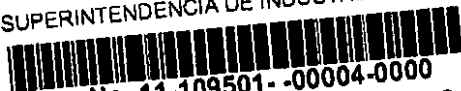


Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y C
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-109501-00004-0000

Fecha: 2011-10-14 17:15:53 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 33

Re: PI.-GILEAD SCIENCES, INC.-Solicitud de Patente de Invención en
Fase Nacional PCT para "ANÁLOGOS DE CARBA-NUCLEÓSIDO
PARA TRATAMIENTO ANTIVIRAL".-Clase C07H 19/24.-
Expediente número 11-109.501.-

1. Me refiero al Oficio No. **15119** dictado por ese Despacho y notificado por fijación en lista el 23 de Septiembre de 2011.

2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito allegar el 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 17 y 22 a 28 originalmente presentadas con mi Solicitud de 26 de Agosto de 2011. En consecuencia, las mismas han sido reenumeradas como nuevas reivindicaciones 18 a 24, las cuales deberán ser estudiadas junto con la presente solicitud.

3. Adicionalmente, me permito señalar que debido a un error material de carácter tipográfico en la preparación de la solicitud internacional, dentro del capítulo reivindicatorio actualmente presentado la reivindicación **13** depende de sí misma.

Siendo este un error material, el solicitante desea corregir dicha dependencia de manera que la reivindicación **13** dependa de la reivindicación **12**, como era la intención original. En este sentido me permito señalar que el capítulo reivindicatorio que incluye esta modificación se anexa al presente memorial.

4. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de correcciones y modificaciones;
- (b) Recibo número 11-0092016, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas;
- (c) Recibos números 11-0096791, 11-0096790 y 11-0099584, expedidos por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acreditan el pago de la tasa correspondiente a las reivindicaciones adicionales 11 a 24; y
- (d) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por **24** reivindicaciones.

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **GILEAD SCIENCES, INC.**, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América.

Dirección: 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Foster City, Estado de California, Estados Unidos de América.

IDENTIFICACION

C.C.

NIT

C.E. ☐

Otro ☐

Número ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLORED A RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 Piso 5º, Bogotá, Colombia

Teléfono: 3 264270 Fax: 2 126426

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

11-109.501

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones voluntarias al Capítulo
Reivindicatorio.

⑥

Comprobante de pago No. 11-0092016

Fecha 19 de Septiembre de 2011

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

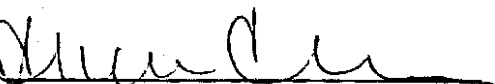
☐

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

⑧

NOMBRE ALICIA LLORED A RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0092016

Bogotá D.C., Septiembre 19 de 2011 - 16:44:30

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	414999535	19/09/2011	24.167.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	EN LA CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	118.000.00	118.000.00
				\$118.000.00

SON: **CIENTO DIECIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-109501- -00004-0000

Fecha: 2011-10-14 17:15:53 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 33

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

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

Septiembre 19 de 2011 - 16:47:26

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 11 - 0096791
		Bogotá D.C., Octubre 03 de 2011 - 16:41:17

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	415003643	03/10/2011	21.596.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO Vr. CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	1611 TASA ANUAL A#OS 4 a 8 PARA MANTENIMIENTO DE PATENTE DE	301.000.00 301.000.00
			\$301.000.00

SON: **TRESCIENTOS UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: 
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-109501- -00004-0000
Fecha: 2011-10-14 17:15:53 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 33

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 11 - 0096790
		Bogotá D.C., Octubre 03 de 2011 - 16:41:17

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	415003643	03/10/2011	21.596.000.00

*** Conceptos Pagados ***					
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO	
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	50.000.00	50.000.00	
					\$50.000.00
=====					

SON: **CINCUENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable _____
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-109501- -00004-0000
Fecha: 2011-10-14 17:15:53 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 33

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0099584

Bogotá D.C., Octubre 10 de 2011 - 17:10:45

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	415003654	10/10/2011	24.543.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES	27.000.00	27.000.00
				\$27.000.00

SON: **VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-109501-00004-0000

Fecha: 2011-10-14 17:15:53 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 33

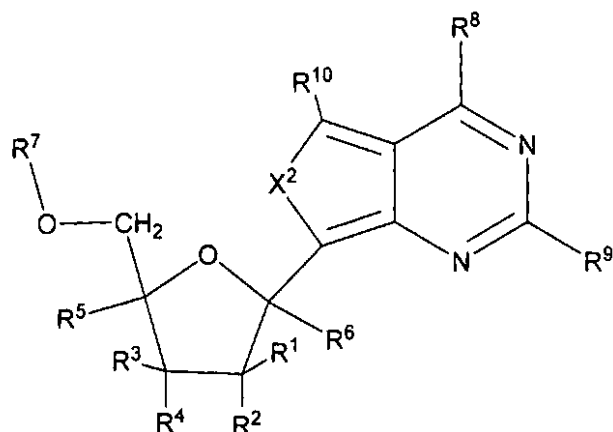
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: Info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Octubre 10 de 2011 - 17:10:52

5 Lo que se reivindica es:

1. Un compuesto de Formula I:



Formula I

10 o una sal farmacéuticamente aceptable o éster del mismo;

en donde:

15 cada R¹, R², R³, R⁴, R⁵ o R⁶ es independientemente H, OR^a, N(R^a)₂, N₃, CN, NO₂, S(O)_nR^a, halógeno, alquilo (C₁-C₈), carbociclilalquilo (C₄-C₈), alquilo (C₁-C₈) sustituido, alquenilo (C₂-C₈), alquenilo (C₂-C₈) sustituido, alquinilo (C₂-C₈), alquinilo (C₂-C₈) sustituido, o arilalquilo (C₁-C₈) o cualesquiera dos de R¹, R², R³, R⁴, R⁵ o R⁶ sobre átomos de carbono adyacentes son juntos-O(CO)O-;

20

cada n es independientemente 0, 1, o 2;

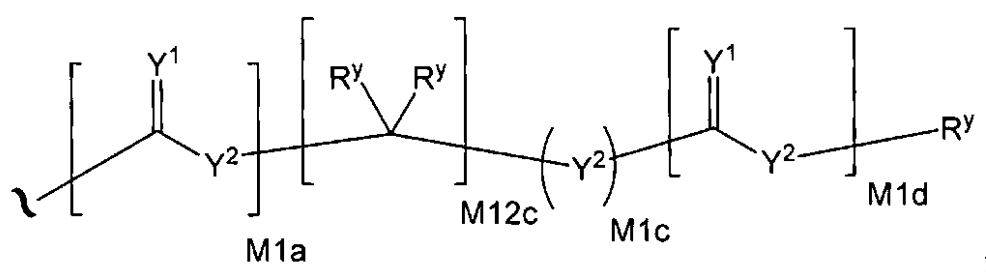
25 cada R^a es independientemente H, alquilo (C₁-C₈), alquenilo (C₂-C₈), alquinilo (C₂-C₈), arilalquilo (C₁-C₈), carbociclilalquilo (C₄-C₈), -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)₂, -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹),

5 cada Y^3 es independientemente O, S, o NR;

M2 es 0, 1 o 2;

cada R^x es independientemente R^y o la formula:

10



en donde:

cada M1a, M1c, y M1d es independientemente 0 o 1;

15 M12c es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12;

cada R^y es independientemente H, F, Cl, Br, I, OH, R, $-C(=Y^1)R$, $-C(=Y^1)OR$, $-C(=Y^1)N(R)_2$, $-N(R)_2$, $-N(R)_3$, $-SR$, $-S(O)R$, $-S(O)_2R$, $-S(O)(OR)$, $-S(O)_2(OR)$, $-OC(=Y^1)R$, $-OC(=Y^1)OR$, $-OC(=Y^1)(N(R)_2)$, $-SC(=Y^1)R$, $-SC(=Y^1)OR$, $-SC(=Y^1)(N(R)_2)$, $-N(R)C(=Y^1)R$, $-N(R)C(=Y^1)OR$, $-N(R)C(=Y^1)N(R)_2$, $-SO_2NR_2$, $-CN$, $-N_3$, $-NO_2$, $-OR$, o W^3 ; o cuando se toman juntos, dos R^y en el mismo átomo de carbono forman un anillo carbocíclico de 3 a 7 átomos de carbono;

25 cada R es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , o heterociclilo C_2-C_{20} sustituido;

- 5 W^3 es W^4 o W^5 ; W^4 es R, $-C(Y^1)R^y$, $-C(Y^1)W^5$, $-SO_2R^y$, o $-SO_2W^5$; y W^5 es un carbociclo o un heterociclo en donde W^5 está independientemente sustituido con 0 a 3 grupos R^y ;

cada X^2 es independientemente O, S, S(O), o S(O)₂;

10

cada R^8 , R^9 o R^{10} es independientemente H, halógeno, $NR^{11}R^{12}$, $N(R^{11})OR^{11}$, $NR^{11}NR^{11}R^{12}$, N_3 , NO, NO₂, CHO, CN, $-CH(=NR^{11})$, $-CH=NHNR^{11}$, $-CH=N(OR^{11})$, $-CH(OR^{11})_2$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=S)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)OR^{11}$, R^{11} , OR^{11} o SR^{11} ;

15

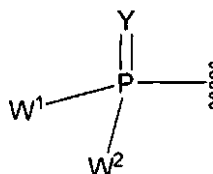
- cada R^{11} o R^{12} es independientemente H, alquilo (C₁-C₈), alqueno (C₂-C₈), alquino (C₂-C₈), carbociclilalquilo (C₄-C₈), arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, $-C(=O)$ alquilo (C₁-C₈), $-S(O)_n$ alquilo(C₁-C₈) o arilalquilo(C₁-C₈); o R^{11} y R^{12} tomados junto con un nitrógeno al cual
20 ambos están unidos, forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros en donde un átomo cualquiera de dicho anillo heterocíclico puede estar opcionalmente reemplazado con -O-, -S- o $-NR^a$; y

- en donde cada alquilo (C₁-C₈), alqueno (C₂-C₈), alquino (C₂-C₈) o
25 arilalquilo(C₁-C₈) de cada R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^{11} o R^{12} está, independientemente, opcionalmente sustituido con uno o más halo, hidroxí, CN, N₃, $N(R^a)_2$ o OR^a ; y en donde uno o más de los átomos de carbono no terminales of cada dicho alquilo (C₁-C₈) puede estar ocpionalmente reemplazado con -O-, -S- o $-NR^a$;

30

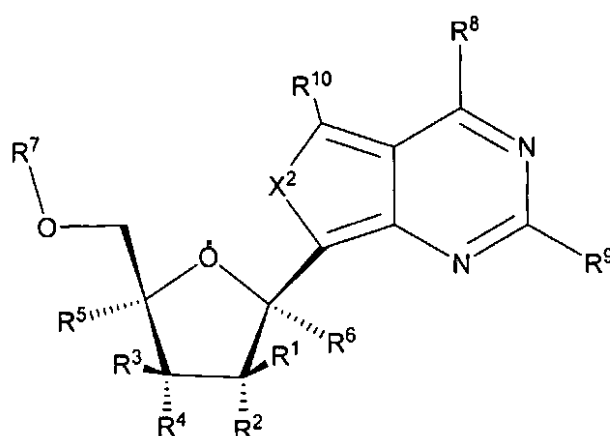
siempre que cuando X^2 es S, cada uno de R^9 y R^{10} es H y R^8 es NH₂, OH, SH, o SCH₃, entonces el último de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 o R^6 es $N(R^a)_2$, N₃,

- 5 CN, NO₂, S(O)_nR^a, halógeno, alquilo (C₁-C₈), carbociclialquilo (C₄-C₈), alquilo (C₁-C₈) sustituido, alquenilo (C₂-C₈), alquenilo (C₂-C₈) sustituido, alquinilo (C₂-C₈), alquinilo (C₂-C₈) sustituido o arilalquilo (C₁-C₈) o R⁷ es -C(=O)OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)₂, -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), -SO₂N(R¹¹)₂, o



10

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 representado por la Formula II



15

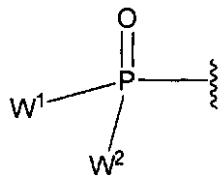
Formula II

en donde cada Y y Y¹ son O.

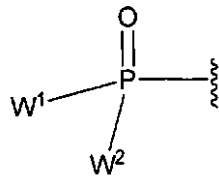
3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde X² es S y
 20 R⁸ es halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², OR¹¹ o SR¹¹.

- 5 4. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-3,
en donde R^6 es H, OR^a , N_3 , halógeno, CN, metilo, hidroximetilo, metilo
sustituido, etenilo, etenilo sustituido, etinilo, o etinilo sustituido.
- 10 5. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-4
en donde R^2 es F o OR^a .
6. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-5
en donde R^4 es OR^a y R^3 es H.
- 15 7. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-6
en donde R^1 es CH_3 .
8. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-7
en donde R^6 es CN o OR^a .
- 20 9. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-7
en donde R^6 es H.
10. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-9
25 en donde R^8 es OH o NH_2 .
11. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-
10 en donde R^9 es H o $NR^{11}R^{12}$.
- 30 12. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-
11 en donde R^7 es H o

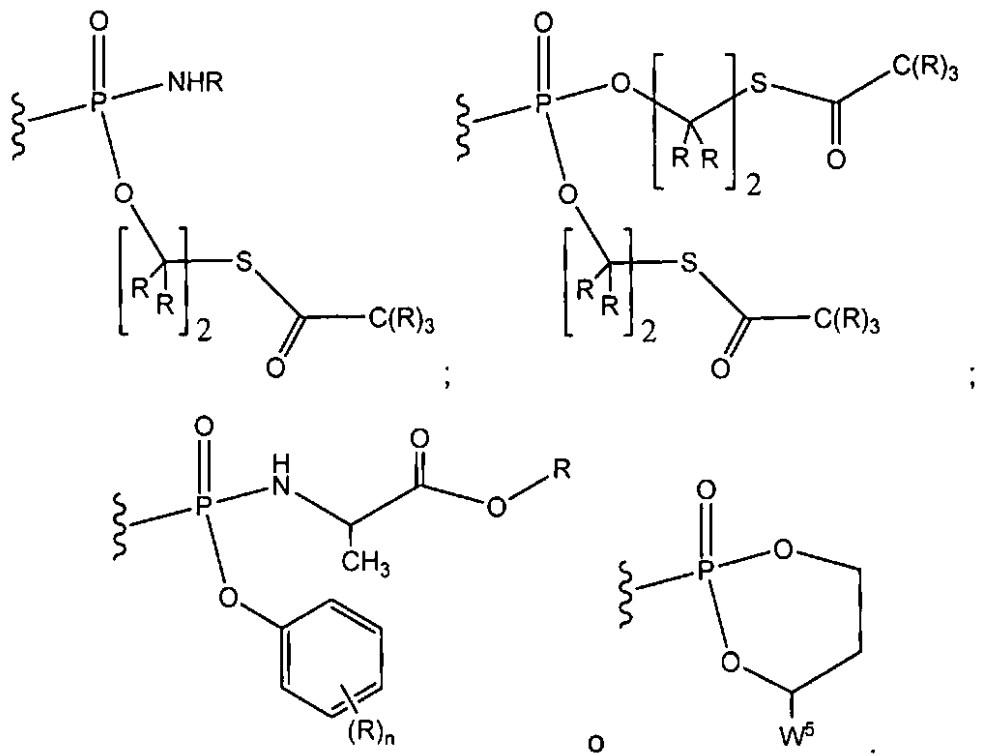
5



13. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-12 en donde

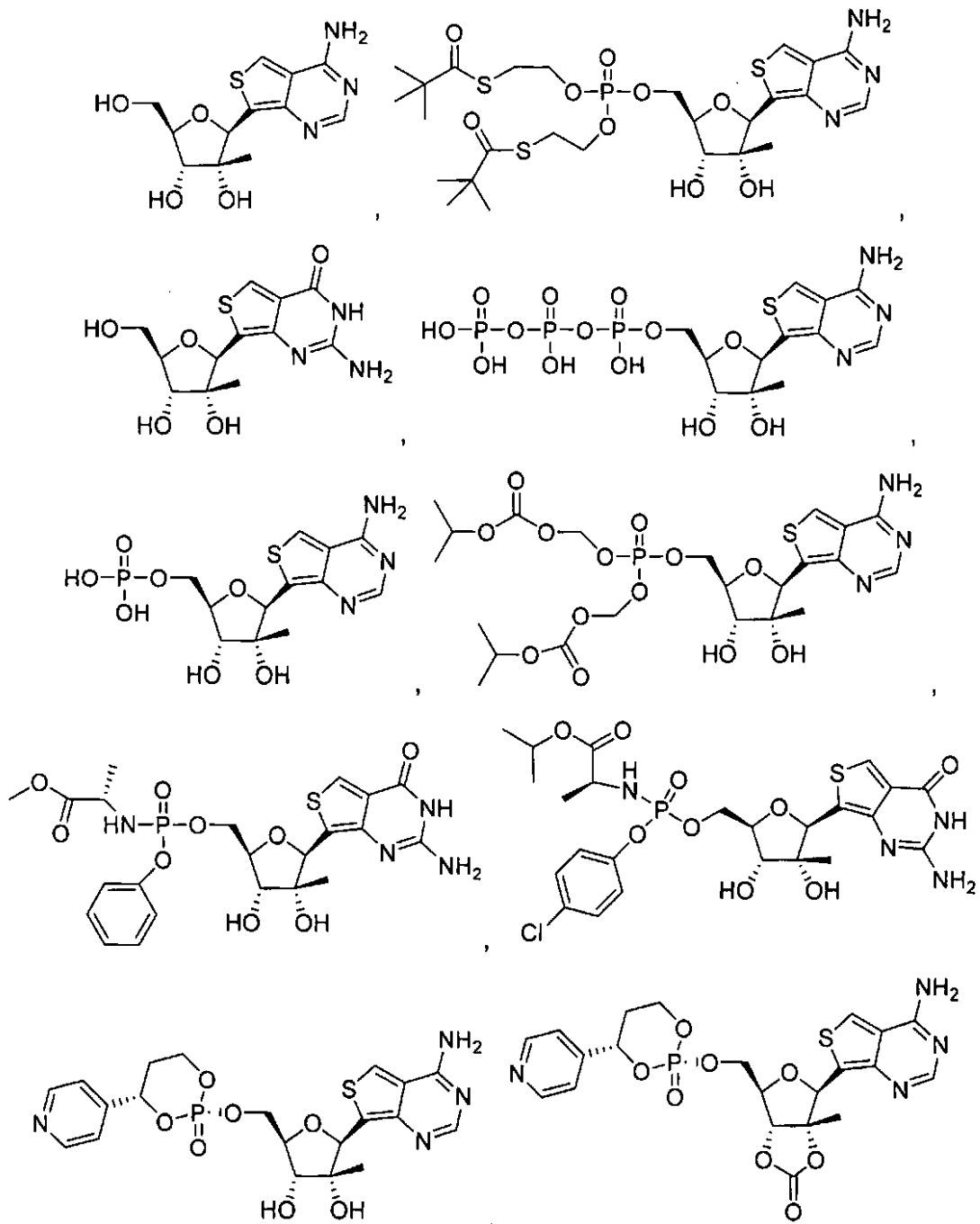


10 se selecciona de

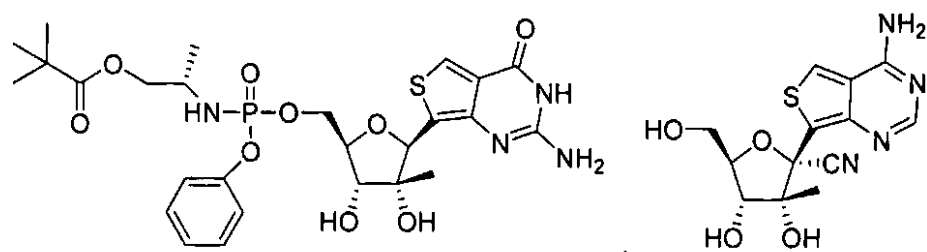
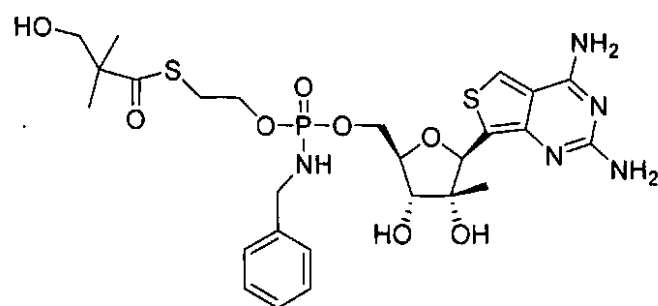
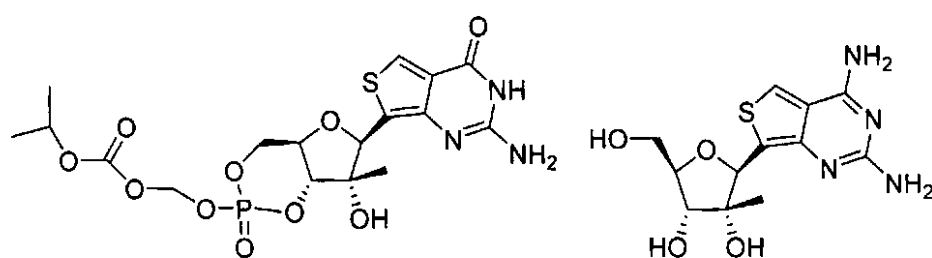
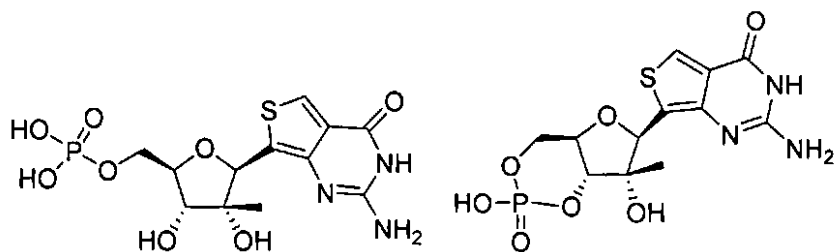
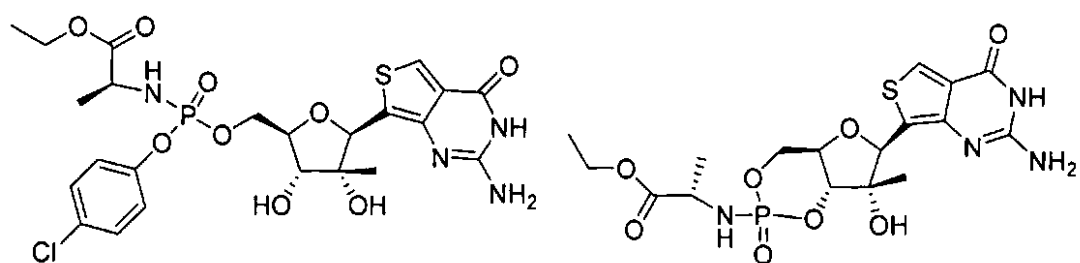


15

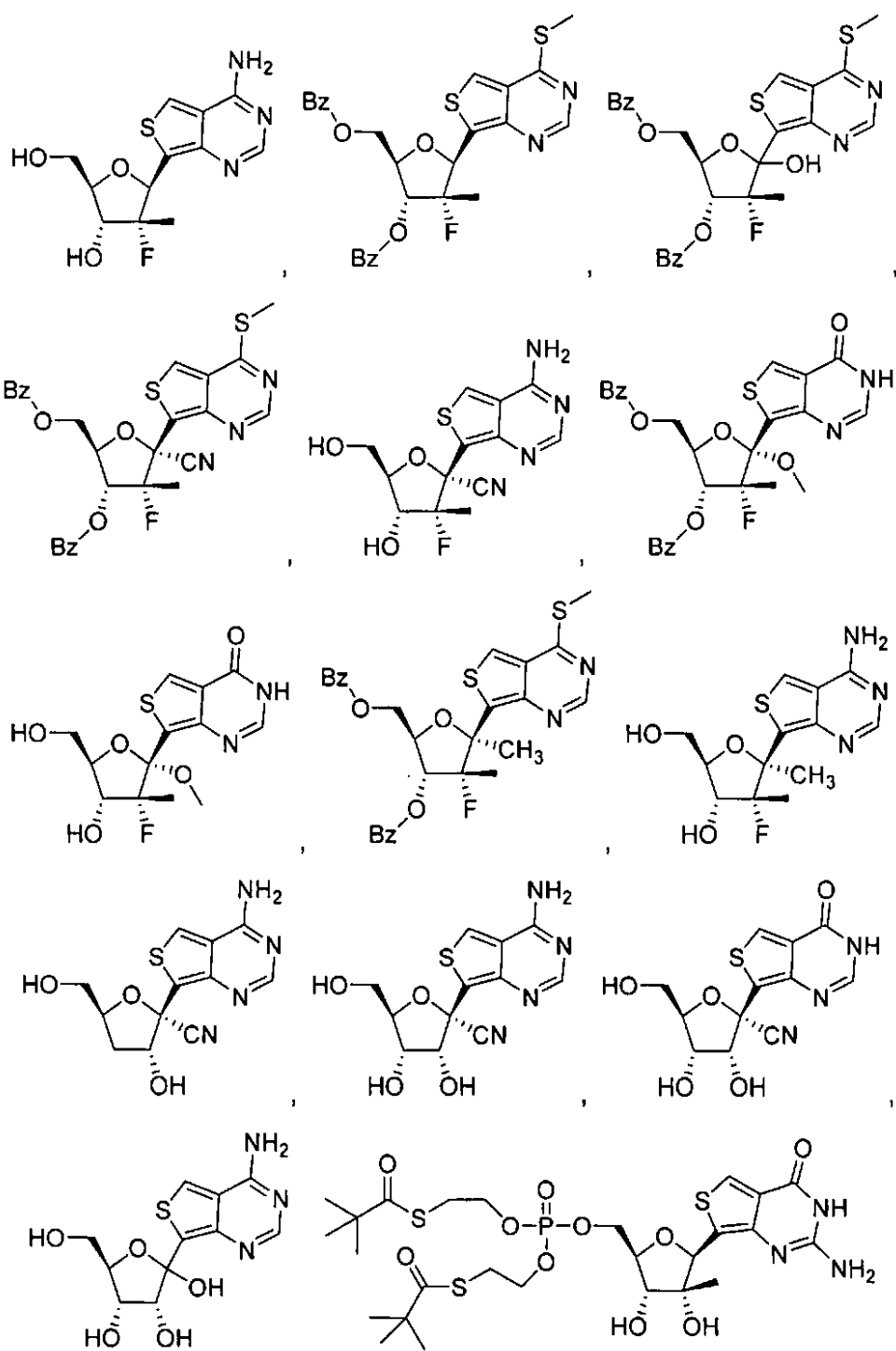
5 14. Un compuesto que es



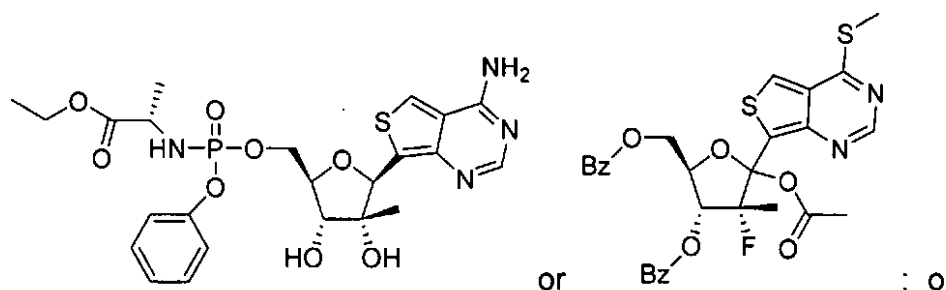
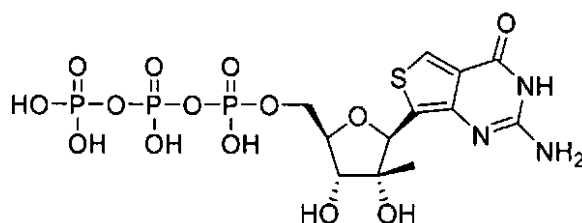
5



5



5



una sal farmacéuticamente aceptable o éster del mismo.

15. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad
10 terapéuticamente efectiva de un compuesto de una cualquiera de las
reivindicaciones 1-14 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

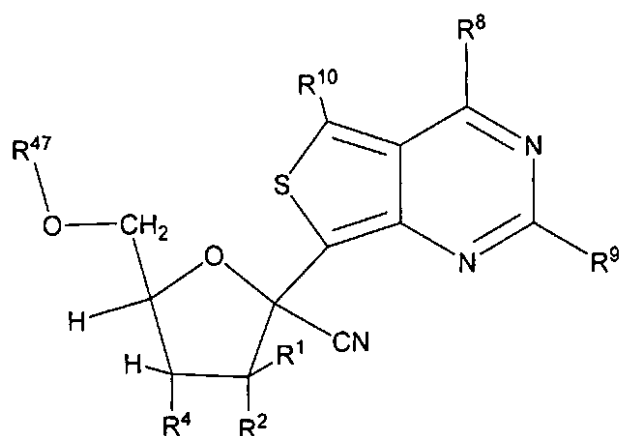
16. La composición farmacéutica de la reivindicación 15 que comprende
además al menos un agente terapeutico adicional.

15

17. La composición farmacéutica de la reivindicación 16, que además
comprende al menos un agente terapéutico adicional seleccionado del grupo
que consiste de interferones, ribavirina o sus análogos, inhibidores de proteasa
NS3 del VHC, inhibidores de alfa-glucosidasa 1, hepatoprotectores, inhibidores
20 nucleósidos o nucleótidos de la polimerasa NS5B del VHC, inhibidores no
nucleósidos de la polimerasa NS5B del VHC, inhibidores de NS5A del VHC,
agonistas de TLR-7, inhibidores de ciclofilina, inhibidores de IRES del VHC,
potenciadores farmacocinéticos, y otros fármacos para el tratamiento del VHC,
o mezclas de los mismos.

25

- 5 18. Un método para preparar un compuesto representado por la Formula IV:



Formula IV

o una sal o éster farmacéuticamente aceptable del mismo;

10

en donde:

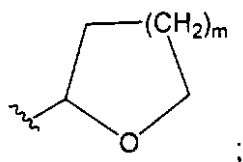
- R^1 es H, alquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-C_8),
 15 alquinilo (C_2-C_8) sustituido, o arilalquilo (C_1-C_8);

cada R^2 , R^4 es independientemente H, F o OR^{44} ;

- cada R^{43} es independientemente alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclilo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} , arilalquilo C_7-C_{20} sustituido, alcoxi (C_1-C_8), o alcoxi (C_1-C_8) sustituido;

- cada R^{44} o R^{47} es independientemente $-C(R^{45})_2R^{46}$, $Si(R^{43})_3$, $C(O)R^{45}$,
 25 $C(O)OR^{45}$, $-(C(R^{45})_2)_m-R^{55}$ o

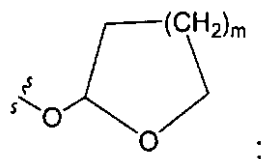
5



O cualesquiera dos de R^{44} o R^{47} cuando se toman juntos son $-C(R^{59})_2-$, $-C(O)-$ o $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$;

10

cada R^{55} es independientemente $-O-C(R^{45})_2R^{46}$, $-Si(R^{43})_3$, $-OC(O)OR^{45}$, $-OC(O)R^{45}$ o



15

cada R^{45} , R^{58} o R^{59} es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclilo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} o arilalquilo C_7-C_{20} sustituido;

20

cada R^{46} es independientemente arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, o heteroarilo opcionalmente sustituido;

cada R^a es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8), arilalquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)R^{11}$, $-S(O)_2R^{11}$, $-S(O)(OR^{11})$, $-S(O)_2(OR^{11})$, o $-SO_2NR^{11}R^{12}$;

25

5 cada X^{42} es O o CH_2 ;

cada m es 1 o 2;

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

10

cada R^8 , R^9 o R^{10} es independientemente H, halógeno, $NR^{11}R^{12}$, $N(R^{11})OR^{11}$, $NR^{11}NR^{11}R^{12}$, N_3 , NO, NO_2 , CHO, CN, $-CH(=NR^{11})$, $-CH=NHNR^{11}$, $-CH=N(OR^{11})$, $-CH(OR^{11})_2$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=S)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)OR^{11}$, R^{11} , OR^{11} o SR^{11} ;

15

cada R^{11} o R^{12} es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8), carbociclilo (C_3-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, $-C(=O)$ alquilo (C_1-C_8), $-S(O)_n$ alquilo (C_1-C_8), arilalquilo (C_1-C_8) o $Si(R^3)_3$; o R^{11} y R^{12} tomados
 20 junto con un nitrógeno al cual ambos están unidos, forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros en donde un átomo cualquiera de dicho anillo heterocíclico puede estar opcionalmente reemplazado con $-O-$, $-S(O)_n-$ o $-NR^a-$; o R^{11} y R^{12} tomados juntos son $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$;

25

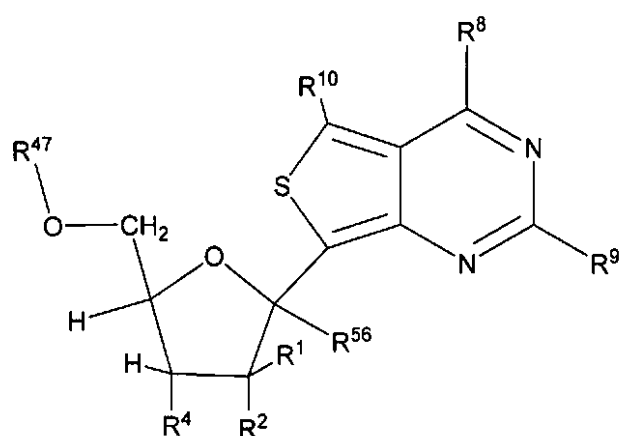
en donde cada alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8) o arilalquilo (C_1-C_8) de cada R^1 , R^{43} , R^{45} , R^{58} , R^{59} , R^{11} o R^{12} está, independientemente, opcionalmente sustituido con uno o más halo, hidroxilo, CN, N_3 , $N(R^a)_2$ o OR^a ; y en donde uno o más de los átomos de carbono no
 30 terminales de cada dicho alquilo (C_1-C_8) está opcionalmente reemplazado con

30

$-O-$, $-S(O)_n-$ o $-NR^a-$;

dicho método comprende:

(a) proveer un compuesto de Formula V



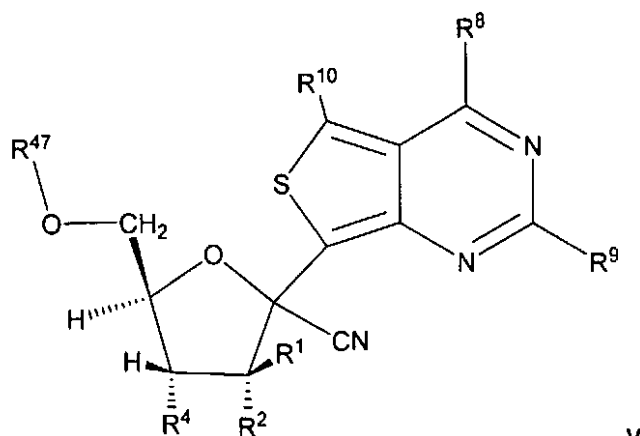
Formula V

en donde R^{56} es OH, $-OC(O)OR^{58}$ o $-OC(O)R^{58}$;

(b) tratar el compuesto de Formula V con un reactivo de cianuro y un ácido de Lewis;

por medio de lo cual se forma el compuesto de Formula IV.

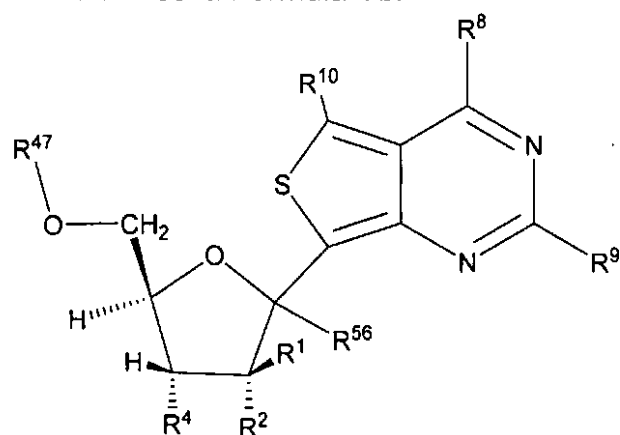
19. El método de la reivindicación 18, en donde el compuesto de Formula IV es la Formula IVb



Formula IVb

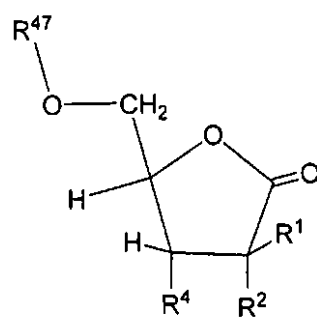
y

5 el compuesto de Formula V es la Formula Vb:



20. El método de la reivindicación 18 que comprende además preparar un
 10 compuesto de Formula V en donde R⁵⁶ es OH,
 el método comprende:

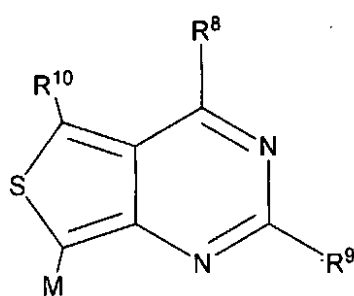
(e) proveer un compuesto de Formula VI:



Formula VI

15

(f) tratar el compuesto de Formula VI con un compuesto organometálico
 de Formula VII:

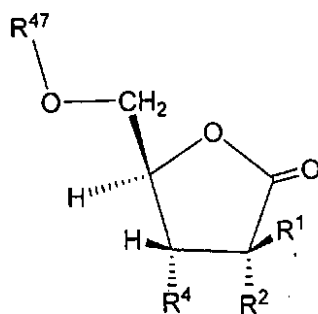


Formula VII

en donde M es MgX^3 o Li y X^3 es halógeno;

por medio de lo cual se forma un compuesto de Formula V en donde R^{56} es OH.

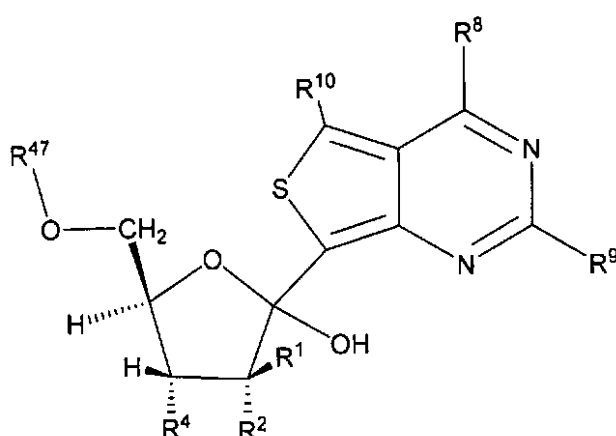
21. El método de la reivindicación 20, en donde el compuesto de Formula V es la Formula Vb en donde R^{56} es OH y el compuesto de Formula VI es un compuesto de Formula VIb:



Formula VIb

22. Un compuesto útil para la síntesis de un compuesto anti-viral de Formula I representado por la Formula IX:

20



Formula IX

o una sal o éster aceptable del mismo;

en donde:

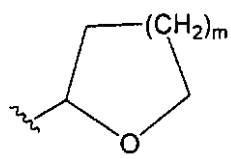
R^1 es H, alquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8) sustituido, o arilalquilo (C_1-C_8);

cada R^2 , R^4 es independientemente H, F o OR^{44} ;

cada R^{43} es independientemente alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclolo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} , arilalquilo C_7-C_{20} sustituido, alcoxi (C_1-C_8), o alcoxi (C_1-C_8) sustituido;

cada R^{44} o R^{47} es independientemente $-C(R^{45})_2R^{46}$, $Si(R^{43})_3$, $C(O)R^{45}$, $C(O)OR^{45}$, $-(C(R^{45})_2)_m-R^{55}$ o

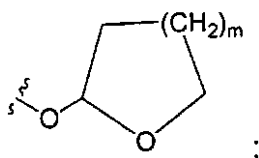
5



o cualesquiera dos de R^{44} o R^{47} cuando se toman juntos son $-C(R^{59})_2$,
 $-C(O)-$ o $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$;

10

cada R^{55} es independientemente $-O-C(R^{45})_2R^{46}$, $-Si(R^{43})_3$, $-OC(O)OR^{45}$,
 $-OC(O)R^{45}$ o



15

cada R^{45} , R^{58} o R^{59} es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquilo
 (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-
 C_8), alquinilo (C_2-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido,
heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclilo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} o
arilalquilo C_7-C_{20} sustituido;

20

cada R^{46} es independientemente arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, o
heteroarilo opcionalmente sustituido;

25

cada R^a es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8),
alquinilo (C_2-C_8), arilalquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), $-C(=O)R^{11}$,
 $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)R^{11}$, $-S(O)_2R^{11}$, $-S(O)(OR^{11})$,
 $-S(O)_2(OR^{11})$, o $-SO_2NR^{11}R^{12}$;

cada X^{42} es O o CH_2 ;

5 cada m es 1 o 2;

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

en donde:

10 R^1 es H, alquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8) sustituido, o arilalquilo (C_1-C_8);

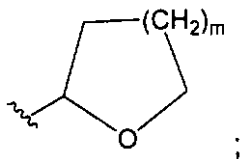
cada R^2 o R^4 es independientemente H, F o OR^{44} ;

15

cada R^{43} es independientemente alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclilo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} , arilalquilo C_7-C_{20} sustituido, alcoxi (C_1-C_8), o alcoxi (C_1-C_8) sustituido;

20

cada R^{44} o R^{47} es independientemente $-C(R^{45})_2R^{46}$, $Si(R^{43})_3$, $C(O)R^{45}$, $C(O)OR^{45}$, $-(C(R^{45})_2)_m-R^{55}$ o

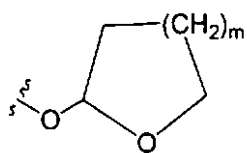


25

o cualesquiera dos de R^{44} o R^{47} cuando se toman juntos son $-C(R^{59})_2-$, $-C(O)-$ o $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$;

cada R^{55} es independientemente $-O-C(R^{45})_2R^{46}$, $-Si(R^{43})_3$, $C(O)OR^{45}$, $-OC(O)R^{45}$ o

5



;

cada R^{45} , R^{58} o R^{59} es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alquenilo (C_2-C_8), alquenilo (C_2-C_8) sustituido, alquinilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclilo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} o arilalquilo C_7-C_{20} sustituido;

15

cada R^{46} es independientemente arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, o heteroarilo opcionalmente sustituido;

20

cada R^a es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8), arilalquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)R^{11}$, $-S(O)_2R^{11}$, $-S(O)(OR^{11})$, $-S(O)_2(OR^{11})$, o $-SO_2NR^{11}R^{12}$;

cada X^{42} es O o CH_2 ;

cada m es 1 o 2;

25

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

30

cada R^8 , R^9 o R^{10} es independientemente H, halógeno, $NR^{11}R^{12}$, $N(R^{11})OR^{11}$, $NR^{11}NR^{11}R^{12}$, N_3 , NO, NO_2 , CHO, CN, $-CH(=NR^{11})$, $-CH=NHNR^{11}$, $-CH=N(OR^{11})$, $-CH(OR^{11})_2$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=S)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)OR^{11}$, R^{11} , OR^{11} o SR^{11} ;

5 cada R^{11} o R^{12} es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alqueno (C_2-C_8), alquino (C_2-C_8), carbociclilo (C_3-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, $-C(=O)$ alquilo (C_1-C_8), $-S(O)_n$ alquilo (C_1-C_8), arilalquilo (C_1-C_8) o $Si(R^3)_3$; o R^{11} y R^{12} tomados
 10 junto con un nitrógeno al cual ambos están unidos, forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros en donde un átomo cualquiera de dicho anillo heterocíclico puede estar opcionalmente reemplazado con $-O-$, $-S(O)_n-$ o $-NR^a-$; o R^{11} y R^{12} tomados juntos son $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$; y

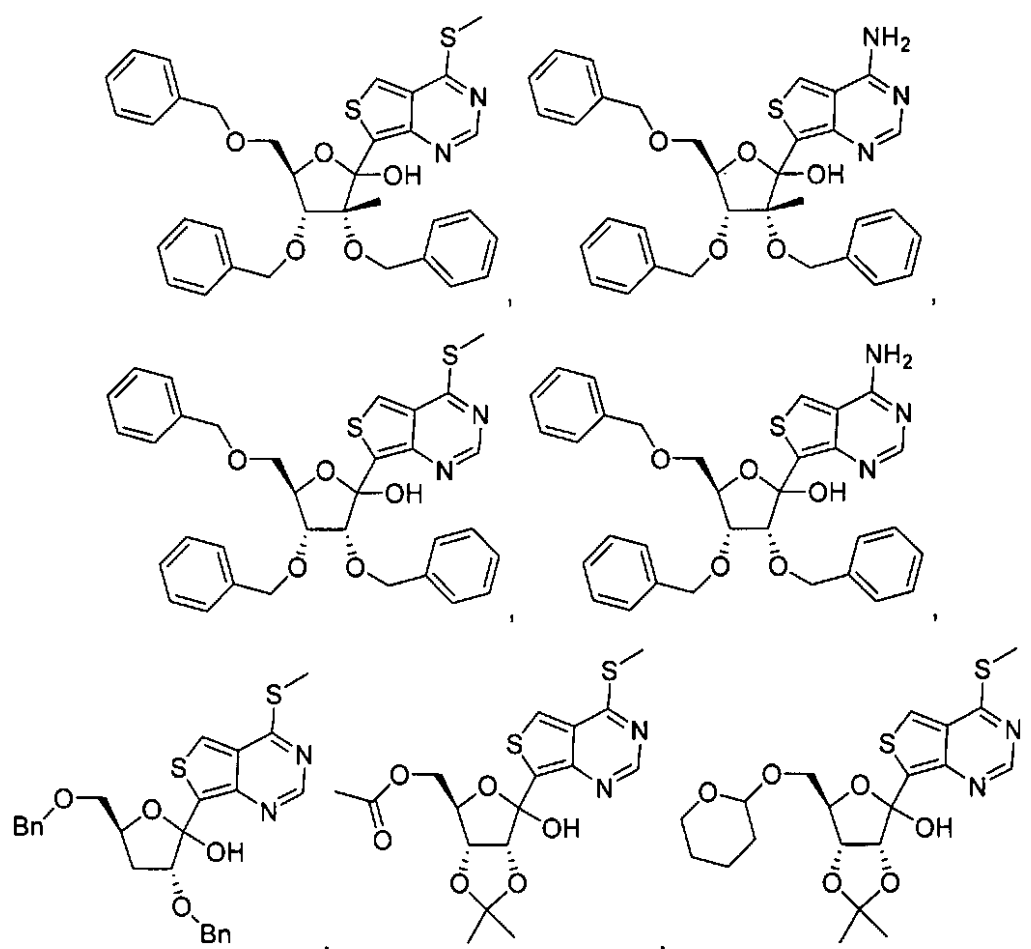
 en donde cada alquilo (C_1-C_8), alqueno (C_2-C_8), alquino (C_2-C_8) o
 15 arilalquilo (C_1-C_8) de cada R^1 , R^{43} , R^{45} , R^{58} , R^{59} , R^{11} o R^{12} está, independientemente, opcionalmente sustituido con uno o más halo, hidroxilo, CN, N_3 , $N(R^a)_2$ u OR^a ; y en donde uno o más de los átomos de carbono no terminales de cada dicho alquilo (C_1-C_8) está opcionalmente reemplazado con
 20 $-O-$, $-S(O)_n-$ o $-NR^a-$.

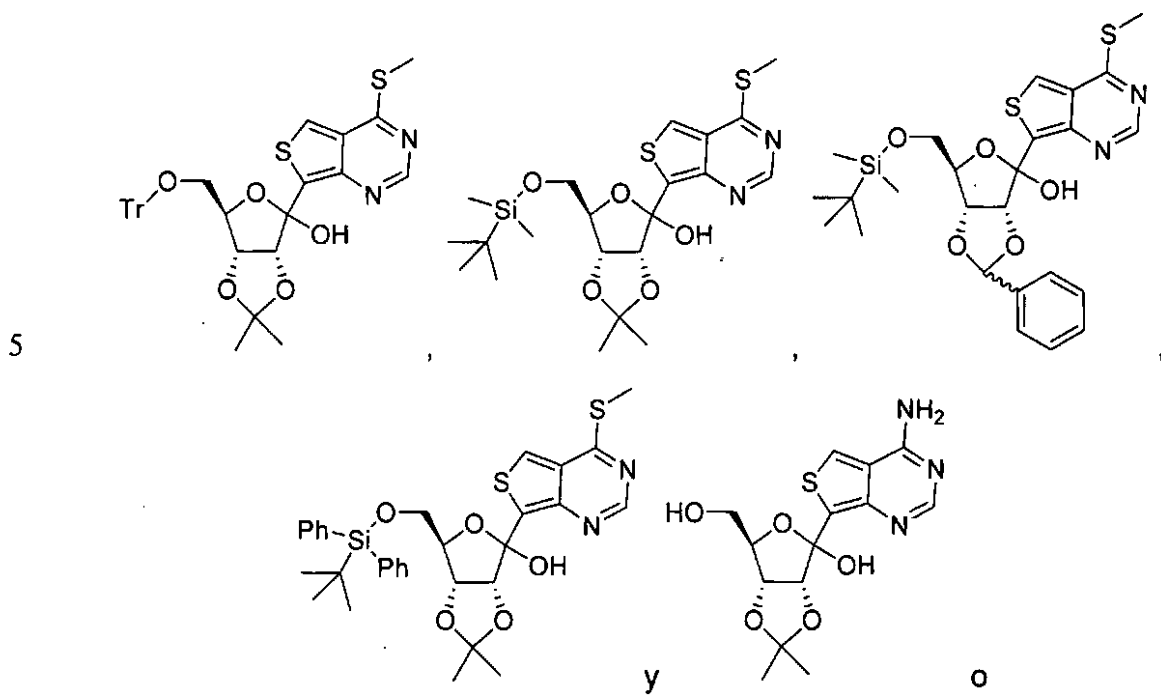
23. El compuesto de la reivindicación 22 seleccionado del grupo que consiste de

25

30

5

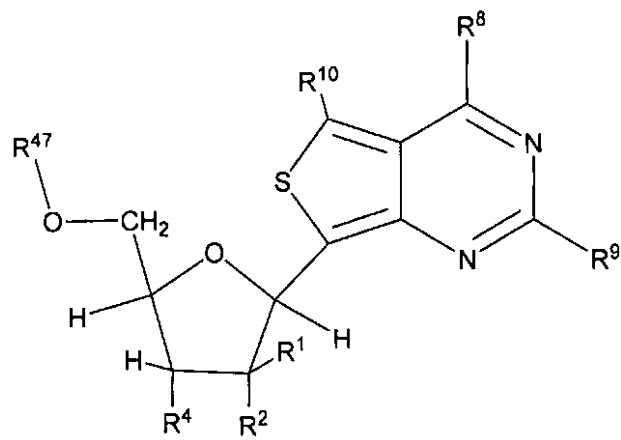




una sal o éster del mismo.

24. Un método para preparar un compuesto de Formula X:

10



Formula X

o una sal o éster aceptable del mismo;

en donde:

15

- 5 R^1 es H, alquilo (C_1-C_8), carbociclilalquilo (C_4-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alqueno (C_2-C_8), alqueno (C_2-C_8) sustituido, alquino (C_2-C_8), alquino (C_2-C_8) sustituido, o arilalquilo (C_1-C_8);

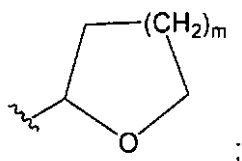
cada R^2 o R^4 es independientemente H, F o OR^{44} ;

10

cada R^{43} es independientemente alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, arilo C_6-C_{20} , arilo C_6-C_{20} sustituido, heterociclilo C_2-C_{20} , heterociclilo C_2-C_{20} sustituido, arilalquilo C_7-C_{20} , arilalquilo C_7-C_{20} sustituido, alcoxi (C_1-C_8), o alcoxi (C_1-C_8) sustituido;

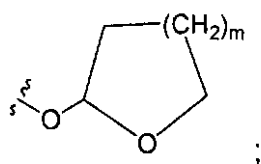
15

cada R^{44} o R^{47} es independientemente $-C(R^{45})_2R^{46}$, $Si(R^{43})_3$, $C(O)R^{45}$, $C(O)OR^{45}$, $-(C(R^{45})_2)_m-R^{55}$ o



- 20 o cualesquiera dos de R^{44} o R^{47} cuando se toman juntos son $-C(R^{59})_2-$, $-C(O)-$ o $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$;

cada R^{55} es independientemente $-O-C(R^{45})_2R^{46}$, $-Si(R^{43})_3$, $-OC(O)OR^{45}$, $-OC(O)R^{45}$ o



25

cada R^{45} , R^{58} o R^{59} es independientemente H, alquilo (C_1-C_8), alquilo (C_1-C_8) sustituido, alqueno (C_2-C_8), alqueno (C_2-C_8) sustituido, alquino (C_2-

5 C₈), alquinilo (C₂-C₈) sustituido, arilo C₆-C₂₀, arilo C₆-C₂₀ sustituido, heterociclilo C₂-C₂₀, heterociclilo C₂-C₂₀ sustituido, arilalquilo C₇-C₂₀ o arilalquilo C₇-C₂₀ sustituido;

10 cada R⁴⁶ es independientemente arilo C₆-C₂₀, arilo C₆-C₂₀ sustituido, o heteroarilo opcionalmente sustituido;

15 cada R^a es independientemente H, alquilo (C₁-C₈), alquenilo (C₂-C₈), alquinilo (C₂-C₈), arilalquilo (C₁-C₈), carbociclilalquilo (C₄-C₈), -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), o -SO₂NR¹¹R¹²;

cada X⁴² es O o CH₂;

20 cada m es 1 o 2;

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

25 cada R⁸, R⁹ o R¹⁰ es independientemente H, halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², N₃, NO, NO₂, CHO, CN, -CH(=NR¹¹), -CH=NHNR¹¹, -CH=N(OR¹¹), -CH(OR¹¹)₂, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=S)NR¹¹R¹², -C(=O)OR¹¹, R¹¹, OR¹¹ o SR¹¹;

30 cada R¹¹ o R¹² es independientemente H, alquilo (C₁-C₈), alquenilo (C₂-C₈), alquinilo (C₂-C₈), carbociclilo (C₃-C₈), carbociclilalquilo (C₄-C₈), arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, -C(=O)alquilo (C₁-C₈), -S(O)_nalquilo (C₁-C₈), arilalquilo (C₁-C₈) o Si(R³)₃; o R¹¹ y R¹² tomados junto con un nitrógeno al cual ambos están unidos, forman un anillo

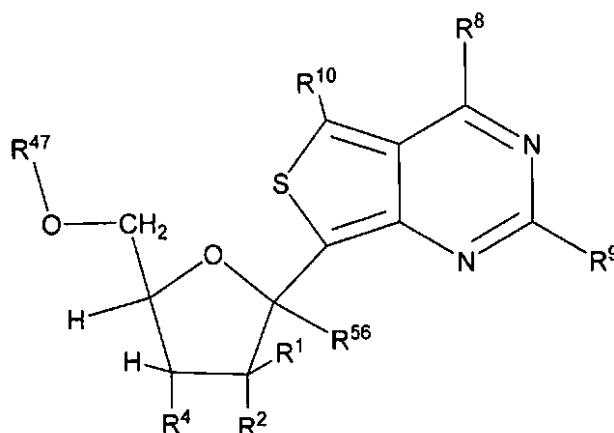
- 5 heterocíclico de 3 a 7 miembros en donde un átomo cualquiera de dicho anillo heterocíclico puede estar opcionalmente reemplazado con $-O-$, $-S(O)_n-$ o $-NR^a-$; o R^{11} y R^{12} tomados juntos son $-Si(R^{43})_2(X^{42})_mSi(R^{43})_2-$;

- 10 en donde cada alquilo (C_1-C_8), alqueno (C_2-C_8), alquino (C_2-C_8) o arilalquilo (C_1-C_8) de cada R^1 , R^{43} , R^{45} , R^{58} , R^{59} , R^{11} o R^{12} está, independientemente, opcionalmente sustituido con uno o más halo, hidroxilo, CN, N_3 , $N(R^a)_2$ o OR^a ; y en donde uno o más de los átomos de carbono no terminales de cada dicho alquilo (C_1-C_8) está opcionalmente reemplazado con $-O-$, $-S(O)_n-$ o $-NR^a-$;

15

dicho método comprende:

(a) proveer un compuesto de Formula V



Formula V

- 20 en donde R^{56} es OH, $-OC(O)OR^{58}$ o $-OC(O)R^{58}$;

(b) tratar el compuesto de Formula V con un ácido de Lewis y un agente reductor que es $HSi(R^{43})_3$;

- 25 por medio de lo cual se forma el compuesto de Formula X.