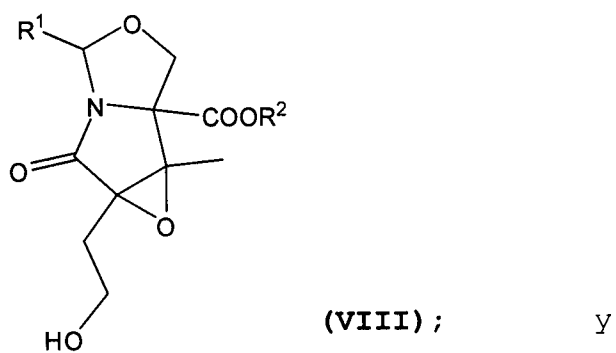
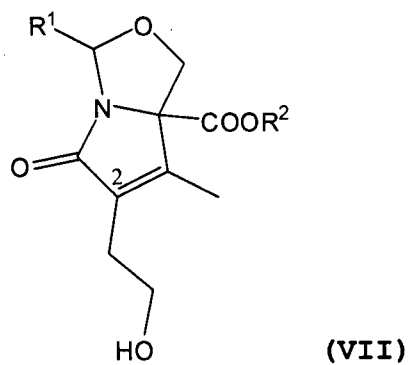
hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; R³ se elige del grupo que consiste de



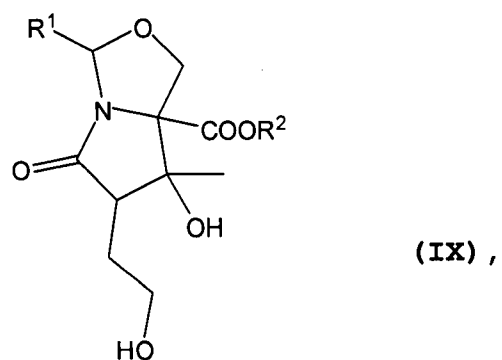
10 en donde Ar es un arilo sin sustituir o sustituido, Het es un heteroarilo sin sustituir o sustituido; y R⁵ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo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



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

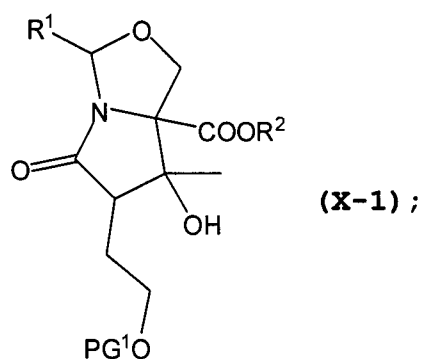


en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno,
25 un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin

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 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):

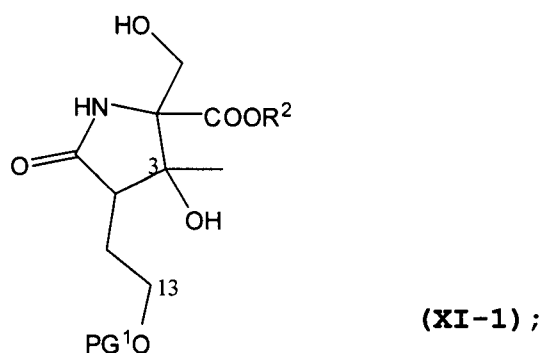
10



15

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

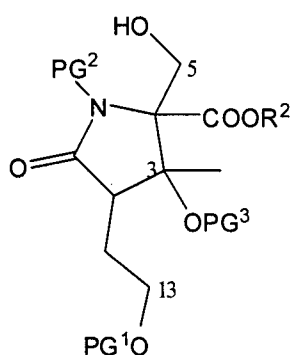
20



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

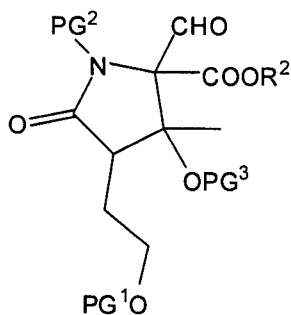


10

(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):

20

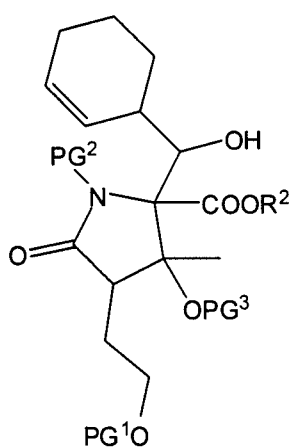


(XIII-1);

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

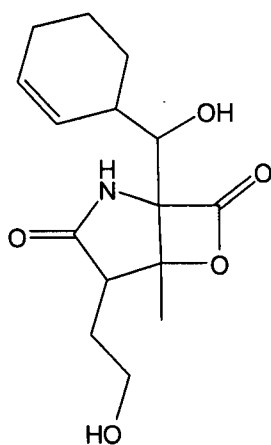
25

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):

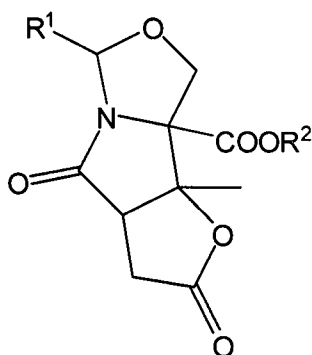


(XV);

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

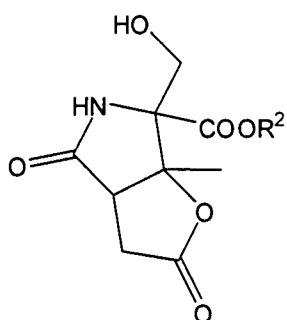
arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que
 consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o
 sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un
 arilalquilo sin sustituir o sustituido; y PG^1 , PG^2 y PG^3 cada
 uno son un grupo protector separado.

5. El método de conformidad con la reivindicación
 3, caracterizado porque además comprende: (a) oxidar el grupo
 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):



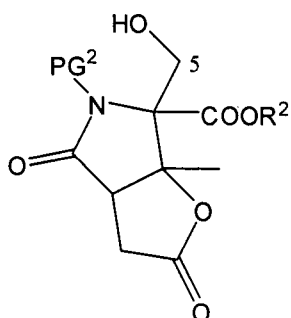
(X-2);

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



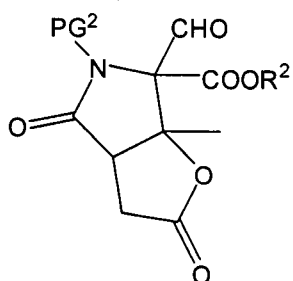
(XI-2) ;

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



(XII-2) ;

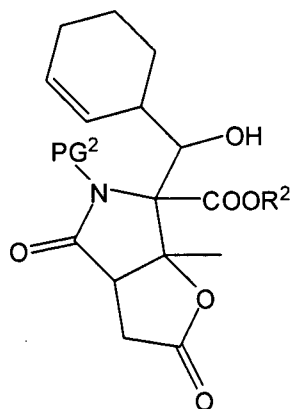
(d) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-2) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-2):



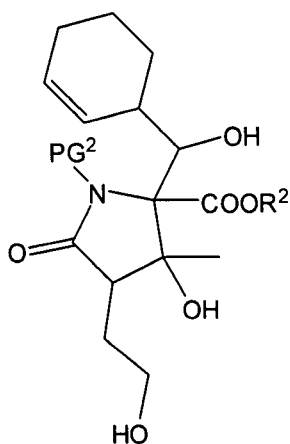
(XIII-2) ;

(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):

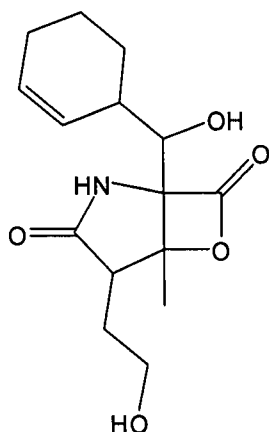


(f) romper la lactona de 5 miembros del compuesto de la fórmula (XIV-2) para formar un compuesto de la fórmula (XVII):



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

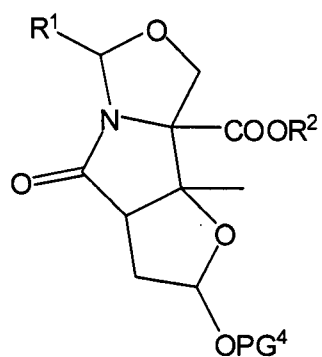
un anillo beta-lactona para dar un compuesto de la fórmula (XV):



(XV);

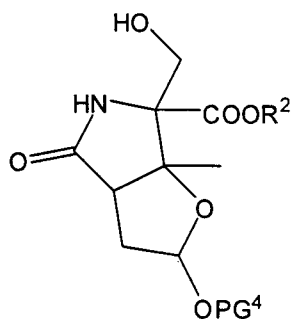
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y PG² 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):



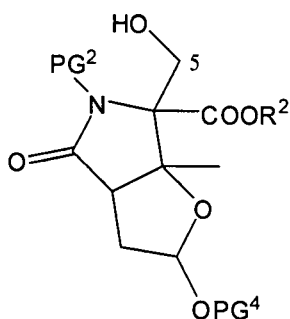
(X-3) ;

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



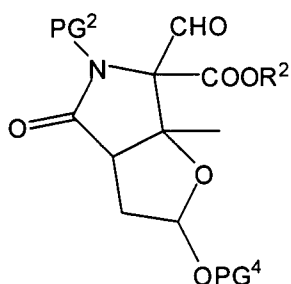
(XI-3) ;

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



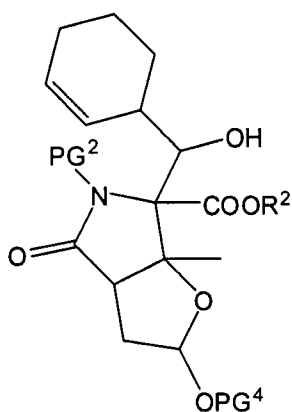
(XII-3) ;

(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);

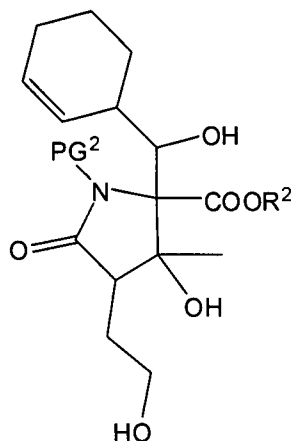
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII-3) con una porción órgano-metálica que comprende una porción ciclohexenilo para formar un compuesto de la fórmula (XIV-3):



(XIV-3);

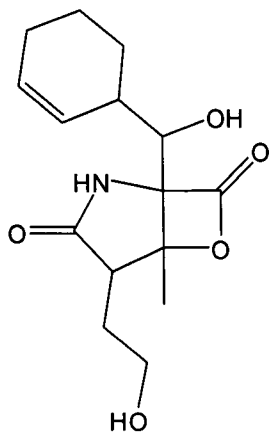
(f) retirar el grupo protector PG⁴ y romper en forma reductiva el anillo hemi-acetal del compuesto de la fórmula

(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):

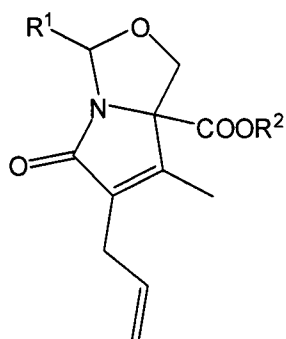


(XV);

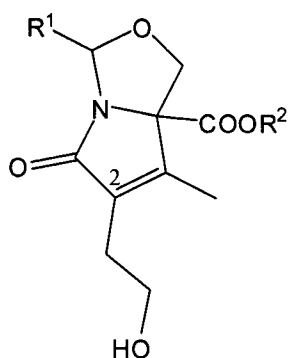
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno,
un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin

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 hidroxilo para formar un compuesto de la fórmula (VII):



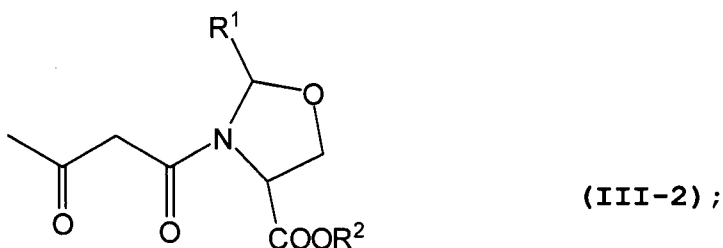
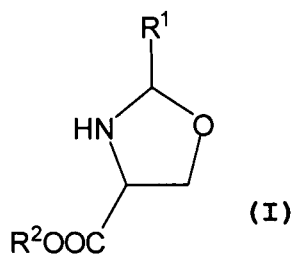
(VI)



(VII)

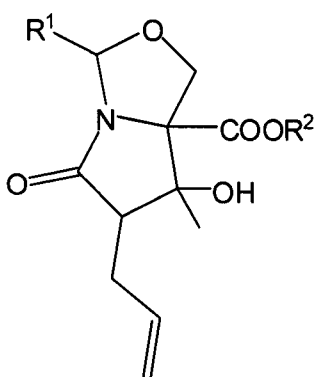
en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin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

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):



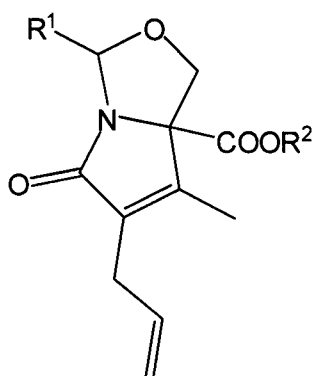
(b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular:

25



(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):



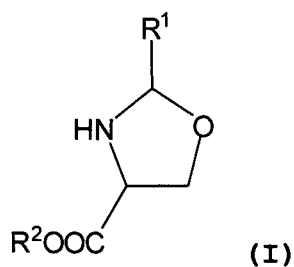
(VI) ,

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.

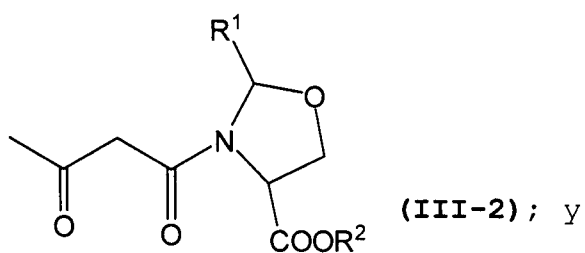
9. El método de conformidad con la reivindicación

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

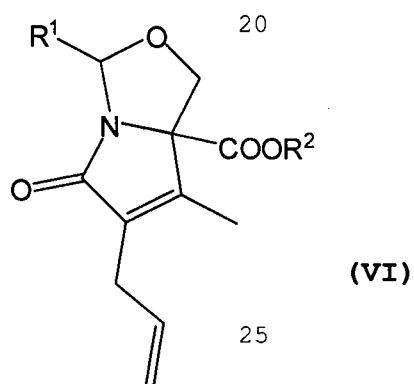
5



10

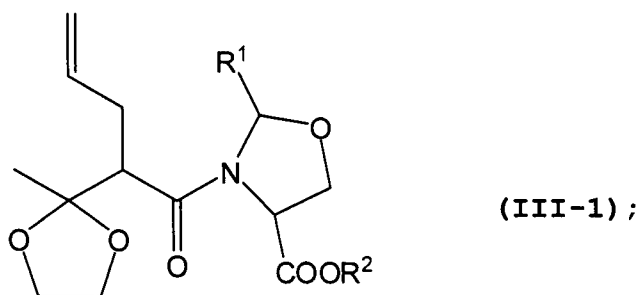
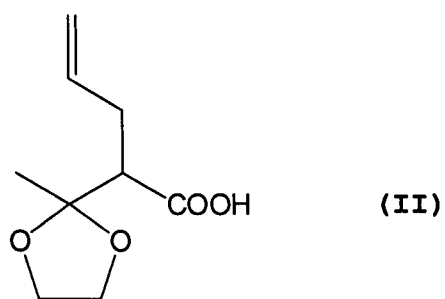
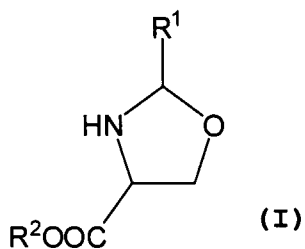


(b) reaccionar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante una reacción de condensación aldol intramolecular:

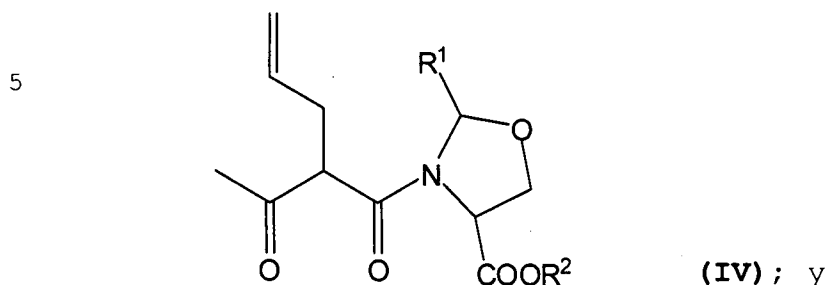


en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir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

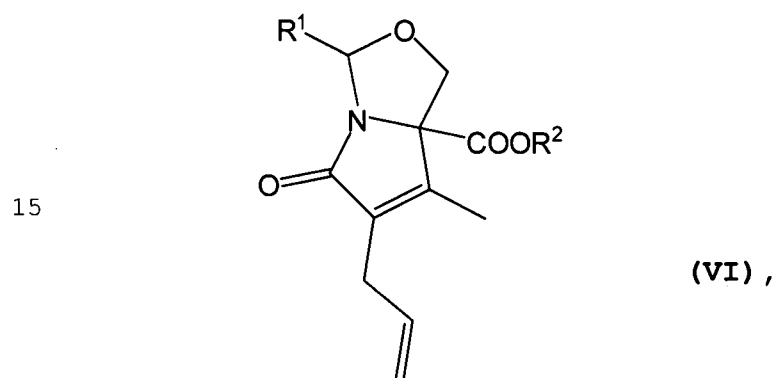
10. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) reaccionar un compuesto de la fórmula (I) con un compuesto de la fórmula (II) para formar un compuesto de la fórmula (III-1);



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



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

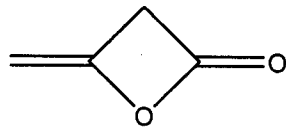


en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno,
20 un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin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

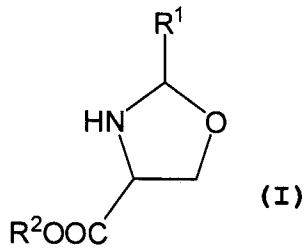
25 11. El método de conformidad con la reivindicación

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

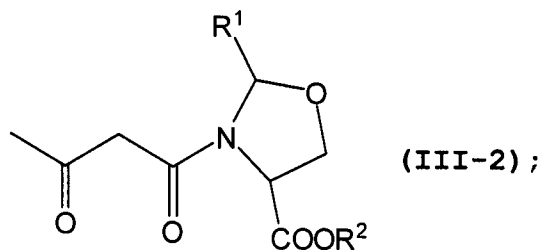
5

**diceteno**

10

**(I)**

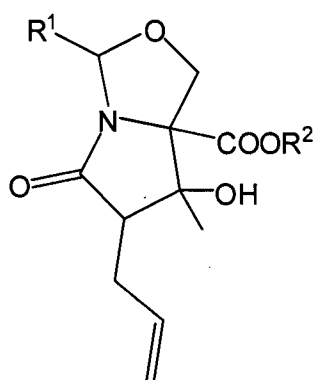
15

**(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

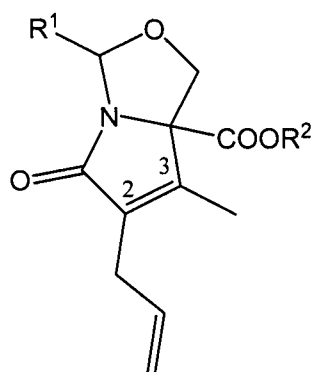
25



(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

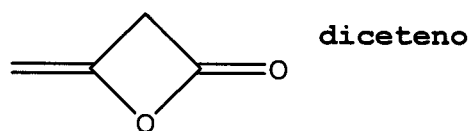


(VI),

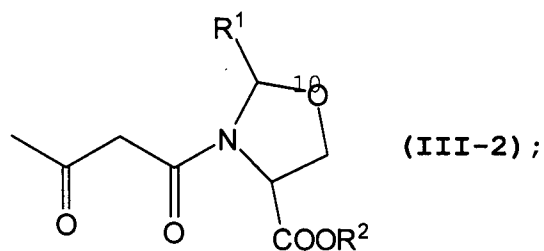
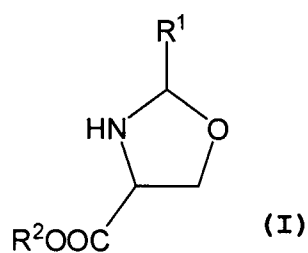
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir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

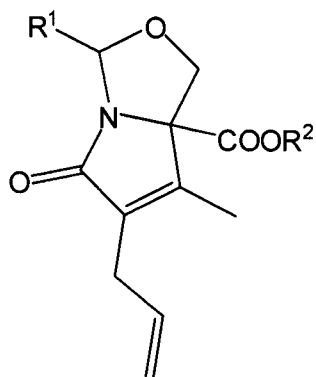


5



(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:

20



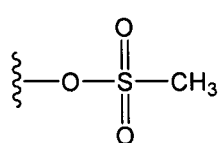
(VI),

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

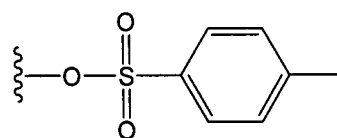
sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

- 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,

10



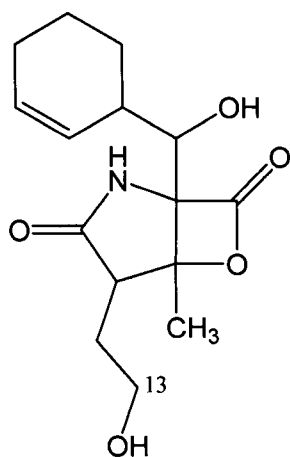
o



15

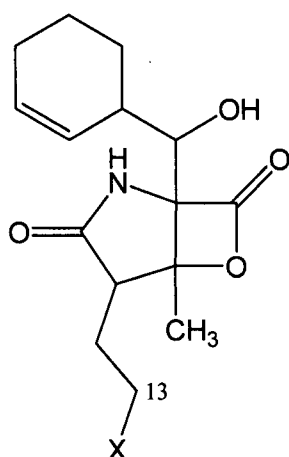
para formar un compuesto de la fórmula (XVI), en donde el compuesto de la fórmula (XV) y el compuesto de la fórmula (XVI) tienen las siguientes estructuras:

20



(XV)

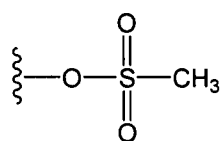
25



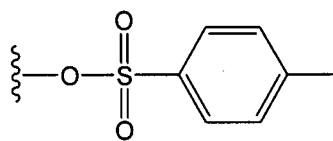
(XVI)

en donde X es un halógeno,

10

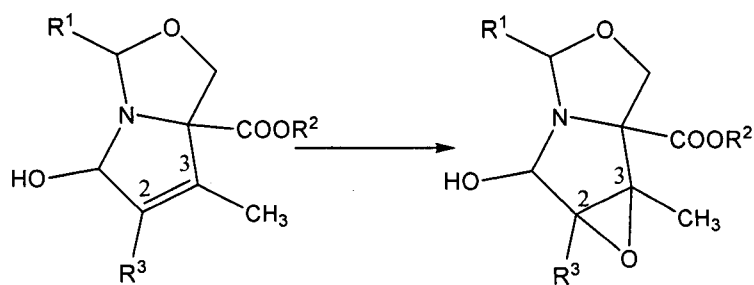


o.



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)

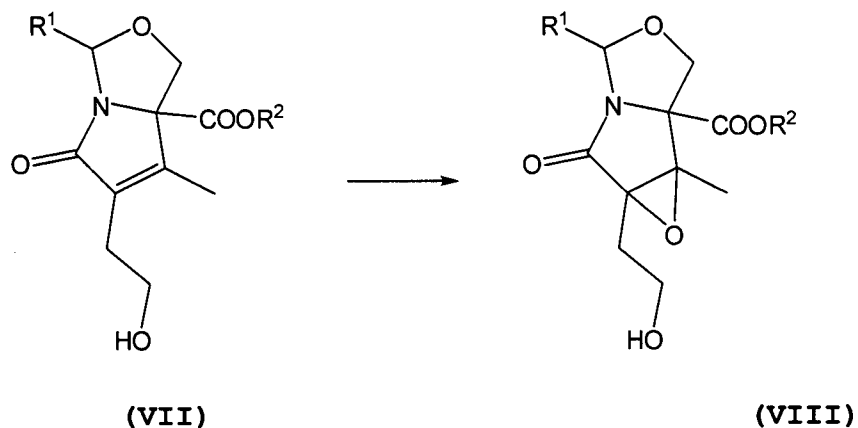
25

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
5 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,
10 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

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):

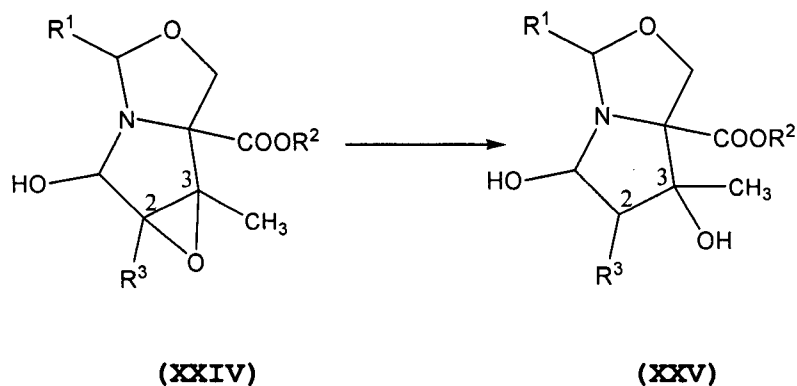
20

25



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.

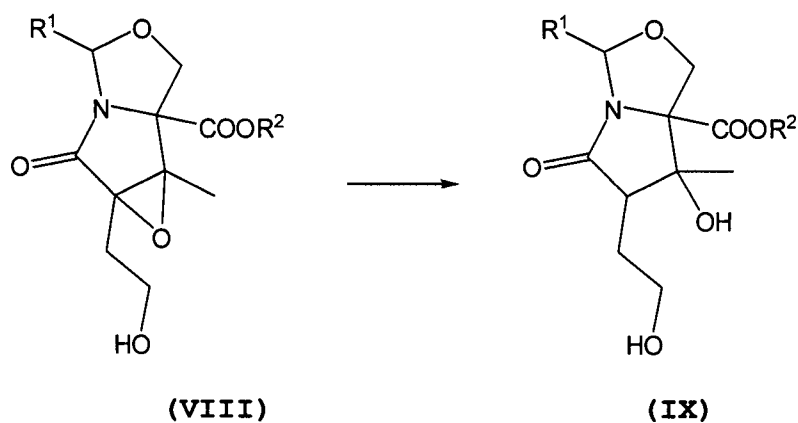
16. Un método para formar un compuesto de la fórmula (XXV) caracterizado porque comprende romper el epóxido de un compuesto de la fórmula (XXIV) para formar un compuesto de la fórmula (XXV)



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

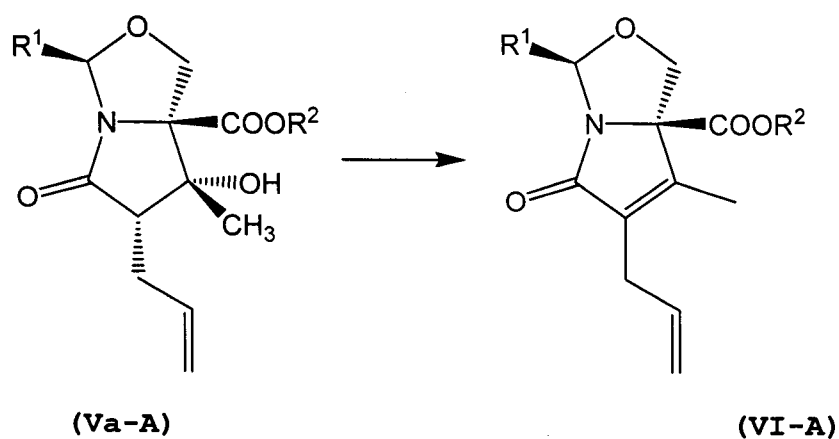
C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido; y R³ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ 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)



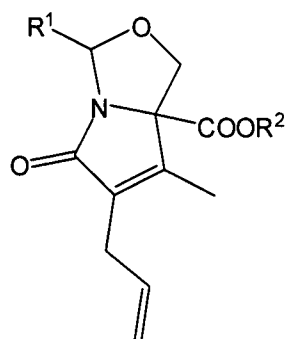
en donde R^1 se elige el grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se selecciona el grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin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

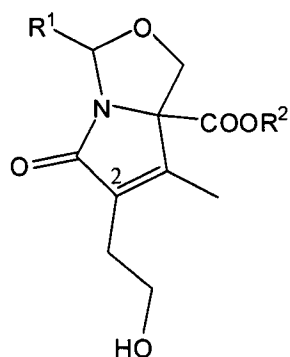


en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir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



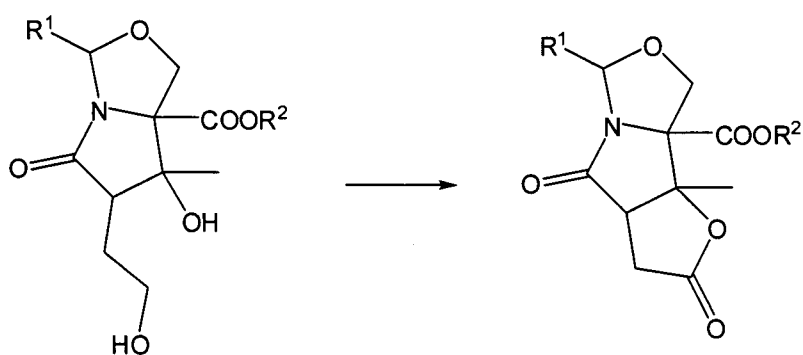
(VII)

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

10



15

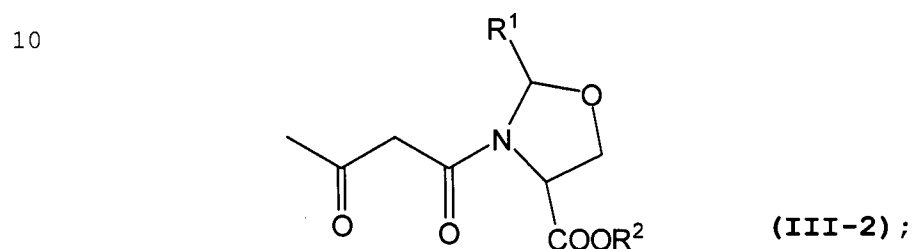
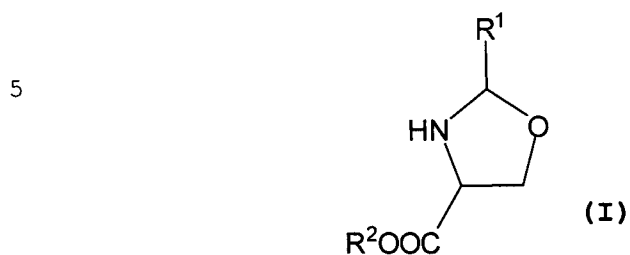
(IX)

(X-2)

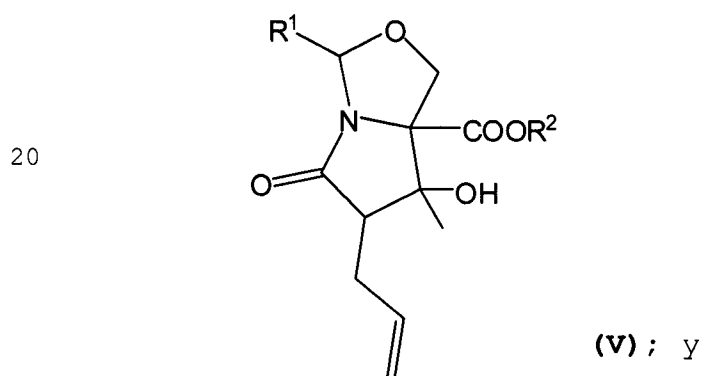
en donde R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir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

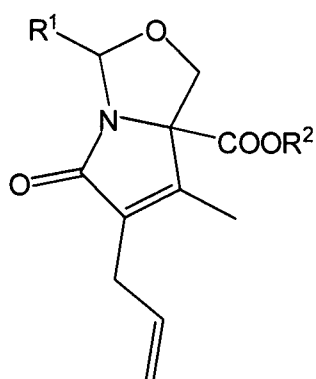


15 (b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo y formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular:



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

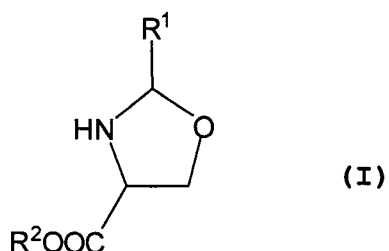
doble enlace entre C-2 y C-3 y dar un compuesto de la fórmula (VI):



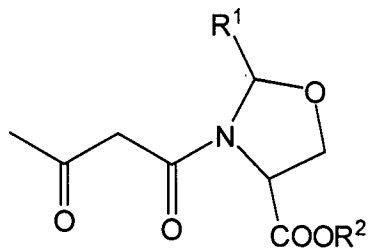
(VI),

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.

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

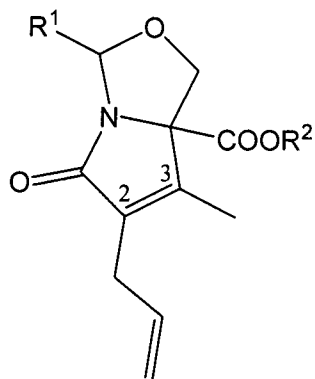


(I)



(III-2); y

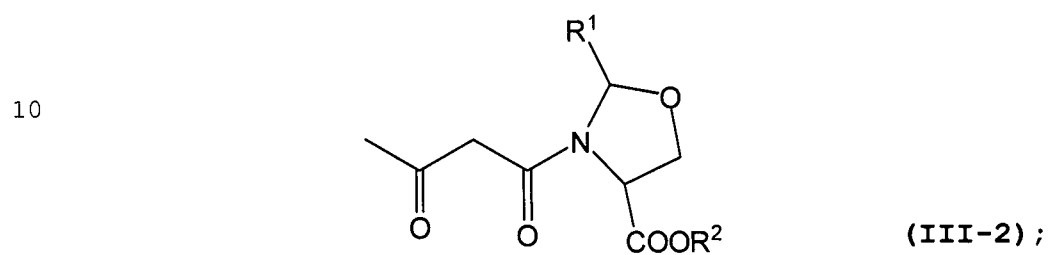
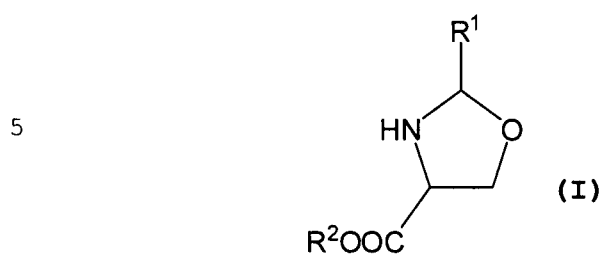
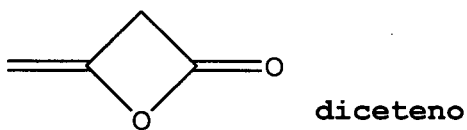
(b) reaccionar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro
 5 de alilo y formar un compuesto de la fórmula (VI) mediante
 una reacción de condensación aldol intramolecular:



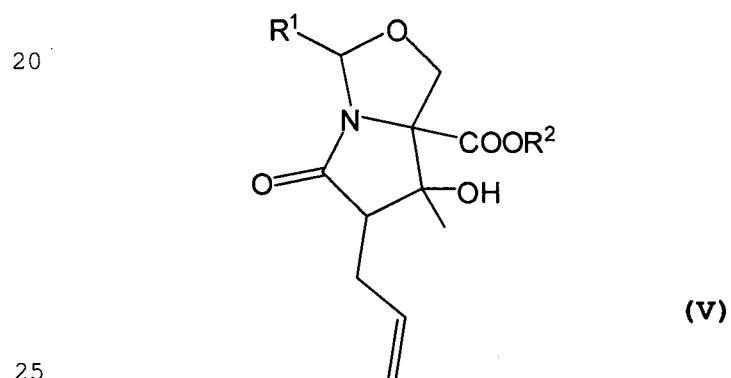
(VI)

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);

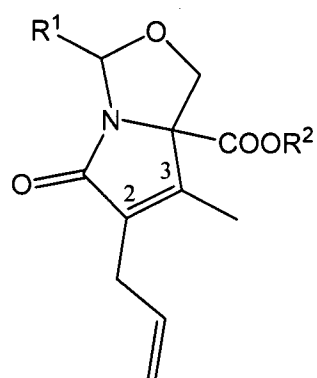


15 (b) alquilar el compuesto de la fórmula (III-2) con bromuro de alilo para formar un compuesto de la fórmula (V) mediante una reacción aldol intramolecular; y



(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

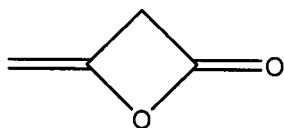


(VI) ,

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.

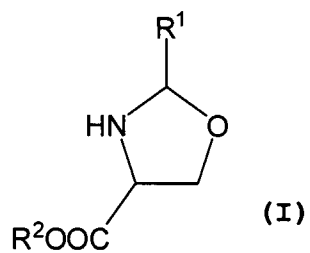
24. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VI) caracterizado porque comprende:

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

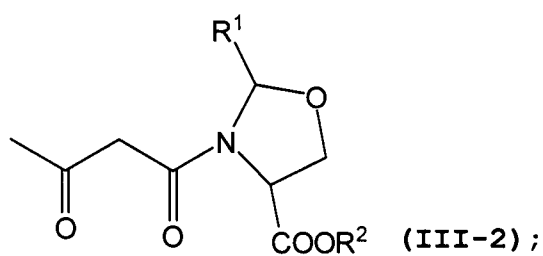


diceteno

25

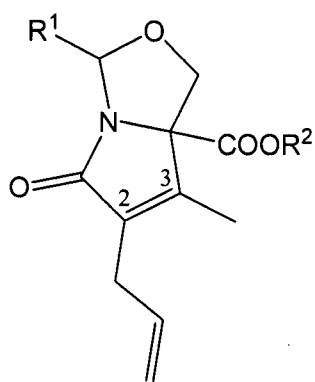


5



(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



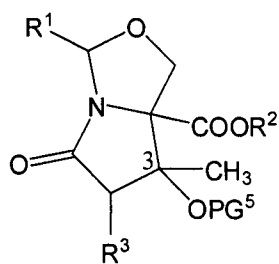
20

(VI) ,

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

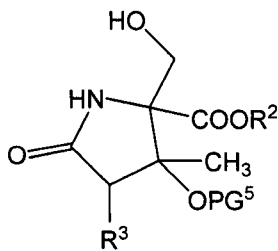
un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir o sustituido.

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);

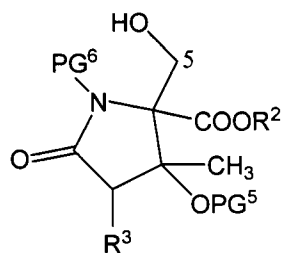
(d) romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (XXVI) para formar un compuesto de la fórmula (XXVII):



(XXVII);

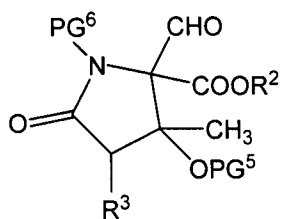
(e) proteger el nitrógeno lactama del compuesto de la fórmula

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



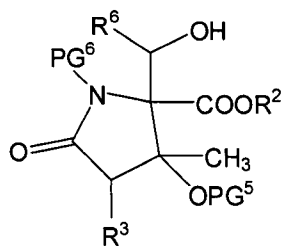
(XXVIII);

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



(XXIX);

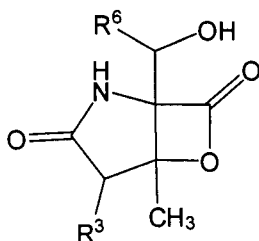
(e) reaccionar el compuesto de la fórmula (XXIX) con una porción organometálica que comprende una porción R^6 para formar un compuesto de la fórmula (XXXIII):



(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;

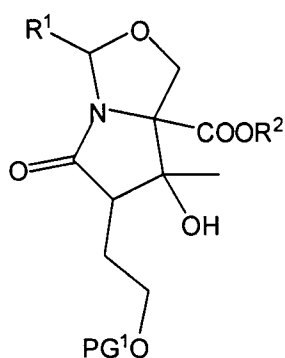
15 R³ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₁₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, 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; R⁶ se elige del grupo que consiste de un C₁₋₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₂₋₂₄ alquenilo sin sustituir o

20

25

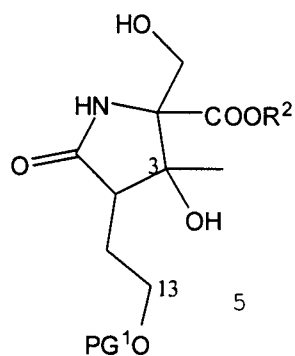
sustituido, un C₂₋₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, un C₃₋₂₄ cicloalquinilo sin sustituir o sustituido, un heterocicclilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido, un heteroarilo 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 heterocicclil(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 hidroxil primario C-13 del compuesto de la fórmula (IX) con PG¹ para formar un compuesto de la fórmula (X-1):



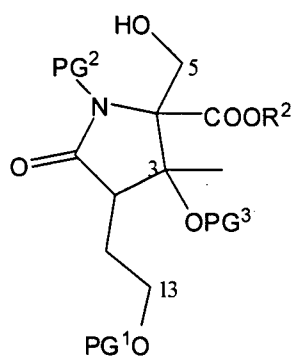
(X-1);

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



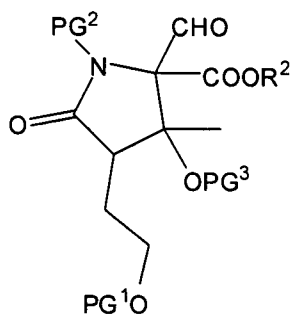
(XI-1) ;

(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) ;

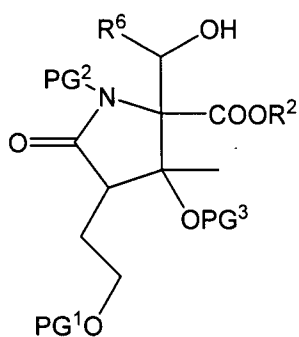
(f) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-1) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-1):



(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):

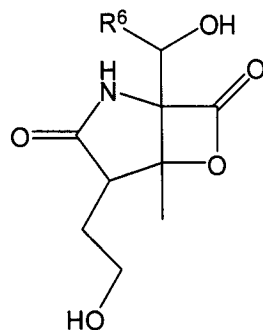
5



(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

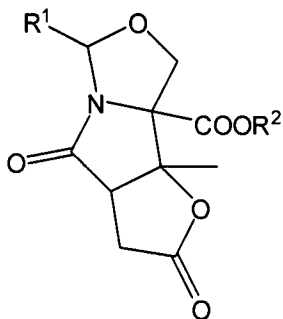


(XXXIV);

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 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 PG¹, PG² y PG³ son cada uno un grupo protector separado.

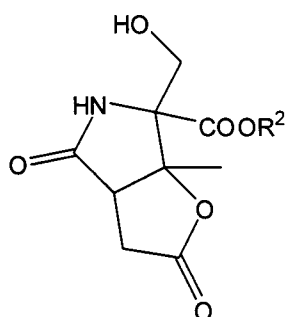
27. El método de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque además comprende: (a) oxidar el grupo hidroxil primario C-13 del compuesto de la fórmula (IX) y formar una lactona de 5-miembros mediante una reacción de ciclización intramolecular para dar un compuesto de la fórmula (X-2):



(X-2);

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

5

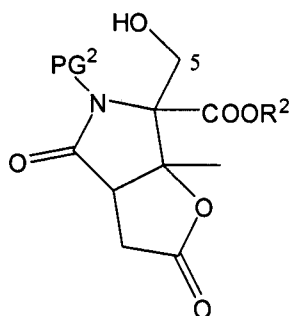


(XI-2);

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

10

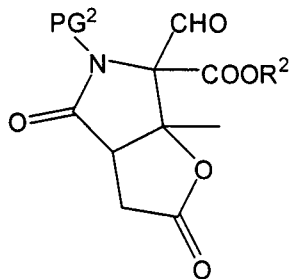
15



(XII-2);

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

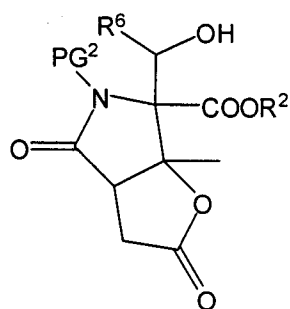
20



(XIII-2);

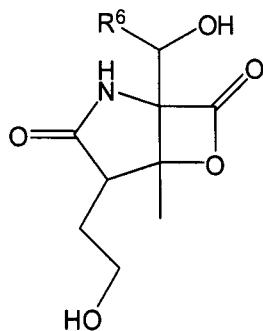
25

(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):

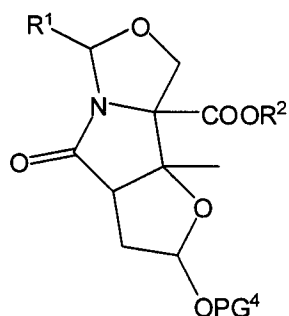


(XXXIV)

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

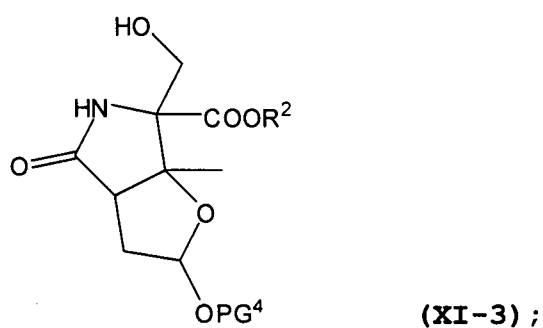
sustituir o sustituido; R₆ se elige del grupo que consiste de un C₁-C₂₄ alquilo sin sustituir o sustituido, un C₂-C₂₄ alquenilo sin sustituir o sustituido, un C₂-C₂₄ alquinilo sin sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquilo sin sustituir o sustituido, un C₃-C₂₄ cicloalquenilo sin sustituir o sustituido, 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 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):

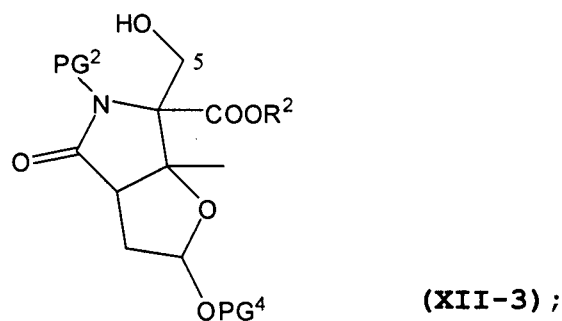


(X-3);

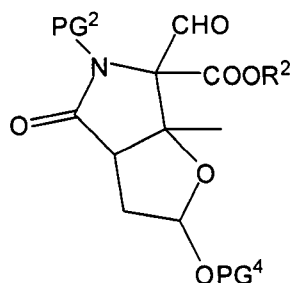
(b) romper el grupo aminor del compuesto de la fórmula (X-3) para formar un compuesto de la fórmula (XI-3):



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

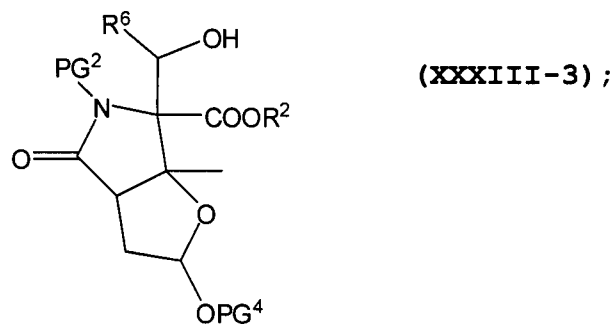


20 (d) oxidar el grupo hidroxilo primario C-5 del compuesto de la fórmula (XII-3) para formar un compuesto de la fórmula (XIII-3):



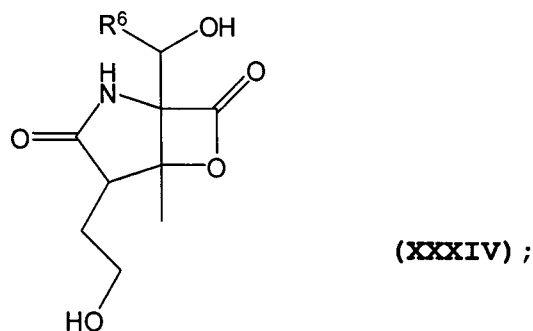
(XIII-3);

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



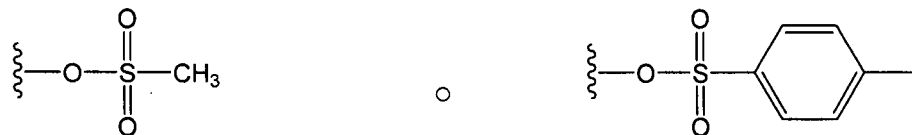
en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; R^2 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, un

25

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.

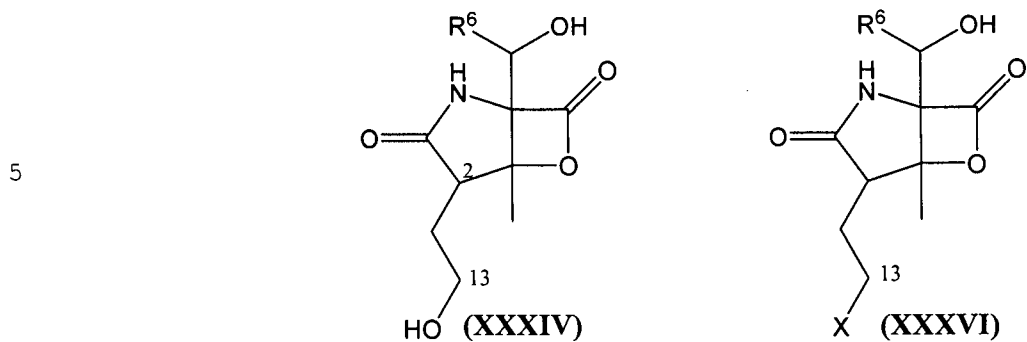
29. El método de conformidad con la reivindicación
 26, caracterizado porque además comprende reemplazar el
 hidroxilo C-13 con el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto
 de la fórmula (XXXIV) con un halógeno,

20



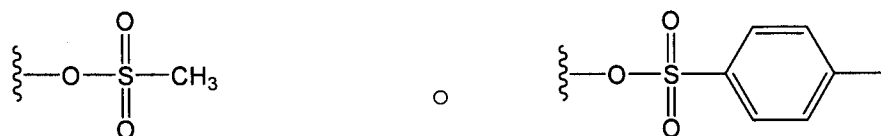
para formar un compuesto de la fórmula (XXXVI), en donde
 25 compuesto de la fórmula (XXXIV) y el compuesto de la fórmula

(XXXVI) tienen las siguientes estructuras:



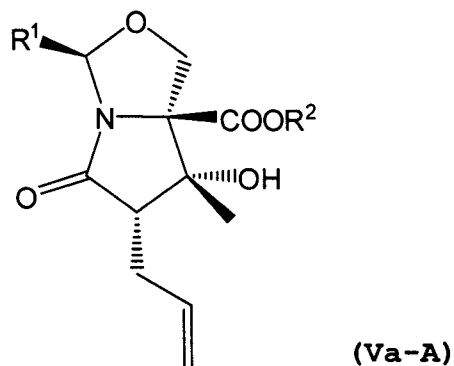
en donde X es un halógeno,

10



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

15



20

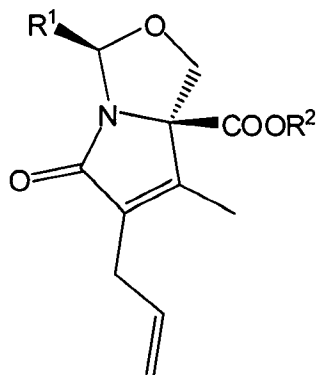
en donde: R^1 se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C_{1-6} alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R^2 se elige del grupo que

25

consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ 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):

5



10

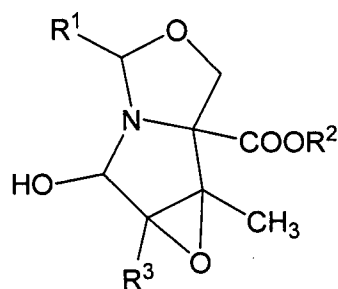
(VI-A)

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

15

32. Un compuesto de la fórmula (XXIV):

20



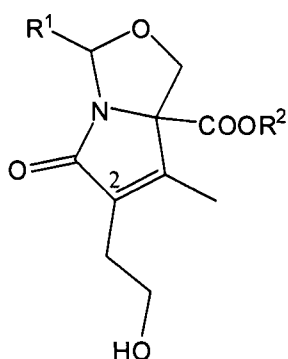
(XXIV)

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; 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):



20

(VII)

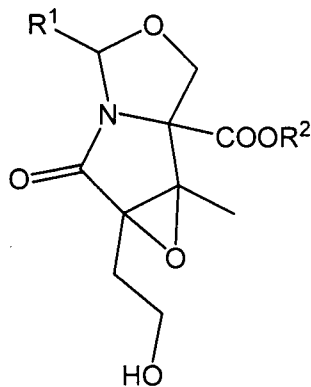
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste

25

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):

5



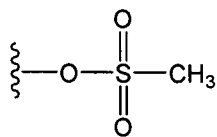
10

(VIII)

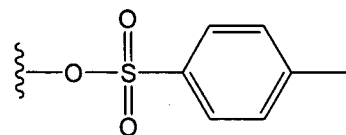
en donde: R¹ se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, y un arilo sin sustituir o sustituido; y R² se elige del grupo que consiste de hidrógeno, un C₁₋₆ alquilo sin sustituir o sustituido, un arilo sin sustituir o sustituido y un arilalquilo sin sustituir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

25

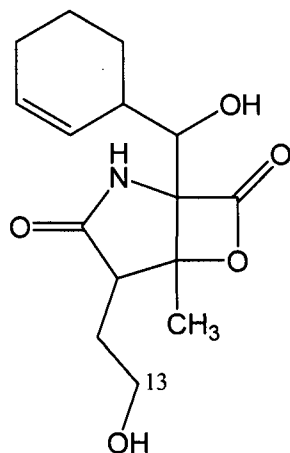


o



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:

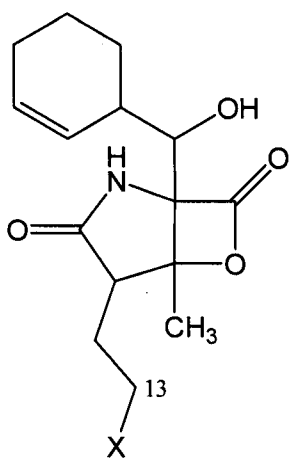
5



(XV)

10

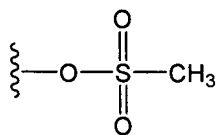
15



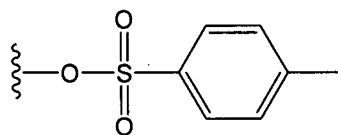
(XVI)

en donde X es un halógeno,

25

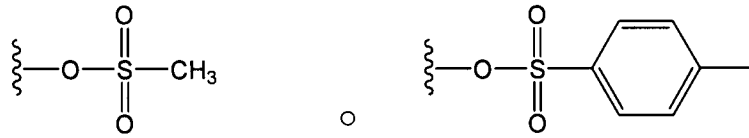


o



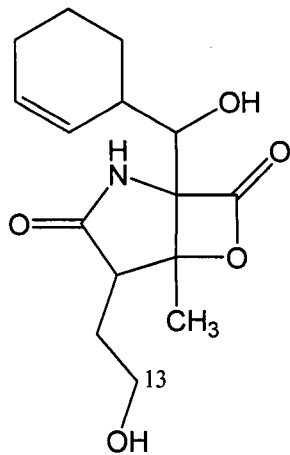
36. El método de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque además comprende reemplazar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XV) con un halógeno,

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:

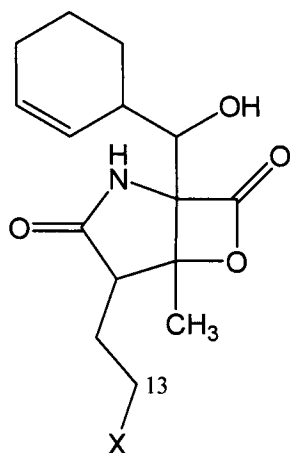
15



(XV)

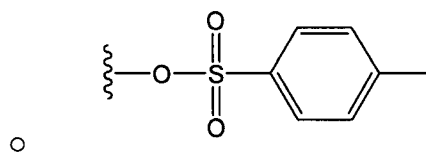
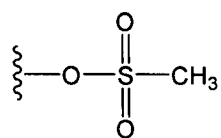
20

25

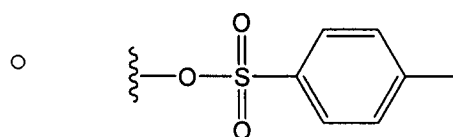
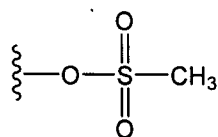


(XVI)

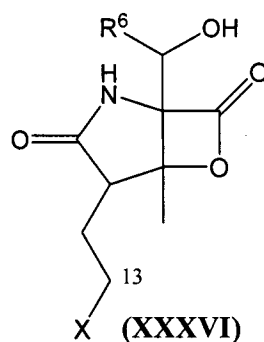
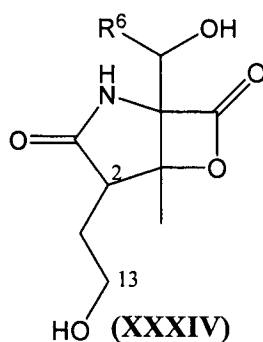
en donde X es un halógeno,



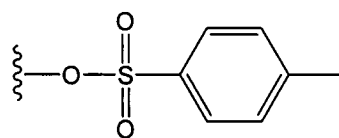
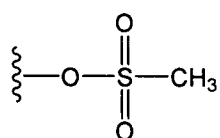
37. El método de conformidad con la reivindicación 27, caracterizado porque además comprende reemplazar el hidroxilo C-13 con el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XXXIV) con un halógeno,



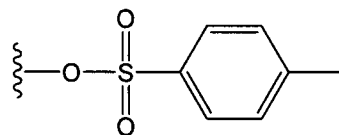
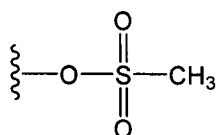
para formar un compuesto de la fórmula (XXXVI), en donde compuesto de la fórmula (XXXIV) y del compuesto de la fórmula (XXXVI) tienen las siguientes estructuras:



en donde X es un halógeno,

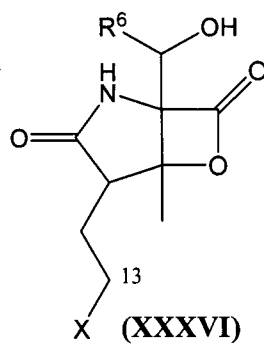
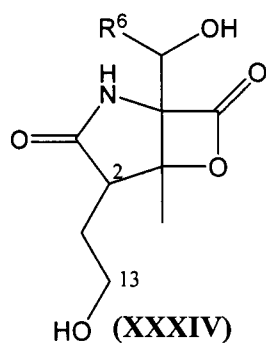


38. El método de conformidad con la reivindicación 28, caracterizado porque además comprende reemplazar el grupo hidroxilo primario C-13 del compuesto de la fórmula (XXXIV) con un halógeno,



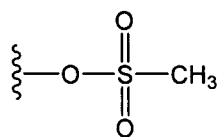
para formar un compuesto de la fórmula (XXXVI) en donde compuesto de la fórmula (XXXIV) y el compuesto de la fórmula (XXXVI) tienen las siguientes estructuras:

5

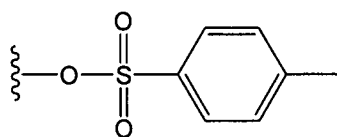


en donde X es un halógeno,

10



O



2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apoderado(a) y/o Representante de
NEREUS PHARMACEUTICALS INC

REFERENCIA	Radicación No.	10 121512
	Solicitud internacional	PCT/US2009/036376
	Fecha inicio fase nacional	07/10/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	13324
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

 21 JUN 2011

JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

jfernand