

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-115223- -00005-0000

Fecha: 2011-05-19 16:38:09 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 62

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 ANÁLOGOS DE LA MISMA".-Clase
C07D 207/26.-Expediente número 08-115.223.-

1. Me refiero a mi memorial de 26 de Diciembre de 2008.
2. Atentamente me permito manifestar ante ese Despacho que el solicitante de la invención en cuestión ha decidido realizar las siguientes modificaciones en el capítulo reivindicatorio de la solicitud:
 - En la tercera línea de la reivindicación 8 se ha reemplazado el término 'Li' por el término correcto 'R₄-Li'. Dicha modificación obedece a la corrección de un evidente error tipográfico cometido durante la redacción del capítulo reivindicatorio, tal y como se demuestra a partir de lo descrito en, por ejemplo, la última línea de la página 50 de la descripción ó en la página 30 del documento WO 2007/117591;
 - Las reivindicaciones 22, 23, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 36, 37, 39, 40, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 51, 52, 53, 54, 56, 57, 58, 59, 61, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 71, 72, 73, 74, 76, 77, 78, 79, 81, 82, 83, 84, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 93, 94, 96, 97, 98, 99, 101, 102, 103, 105, 106,

107, 108, 112, 113, 114, 115, 117, 119, 120, 122, 123, 125, 126, 127, 128, 130, 131, 133, 134, 136, 137, 139, 140, 142, 143, 144, 145, 147, 148, 149, 150, 152, 153, 154, 155, 157, 158, 159, 160, 162, 163, 164, 165, 167, 168, 169, 170, 171, 173, 174, 175, 176, 178, 179, 180, 181, 183, 184 y 185 actualmente presentadas han sido eliminadas; y

- Como consecuencia de lo anterior, las reivindicaciones 1 a 21, 24, 27, 32, 35, 38, 41, 44, 50, 55, 60, 65, 70, 75, 80, 85, 90, 95, 100, 104, 109, 110, 111, 116, 118, 121, 124, 129, 132, 135, 138, 141, 146, 151, 156, 161, 166, 172, 177 y 182 actualmente presentadas han sido enumeradas como nuevas reivindicaciones 1 a 60, respectivamente.

Finalmente y con base en lo anteriormente mencionado, me permito manifestar a ese Despacho que las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio de la solicitud en cuestión no amplían de manera alguna el alcance de la solicitud presentada originalmente, cumpliendo por lo tanto a cabalidad con las disposiciones de patentabilidad establecidas en el Artículo 34 de la Decisión 486 de 2000.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de correcciones y modificaciones;
- (b) Recibo número 11-0040958, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio que acredita el pago de la tasa de modificación; y
- (c) Copia del nuevo capítulo reivindicatorio de la solicitud, el cual está compuesto por **60** reivindicaciones y reemplaza al capítulo reivindicatorio actualmente presentado.



JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

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

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED A RICAURTE

T.P. 53.215

BOGOTÁ, D.C. 19 del distrito de Bogotá, compareció:
ALICIA LLORED A RICAURTE
C.C. No. 29.686.713 de Usaquén
Declaró: mi nombre e identificación son los anteriormente
mencionados; puedo espontáneamente a esta diligencia
donde he leído en forma legal la totalidad de este documento
del cual reconozco como cierto su contenido y la firma puesta
en el de mi autoría.
19 MAYO 2011
Bogotá, D.C.
ALICIA LLORED A RICAURTE
C.C. No. 29.686.713 de Usaquén
Molina Díaz
C.C. No. 20.066.778
Vobó



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **NEREUS PHARMACEUTICALS, INC.**, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de California, Estados Unidos de América.

Dirección: 10480 Wateridge Circle, San Diego, CA 92121, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270 Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: San Diego, Estado de California, Estados Unidos de América.

IDENTIFICACION

C.C. NIT

C.E. ☐ Otro ☐

☐ ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 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:

08-115.223

⑤

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

⑥

Comprobante de pago No. 11-0040958 **Fecha** 2 de Mayo 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 LLOREDA 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 - 0040958

Bogotá D.C., Mayo 02 de 2011 - 18:28:00

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	414999771	02/05/2011	69.576.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES EN 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. 08-115223- -00005-0000

Fecha: 2011-05-19 16:38:09 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 62

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

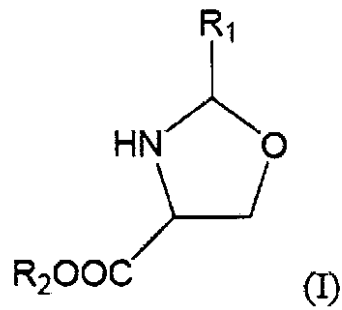
Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Mayo 2 de 2011 - 18:28:23

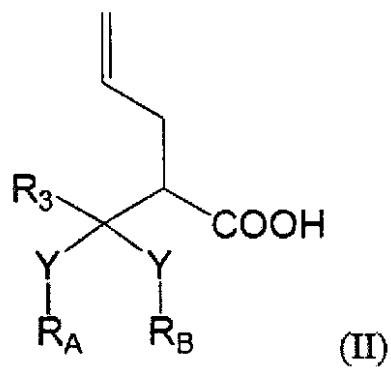
REIVINDICACIONES

1. Un método para la síntesis química, que comprende las etapas de:

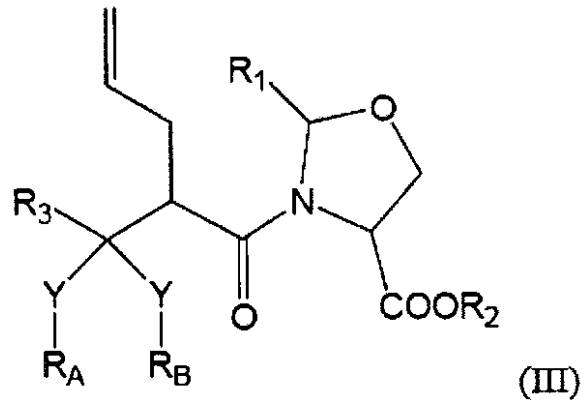
(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (I):



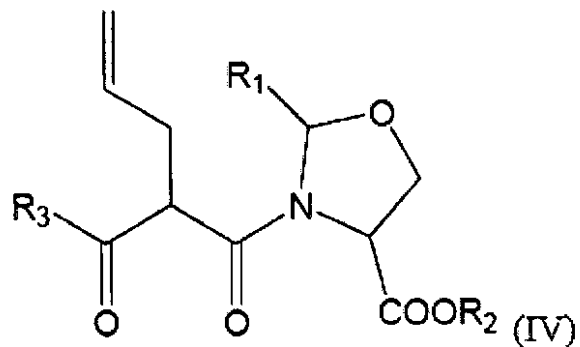
con un compuesto de la fórmula (II):



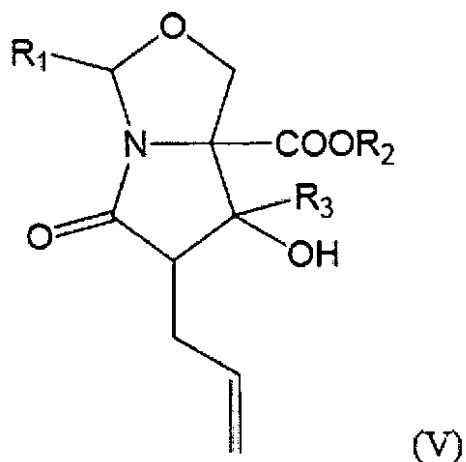
para formar un compuesto de la fórmula (III):



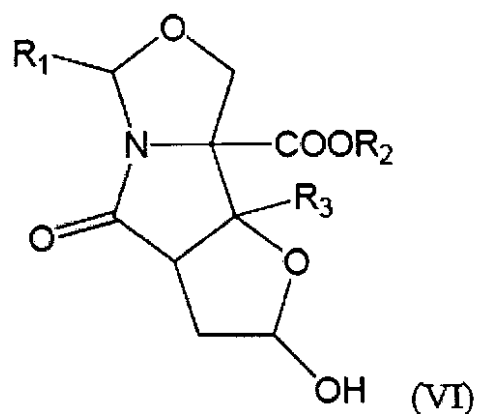
(b) desproteger el compuesto de la fórmula (III) para formar un compuesto de la fórmula (IV):



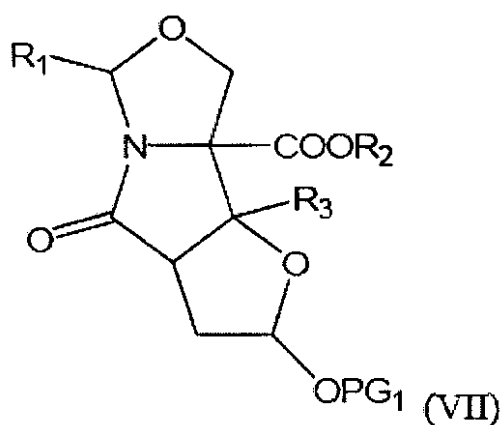
(c) llevar a cabo una reacción de aldol intramolecular en el compuesto de la fórmula (IV) para formar un compuesto de la fórmula (V):



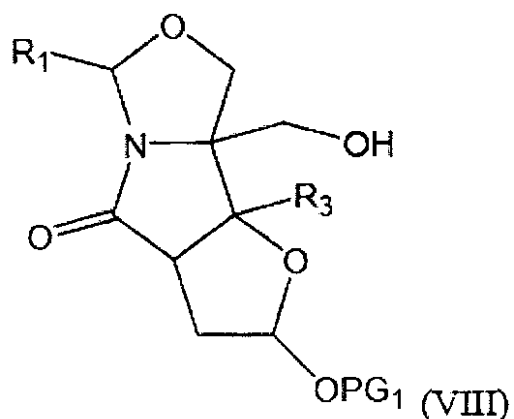
(d) romper el enlace doble de carbono-carbono del compuesto de la fórmula (V) y ciclar el enlace doble roto con el grupo hidroxilo terciario para formar un compuesto de la fórmula (VI):



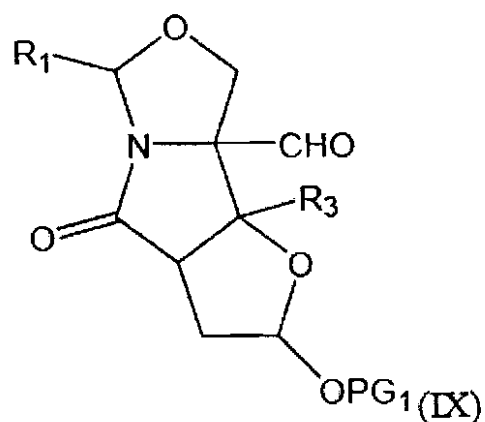
(e) proteger el hemiacetal del compuesto de la fórmula (VI) para formar un compuesto de la fórmula (VII):



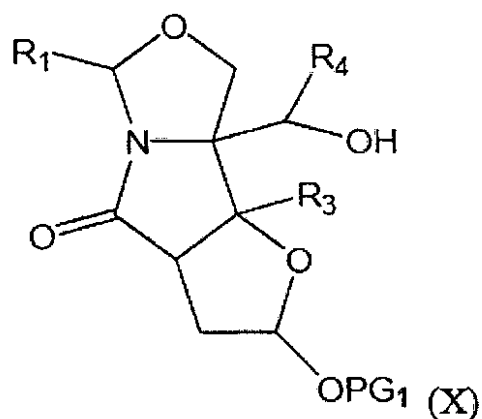
(f) reducir el grupo COOR_2 del compuesto de la fórmula (VII) a un alcohol para formar un compuesto de la fórmula (VIII):



(g) oxidar el alcohol del compuesto de la fórmula (VIII) para formar un compuesto de la fórmula (IX):

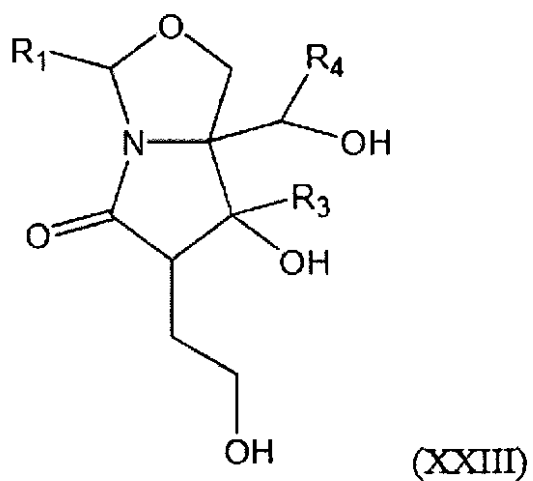


(h) agregar el R_4 al compuesto de la fórmula (IX) al hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (IX) con un residuo organometálico que contiene al menos un R_4 para formar un compuesto de la fórmula (X):

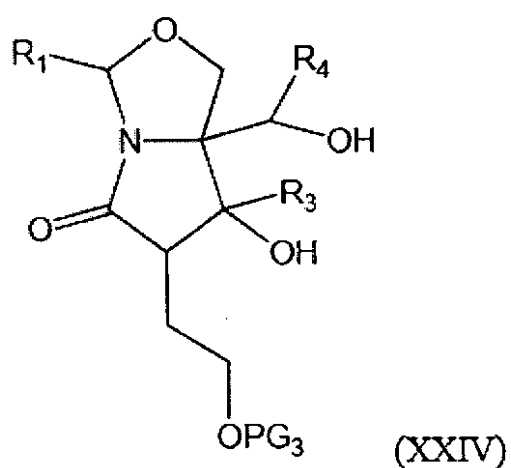


(i) retirar el PG_1 en el compuesto de la fórmula (X) y abrir reductivamente el hemiacetal del compuesto de

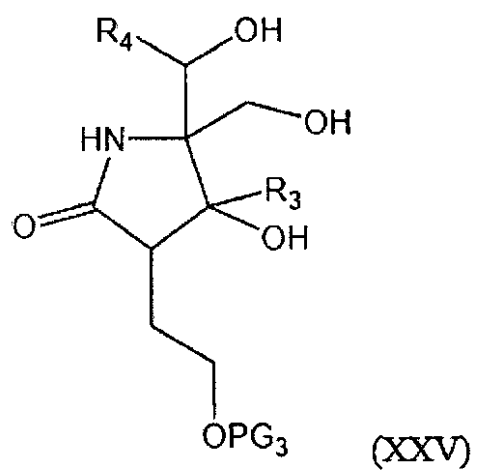
la fórmula (X) para formar un compuesto de la fórmula (XXIII):



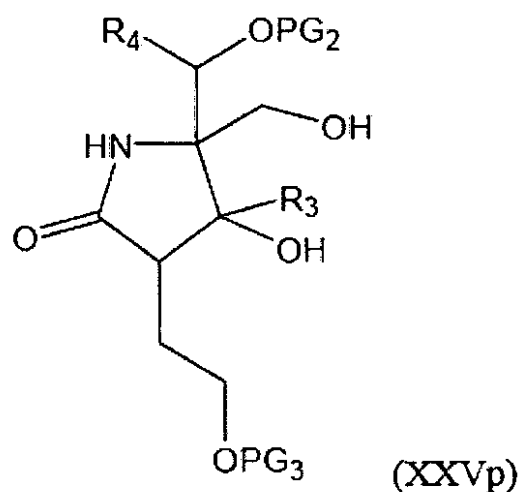
(j) proteger el grupo hidroxilo primario del compuesto de la fórmula (XXIII) para formar un compuesto de la fórmula (XXIV):



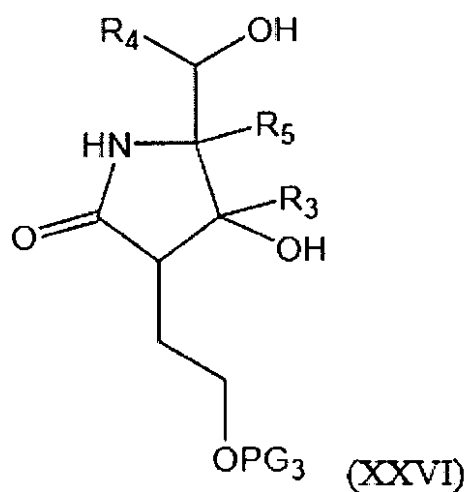
(k) romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (XXIV) para formar un compuesto de la fórmula (XXV):



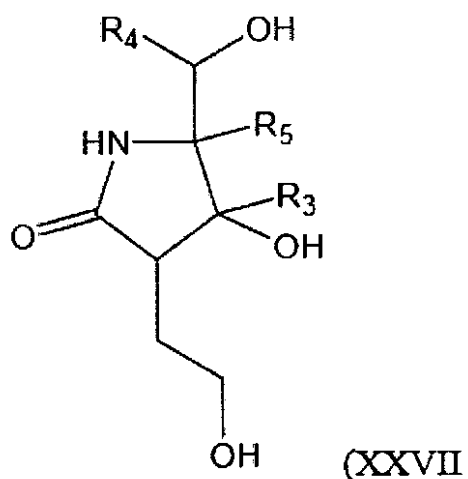
(l) proteger el alcohol secundario del compuesto de la fórmula (XXV) para formar un compuesto de la fórmula (XXVp):



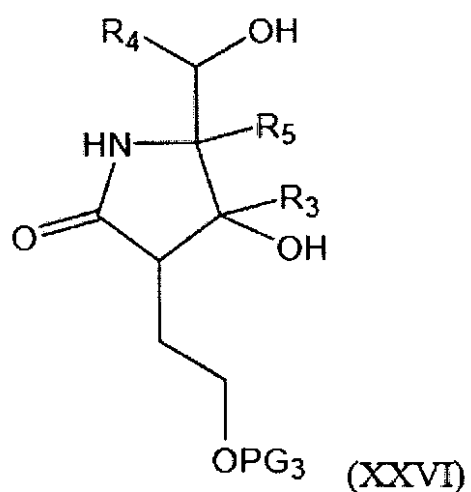
(m) convertir el grupo alcohol primario y retirar el residuo del grupo de protección PG₂ en el alcohol secundario del compuesto de la fórmula (XXVp) para formar un compuesto de la fórmula (XXVI):



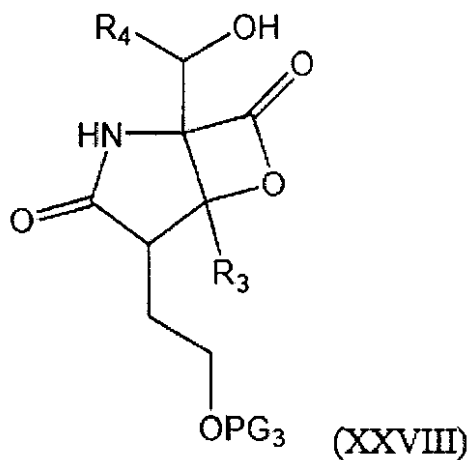
(n) retirar el residuo del grupo de protección PG₃ en el alcohol primario del compuesto de la fórmula (XXVI) para formar un compuesto de la fórmula (XXVII):



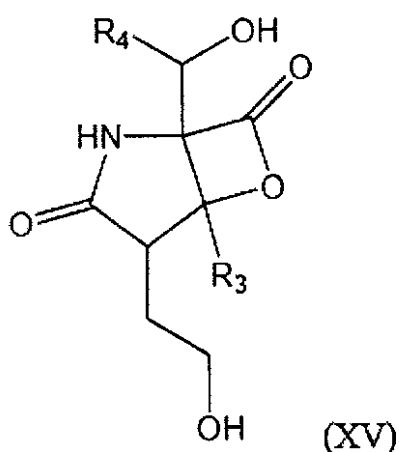
(o) proteger el alcohol primario del compuesto de la fórmula (XXVII) con el residuo del grupo de protección PG₃ para formar un compuesto de la fórmula (XXVI), en donde el PG₃ puede ser el mismo o diferente al PG₃ en la etapa (m):



(p) llevar a cabo una reacción de lactonización en el compuesto de la fórmula (XXVI) para formar un compuesto de la fórmula (XXVIII):



(q) retirar el residuo del grupo de protección PG₃ en el compuesto de la fórmula (XXVIII) para formar un compuesto de la fórmula (XV):



en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C₁₋₆, arilo y arilalquilo;

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alqueno C_{2-C₁₂}, alquino C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalqueno C_{3-C₁₂}, cicloalquino C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquilocarbonilo, carbonilalquilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de

guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilsulfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilsulforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

R_5 se selecciona del grupo que consiste de $-C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-24} , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, p-nitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

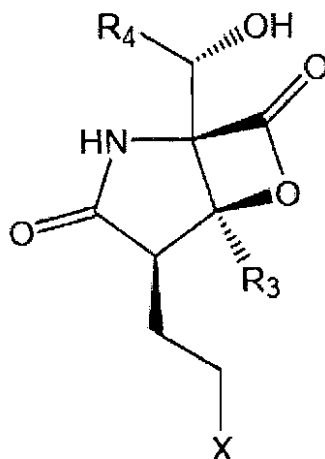
R_A y R_B se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} y alquino C_{2-6} , en donde R_A y R_B opcionalmente pueden enlazarse conjuntamente para formar un heterociclilo de 5, 6, 7 u 8 miembros opcionalmente sustituido;

Y es oxígeno o azufre;

Z es halógeno; y

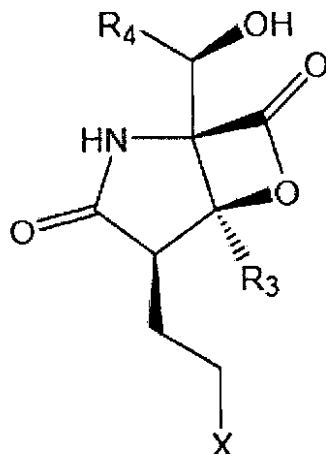
PG_1 y PG_3 son cada uno un residuo del grupo de protección.

2. El método de la Reivindicación 1, que comprende además sustituir el grupo hidroxilo primario del compuesto de la fórmula (XV) para formar un compuesto de la fórmula (XVI), en donde el compuesto de la fórmula (XVI) tiene la siguiente estructura:



en donde X es un halógeno.

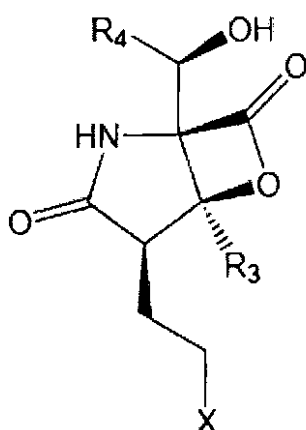
3. El método de la Reivindicación 1, que comprende además sustituir el grupo hidroxí primario del compuesto de la fórmula (XV) para formar un compuesto de la fórmula (XVI-B), en donde el compuesto de la fórmula (XVI-B) tiene la siguiente estructura:



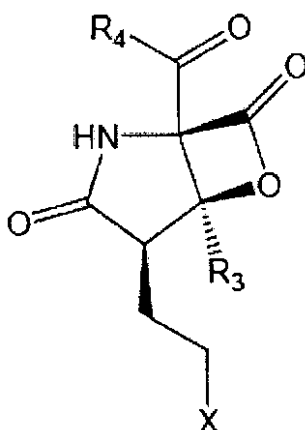
en donde X es un halógeno.

4. El método de la Reivindicación 3, que comprende además las etapas de:

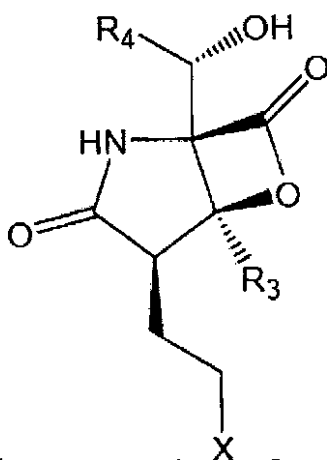
(1) oxidar el grupo hidroxí secundario del compuesto de la fórmula (XVI-B), en donde el compuesto de la fórmula (XVI-B) tiene la siguiente estructura:



para formar un compuesto de la fórmula (XXII):



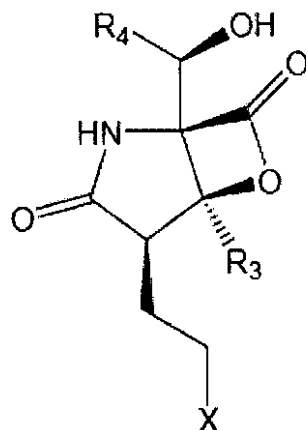
(2) reducir el grupo ceto del compuesto de la fórmula (XXII) para formar un compuesto de la fórmula (XVIA), en donde el compuesto de la fórmula (XVI-A) tiene la siguiente estructura:



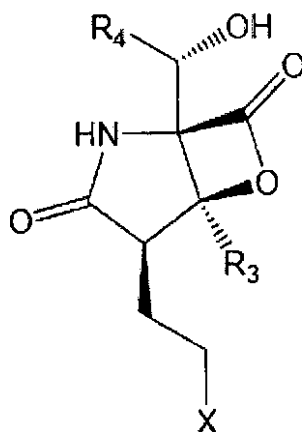
5. El método de la Reivindicación 3, que comprende además la etapa de:

(1) invertir la estereoquímica del centro de carbono del hidroxilo secundario del compuesto de la fórmula

(XVI-B), en donde el compuesto de la fórmula (XVI-B) tiene la siguiente estructura:



para formar un compuesto de la fórmula (XVI-A), en donde el compuesto de la fórmula (XVI-A) tiene la siguiente estructura:



6. El método de la Reivindicación 1, en donde PG₁ y PG₂ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste de bencilo, un bencilo sustituido, un alquilcarbonilo, un arilalquilcarbonilo, un metil éter sustituido, un etil éter sustituido, un bencil éter sustituido, un tetrahidropiranil éter, un silil éter, un éster y un carbonato.

7. El método de la Reivindicación 1, en donde el residuo organometálico se selecciona del grupo que consiste de un compuesto de organomagnesio, un compuesto de organolitio, un compuesto de organoestaño, un compuesto de organocupratos, un compuesto de organozinc, un compuesto de organoboro y un compuesto de organopaladio, un carbonilo metálico, un metaloceno, un complejo de carbina y un organometaloide.

8. El método de la Reivindicación 1, en donde:

el residuo organometálico se selecciona del grupo que consiste de R_4-MgR_7 , R_4-ZnR_7 , R_4-Li , $(R_4)_p-B(R_7)_{3-p}$, y $(R_4)_q-Sn(R_7)_{4-q}$;

R_7 se selecciona del grupo que consiste de halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo, alqueno, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, isopinocampéilo, hidroxilo, alcoxi y carbonilalcoxi, en donde, si se encuentra presente más de un R_7 , los grupos R_7 opcionalmente pueden enlazarse conjuntamente para formar un anillo de cicloalquilo, cicloalqueno, heteroalquilo o heteroalqueno opcionalmente sustituido;

p es un entero de 1 a 3; y

q es un entero de 1 a 4.

9. El método de la Reivindicación 1, en donde R_4 es 2-ciclohexenilo.

10. El método de la Reivindicación 1, en donde R_3 es metilo.

11. El método de la Reivindicación 1, en donde R_5 es $-C(=O)OR_6$; y R_6 es hidrógeno o alquilo C_1-C_{24} sustituido o no sustituido.

12. El método de la Reivindicación 1, en donde R_5 es $-C(=O)Z$; y Z es un halógeno.

13. Un método para formar un compuesto de la fórmula (X) a partir de un compuesto de la fórmula (V), que comprende las etapas de:

romper el enlace doble de carbono-carbono del compuesto de la fórmula (V) y ciclar el enlace doble roto con el grupo hidroxilo terciario;

transformar el $-COOR_2$ en un aldehído, en donde R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-C_6 , arilo y arilalquilo; y

agregar R_4 al aldehído utilizando un residuo organometálico que contiene al menos un R_4 , en donde R_4 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-C_{12} , alqueno C_2-C_{12} , alquino C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalqueno C_3-C_{12} , cicloalquino C_3-C_{12} , heterociclilo

C₃-C₁₂, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclí)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltiofosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltiofosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado.

14. Un método para formar un compuesto de la fórmula (XV) a partir de un compuesto de la fórmula (X), que comprende las etapas de:

romper un grupo amina;

retirar el PG₁ y abrir reductivamente el hemiacetal, en donde PG₁ es un residuo del grupo de protección; y

formar un anillo de lactona de cuatro miembros.

15. El método de la Reivindicación 14, en donde el rompimiento del grupo amina se efectúa antes de retirar el PG₁ y de abrir reductivamente el hemiacetal, y antes de la formación del anillo de lactona de cuatro miembros.

16. El método de la Reivindicación 14, en donde el rompimiento del grupo amina se efectúa después de retirar el PG₁ y de abrir reductivamente el hemiacetal, pero antes de la formación del anillo de cuatro miembros.

17. Un método para formar un compuesto de la fórmula (XVII) a partir de un compuesto de la fórmula (V), que comprende las etapas de:

romper el enlace doble de carbono-carbono del compuesto de la fórmula (V) y ciclar el enlace doble roto con el grupo hidroxilo terciario; y

agregar R_4 después de la ciclación con el grupo hidroxilo terciario utilizando un residuo organometálico que contiene al menos un R_4 , en donde R_4 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-C_{12} , alqueno C_2-C_{12} , alquino C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalqueno C_3-C_{12} , cicloalquino C_3-C_{12} , heterociclilo C_3-C_{12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclílo)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado.

18. Un método para formar un compuesto de la fórmula (XXII) a partir de un compuesto de la fórmula (XVII), que comprende las etapas de:

romper un grupo amina;

retirar el PG_1 y abrir reductivamente el hemiacetal, en donde PG_1 es un residuo del grupo de protección;

formar un anillo de cuatro miembros mediante una reacción de lactonización; y

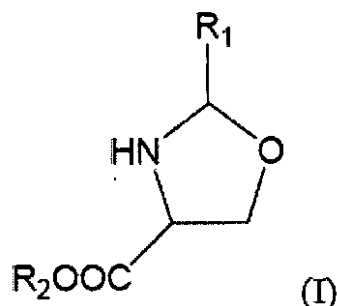
retirar todo grupo de protección en una cetona.

19. El método de la Reivindicación 18, en donde el rompimiento del grupo aminor se efectúa antes de retirar el PG₁ y de abrir reductivamente el hemiacetal, y antes de la formación del anillo de cuatro miembros mediante una reacción de lactonización.

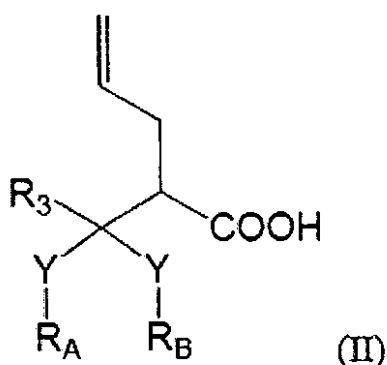
20. El método de la Reivindicación 18, en donde el rompimiento del grupo aminor se efectúa después de retirar el PG₁ y de abrir reductivamente el hemiacetal, pero antes de la formación del anillo de cuatro miembros mediante una reacción de lactonización.

21. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (III), que comprende las etapas de:

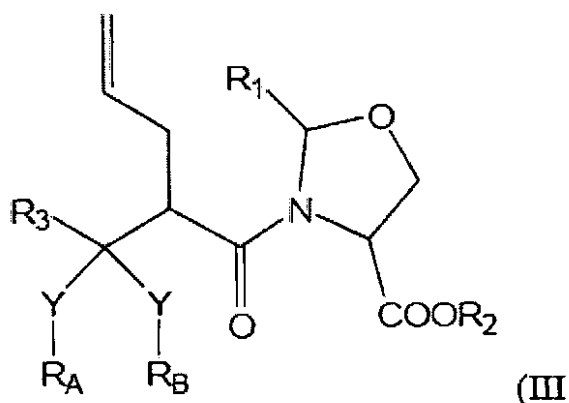
hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (I):



con un compuesto de la fórmula (II):



para formar un compuesto de la fórmula (III):



en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

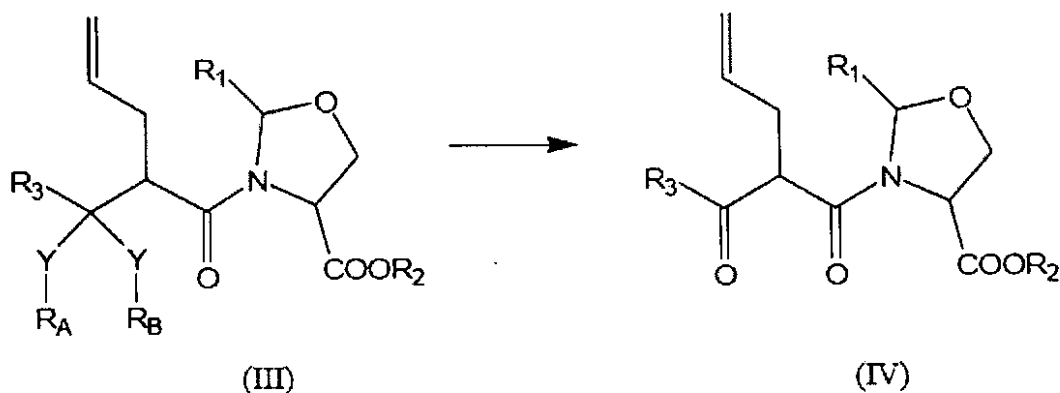
R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo:

Y es oxígeno o azufre; y

R_A y R_B se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} y alquinilo C_{2-6} , en donde R_A y R_B opcionalmente pueden enlazarse conjuntamente para formar un heterociclilo de 5, 6, 7 u 8 miembros opcionalmente sustituido.

22. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (IV), que comprende desproteger el compuesto de la fórmula (III) para formar un compuesto de la fórmula (IV):



en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo;

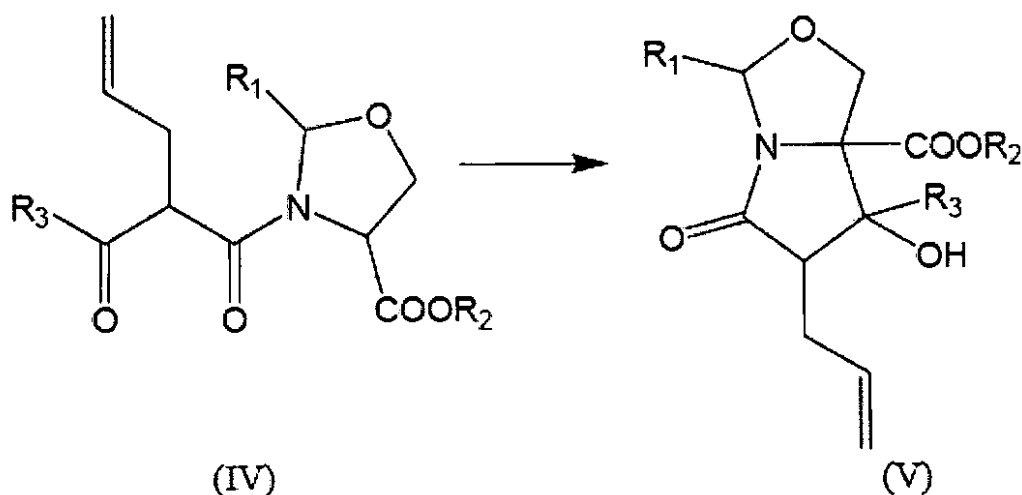
R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

Y es oxígeno o azufre; y

R_A y R_B se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆ y alquino C₂₋₆, en donde R_A y R_B opcionalmente pueden enlazarse conjuntamente para formar un heterociclilo de 5, 6, 7 u 8 miembros opcionalmente sustituido.

23. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (V), que comprende llevar a cabo una reacción de aldol intramolecular en el compuesto de la fórmula (IV) para formar un compuesto de la fórmula (V):



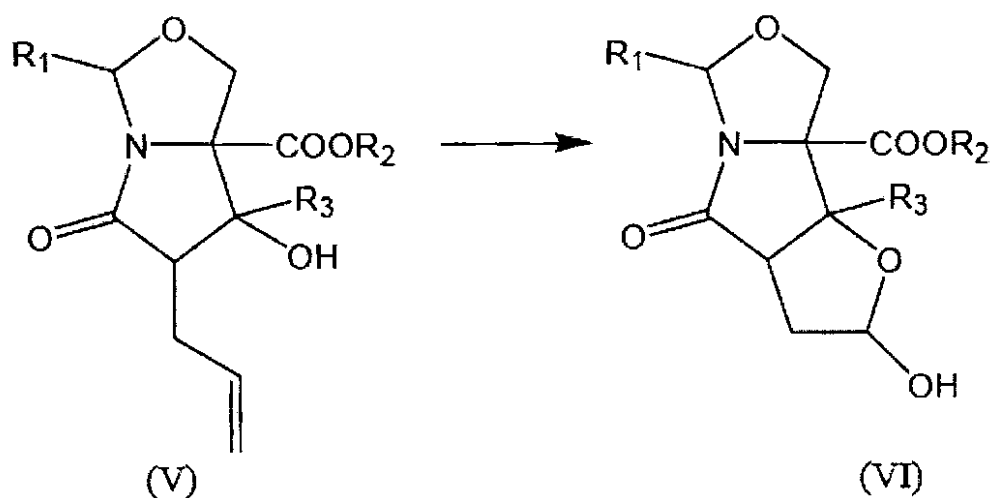
en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C₁₋₆, arilo y arilalquilo; y

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo.

24. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VI), que comprende romper el enlace doble del compuesto de la fórmula (V) y ciclar el enlace doble roto con el grupo hidroxilo terciario para formar un compuesto de la fórmula (VI):



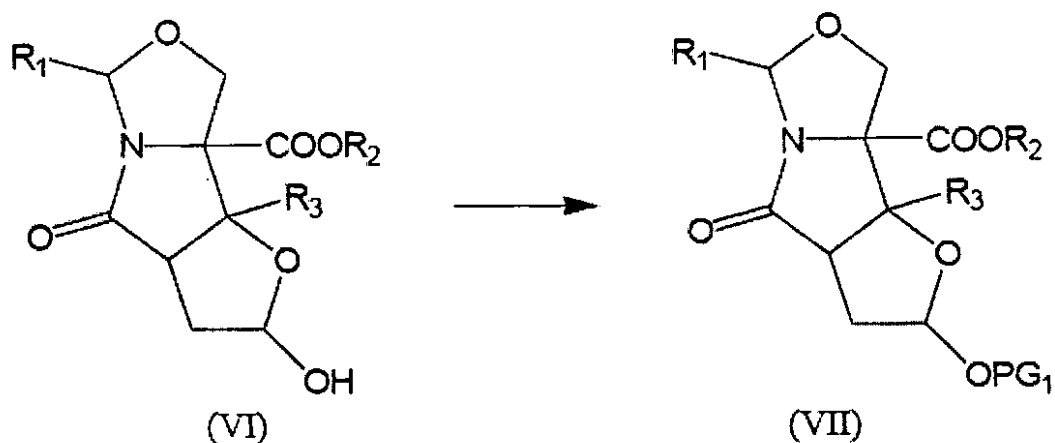
en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo; y

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo.

25. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VII) que comprende proteger el sustituyente hidroxilo enlazado al anillo heterocíclico que contiene oxígeno del compuesto de la fórmula (VI) para formar un compuesto de la fórmula (VII):



en donde:

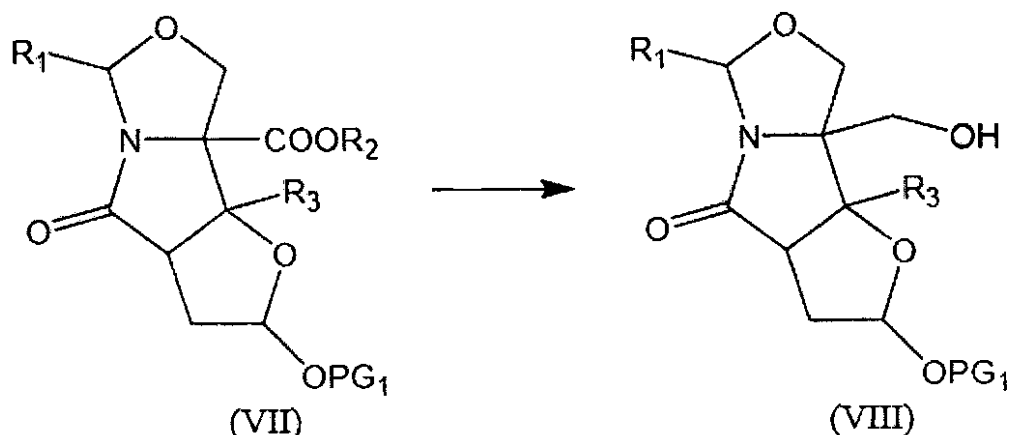
R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo; y

PG_1 es un residuo del grupo de protección.

26. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (VIII), que comprende reducir el grupo $COOR_2$ del compuesto de la fórmula (VII) a un alcohol para formar un compuesto de la fórmula (VIII):



en donde:

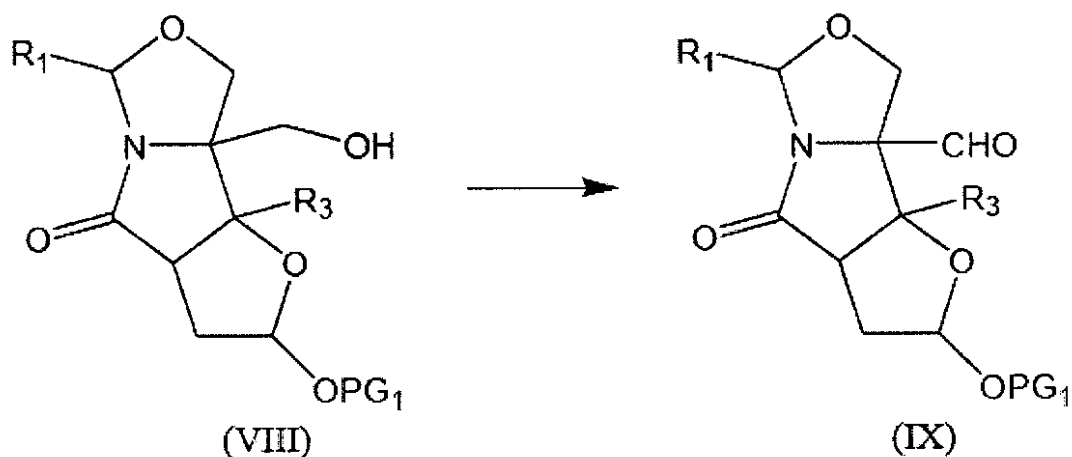
R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo; y

PG_1 es un residuo del grupo de protección.

27. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (IX), que comprende oxidar el grupo alcohol del compuesto de la fórmula (VIII) a un aldehído para formar un compuesto de la fórmula (IX):



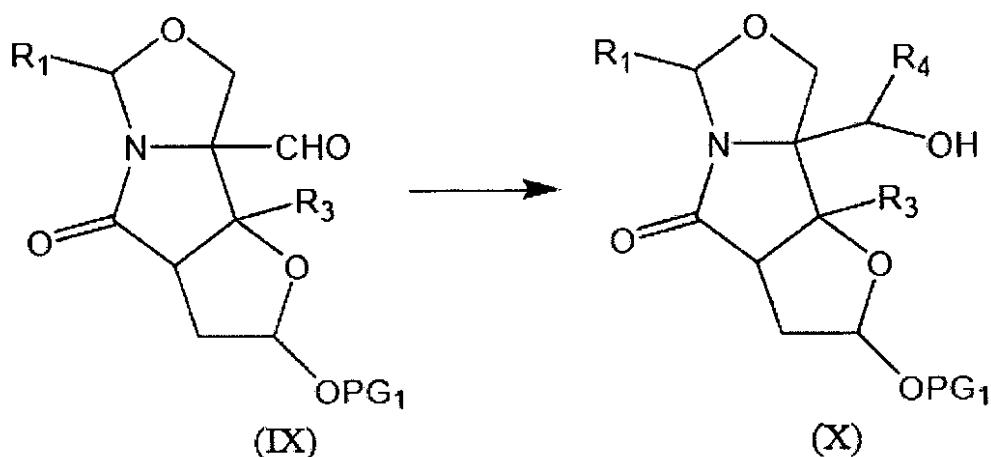
en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de Variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo; y

PG_1 es un residuo del grupo de protección.

28. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (X), que comprende agregar R_4 al compuesto de la fórmula (IX) al hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (IX) con un residuo organometálico que contiene al menos un R_4 para formar un compuesto de la fórmula (X):



en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

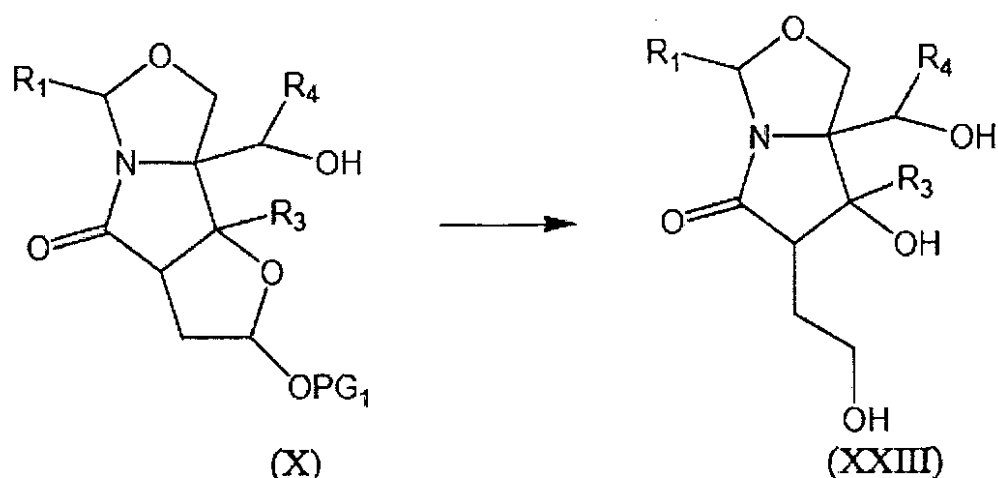
alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C_{1-C₁₂}, alquenilo C_{2-C₁₂}, alquinilo C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalquenilo C_{3-C₁₂}, cicloalquinilo C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarboniloxi, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

29. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXIII) que comprende retirar el residuo del grupo de protección de la fórmula (X) y abrir reductivamente el hemiacetal para formar un compuesto de la fórmula (XXIII):



en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

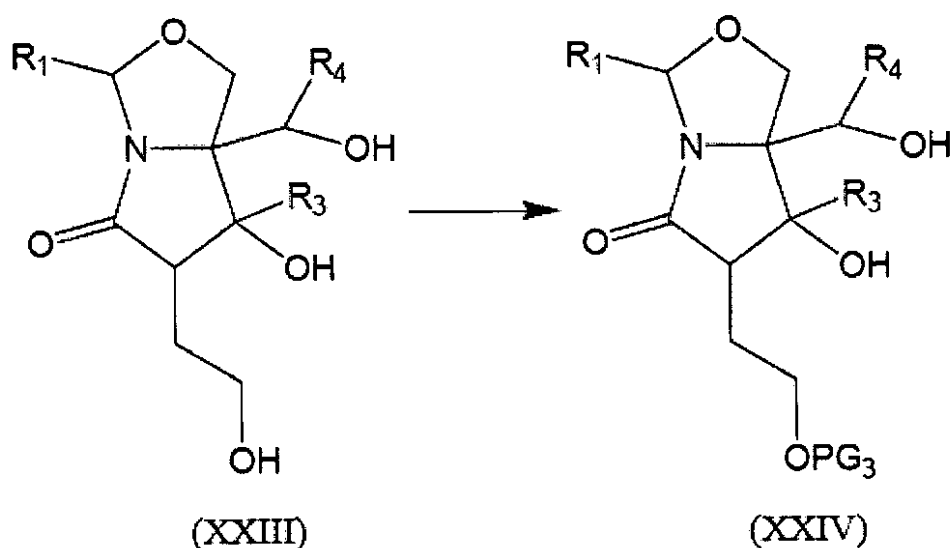
R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , arilo y arilalquilo;

R_4 puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo $C_{1-C_{12}}$, alqueno $C_{2-C_{12}}$, alquino $C_{2-C_{12}}$, cicloalquilo $C_{3-C_{12}}$, cicloalqueno $C_{3-C_{12}}$, cicloalquino $C_{3-C_{12}}$, heterociclilo $C_{3-C_{12}}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo,

(alquiltosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

30. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXIV) que comprende proteger el grupo hidroxilo primario del compuesto de la fórmula (XXIII) para formar un compuesto de la fórmula (XXIV):



en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

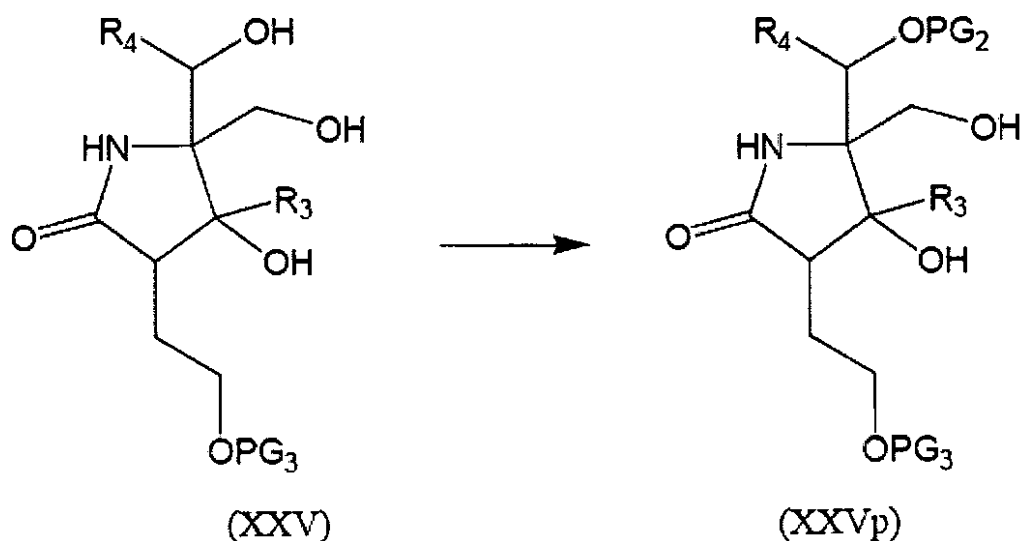
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₁₂, alqueno C₂₋₁₂, alquino C₂₋₁₂, cicloalquilo C₃₋₁₂, cicloalqueno C₃₋₁₂, cicloalquino C₃₋₁₂, heterociclilo C₃₋₁₂, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo,

alquilo C_1-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , alquinilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalquenilo C_3-C_{12} , cicloalquinilo C_3-C_{12} , heterociclilo C_3-C_{12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₃ es un residuo del grupo de protección.

32. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVp), que comprende proteger el alcohol secundario del compuesto de la fórmula (XXV) para formar un compuesto de la fórmula (XXVp):



en donde:

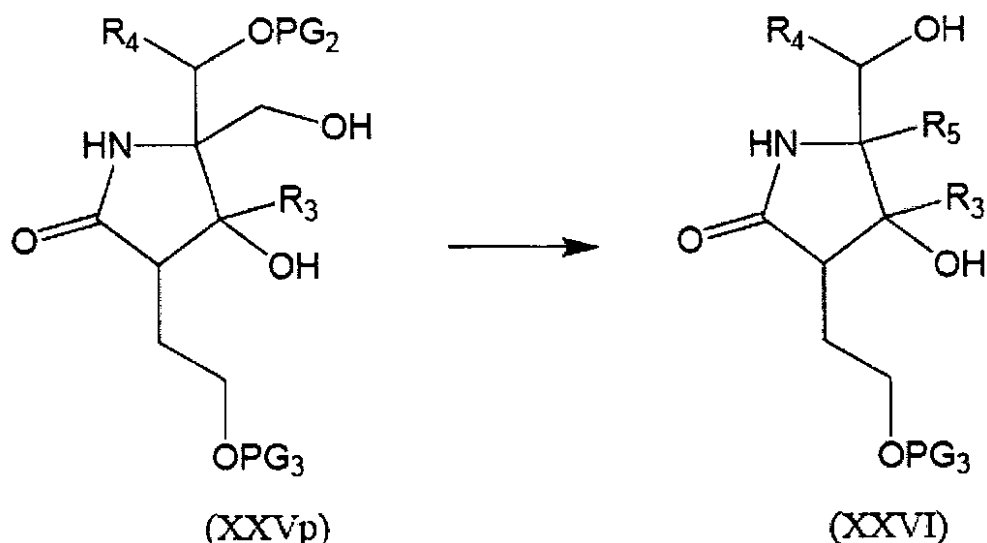
R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo;

R_4 puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , alquinilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalquenilo C_3-C_{12} , cicloalquinilo C_3-C_{12} , heterociclilo C_3-C_{12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterocicli)alquilo, acilo, acilalquilo, alquilocarbonilo, carbonilalquilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltiofosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un

fosforilalquilo, (alquilmfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₂ y PG₃ son residuos del grupo de protección.

33. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVI), que comprende convertir el grupo alcohol primario y retirar el residuo del grupo de protección PG₂ en el alcohol secundario del compuesto de la fórmula (XXVp) para formar un compuesto de la fórmula (XXVI):



en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C12}, alquenilo C_{2-C12}, alquinilo C_{2-C12}, cicloalquilo C_{3-C12}, cicloalquenilo C_{3-C12}, cicloalquinilo C_{3-C12}, heterociclilo C_{3-C12}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarboniloxi, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo,

fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

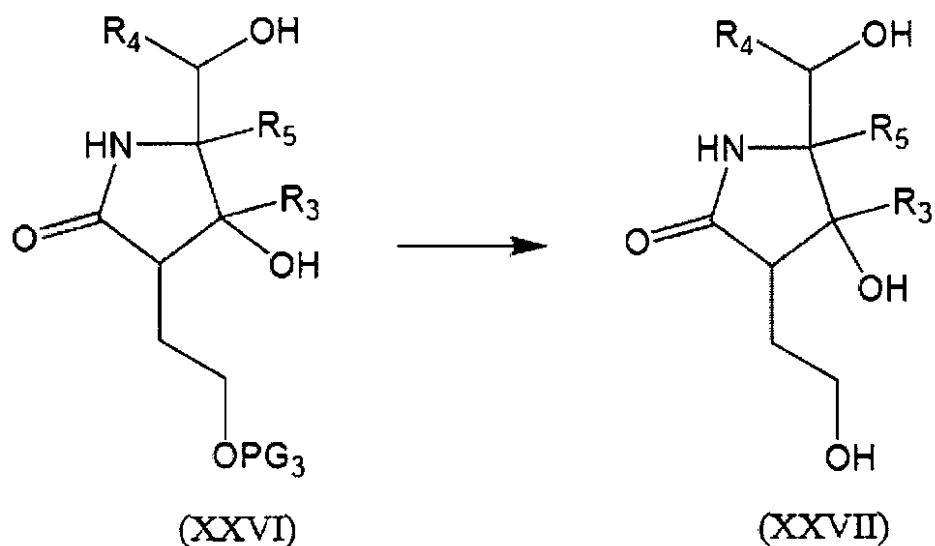
R_5 se selecciona del grupo que consiste de - $C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-24} , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, pnitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

Z puede ser un halógeno; y

PG_2 y PG_3 son residuos del grupo de protección.

34. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVII), que comprende retirar el residuo del grupo de protección PG_3 en el alcohol primario del compuesto de la fórmula (XXVI) para formar un compuesto de la fórmula (XXVII):



en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:
 alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆,
 cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:
 alquilo C_{1-C12}, alqueno C_{2-C12}, alquino C_{2-C12},
 cicloalquilo C_{3-C12}, cicloalqueno C_{3-C12}, cicloalquino C_{3-C12},
 heterociclilo C_{3-C12}, arilo, heteroarilo,
 arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo,
 (heterociclicil)alquilo, acilo, acilalquilo,
 alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido,
 azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo,
 carboxialquilo, sal de un carboxialquilo,
 alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo,
 dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo,
 fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano,
 alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo,
 alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo
 borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de
 guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo,
 alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un
 sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo,
 fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo,
 (alquilsulfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un

fosforilalquilo, (alquilmfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

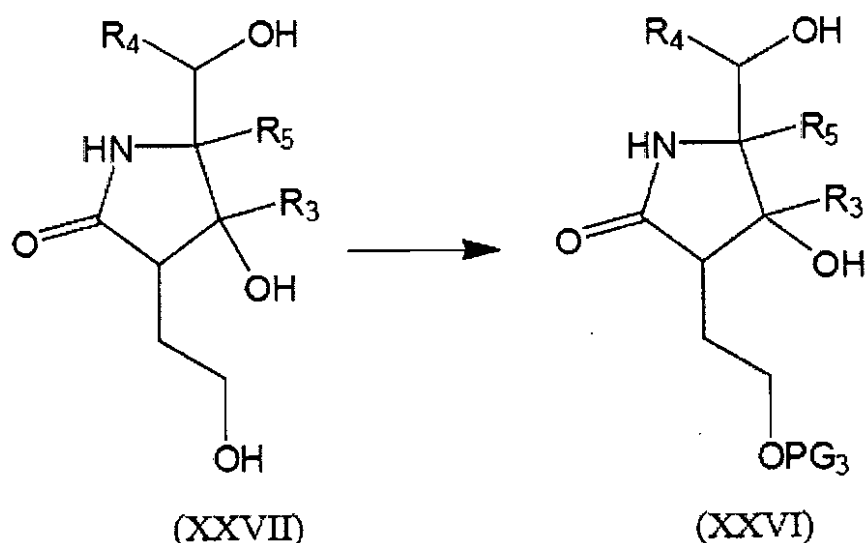
R_5 se selecciona del grupo que consiste de $-C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-24} , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, pnitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

Z puede ser un halógeno; y

PG_3 es un residuo del grupo de protección.

35. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVI), que comprende proteger el alcohol primario del compuesto de la fórmula (XXVII) con el residuo del grupo de protección PG_3 para formar un compuesto de la fórmula (XXVI), en donde el PG_3 puede ser el mismo o diferente del PG_3 en la Reivindicación 30:



en donde:

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , arilo y arilalquilo;

R_4 puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C_1-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , alquinilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalquenilo C_3-C_{12} , cicloalquinilo C_3-C_{12} , heterociclilo C_3-C_{12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarboniloxi, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

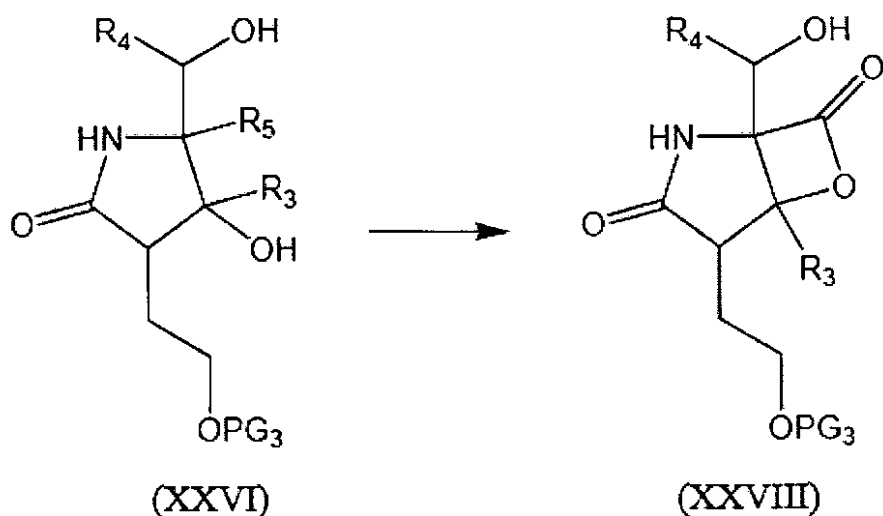
R_5 se selecciona del grupo que consiste de $-C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-24 , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, pnitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

Z puede ser un halógeno; y

PG_3 es un residuo del grupo de protección.

36. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVIII), que comprende llevar a cabo una reacción de lactonización en el compuesto de la fórmula (XXVI) para formar un compuesto de la fórmula (XXVIII):



en donde:

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , arilo y arilalquilo;

R_4 puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-12} , alqueno C_{2-12} , alquino C_{2-12} , cicloalquilo C_{3-12} , cicloalqueno C_{3-12} , cicloalquino C_{3-12} , heterociclilo C_{3-12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloalcoxycarbonilo, carbonilalquilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltiofosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltiofosforil)alquilo, piridinilalquilo,

sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

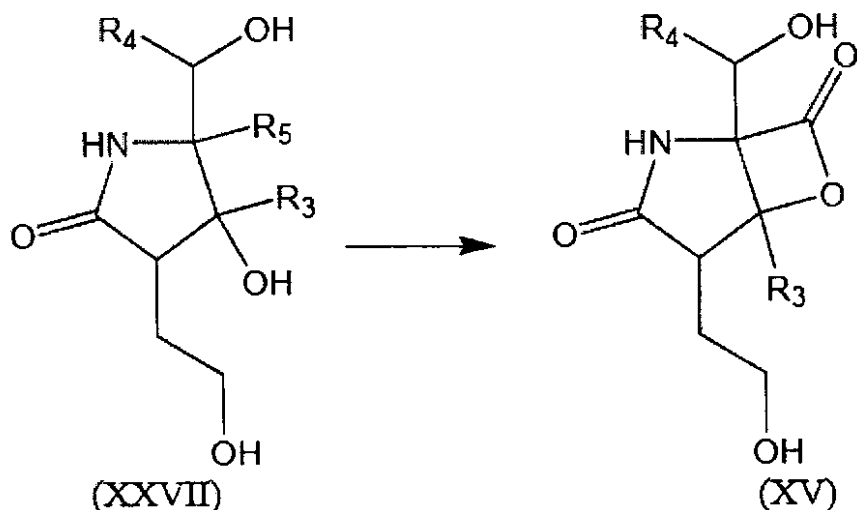
R_5 se selecciona del grupo que consiste de $-C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-24} , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, pnitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

Z puede ser un halógeno; y

PG_3 es un residuo del grupo de protección.

37. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XV) que comprende llevar a cabo una reacción de lactonización en el compuesto de la fórmula (XXVII) para formar un compuesto de la fórmula (XV):



en donde:

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo;

R_4 puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo $C_{1-C_{12}}$, alquenilo $C_{2-C_{12}}$, alquinilo $C_{2-C_{12}}$, cicloalquilo $C_{3-C_{12}}$, cicloalquenilo $C_{3-C_{12}}$, cicloalquinilo $C_{3-C_{12}}$, heterociclilo $C_{3-C_{12}}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo,

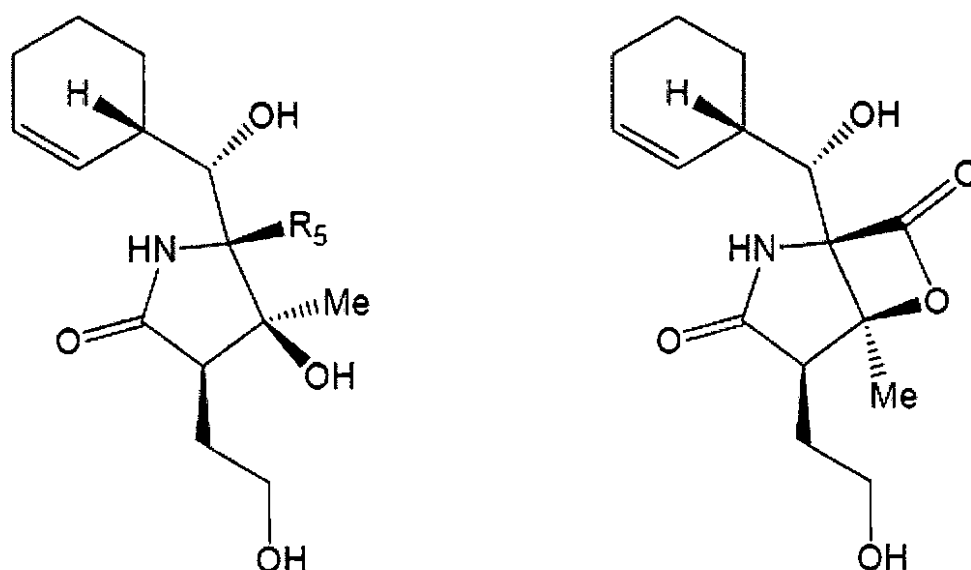
(heterociclí)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilsulfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilsulforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

R_5 se selecciona del grupo que consiste de $-C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-24} , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, p-nitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

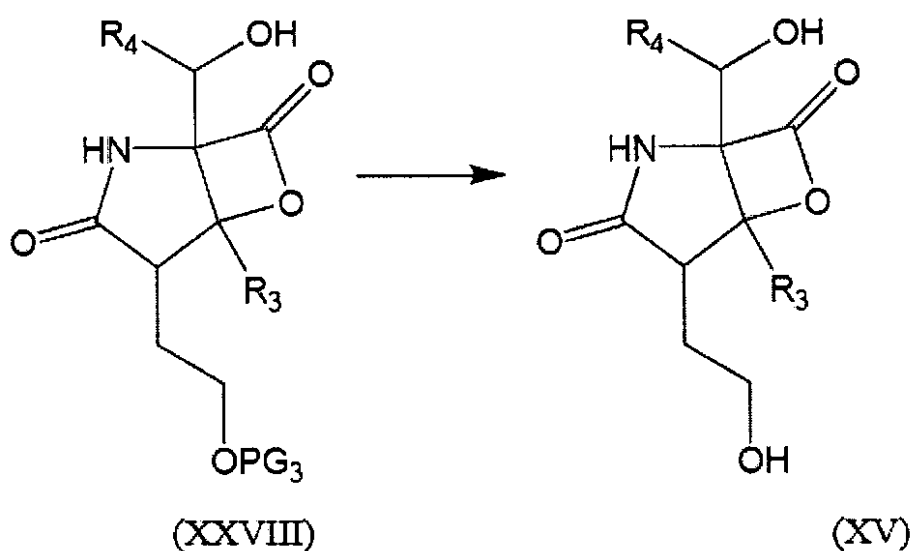
Z puede ser un halógeno; y

con la salvedad de que el compuesto de la fórmula (XXVII) y el compuesto de la fórmula (XV) no pueden tener las siguientes estructuras y estereoquímica:



en donde R_5 es $-C(=O)OR_6$; y R_6 es hidrógeno, metilo o t-butilo.

38. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XV) que comprende retirar el residuo del grupo de protección PG_3 en el compuesto de la fórmula (XXVIII) para formar un compuesto de la fórmula (XV):



en donde:

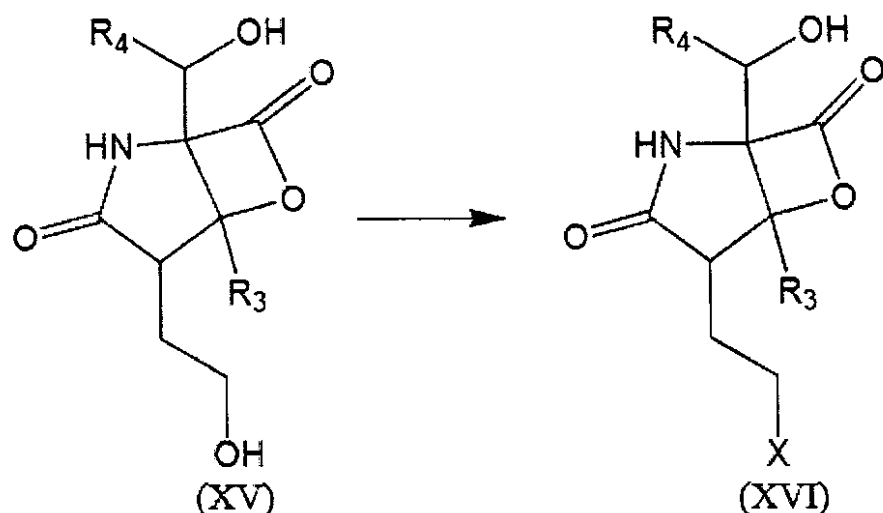
R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , arilo y arilalquilo;

R_4 puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C_1-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , alquinilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalquenilo C_3-C_{12} , cicloalquinilo C_3-C_{12} , heterociclilo C_3-C_{12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarboniloxi, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₃ es un residuo del grupo de protección.

39. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XVI), que comprende sustituir el grupo hidroxil primario del compuesto de la fórmula (XV) para formar un compuesto de la fórmula (XVI):

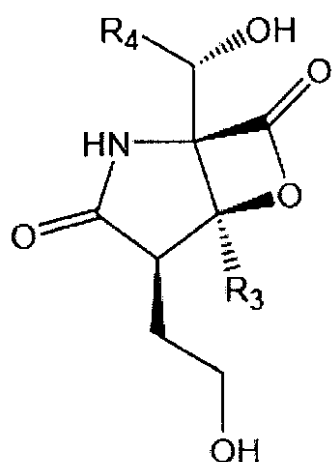


en donde:

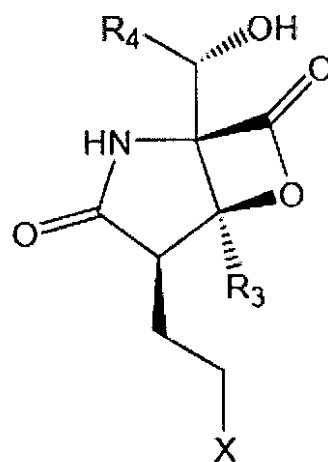
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alquenilo C_{2-C₁₂}, alquinilo C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalquenilo C_{3-C₁₂}, cicloalquinilo C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

con la salvedad de que el compuesto de la fórmula (XV) y el compuesto de la fórmula (XVI) no puede tener las siguientes estructuras y estereoquímica:



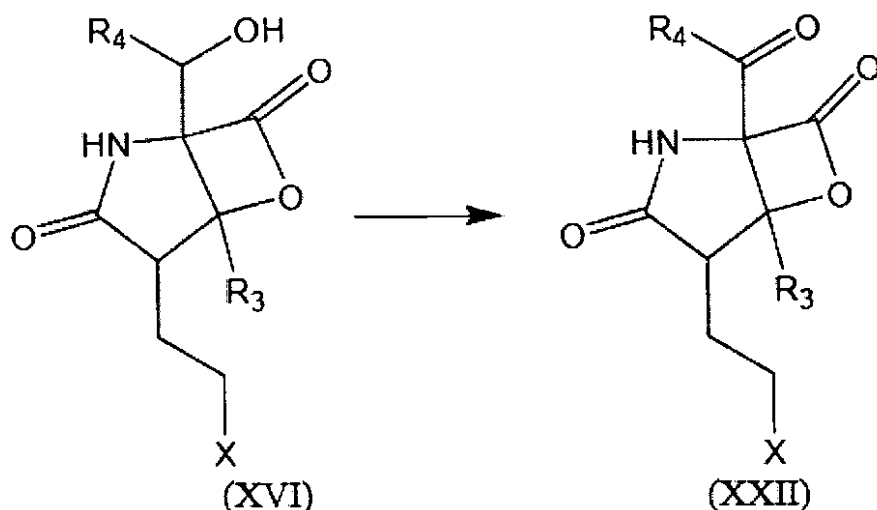
(XV)



(XVI)

en donde R₃ es metilo; R₄ es 2-ciclohexenilo; y X es cloro.

40. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XXII), que comprende oxidar el grupo alcohol enlazado al carbono C-5 adyacente al R₄ de un compuesto de la fórmula (XVI) a una cetona para formar un compuesto de la fórmula (XXII):



en donde:

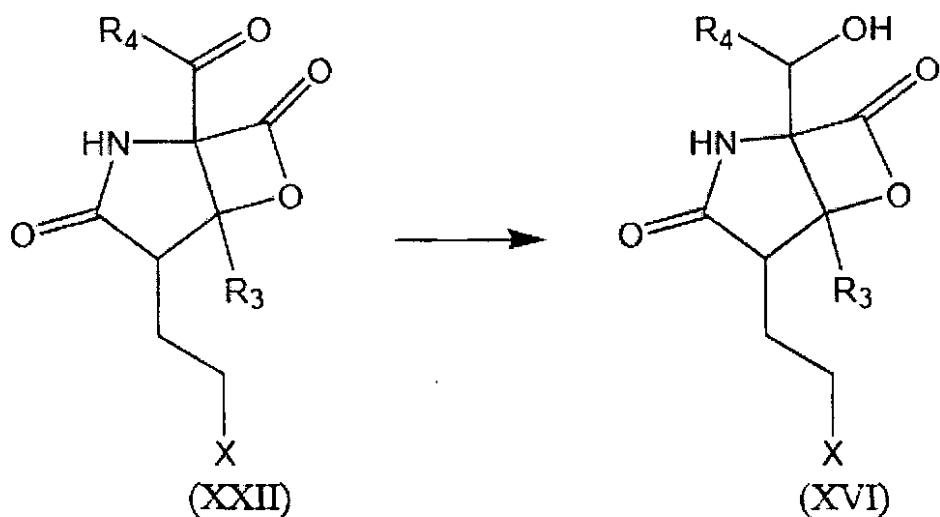
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₁₂, alqueno C₂₋₁₂, alquino C₂₋₁₂, cicloalquilo C₃₋₁₂, cicloalqueno C₃₋₁₂, cicloalquino

C₃-C₁₂, heterociclilo C₃-C₁₂, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilsulfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilsulforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

X es un halógeno.

41. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XVI) que comprende reducir la cetona enlazada al carbono adyacente al R₄ de un compuesto de la fórmula (XXII) a un alcohol para formar un compuesto heterocíclico de la fórmula (XVI):



en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alquenilo C_{2-C₁₂}, alquinilo C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalquenilo C_{3-C₁₂}, cicloalquinilo C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterocicli)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

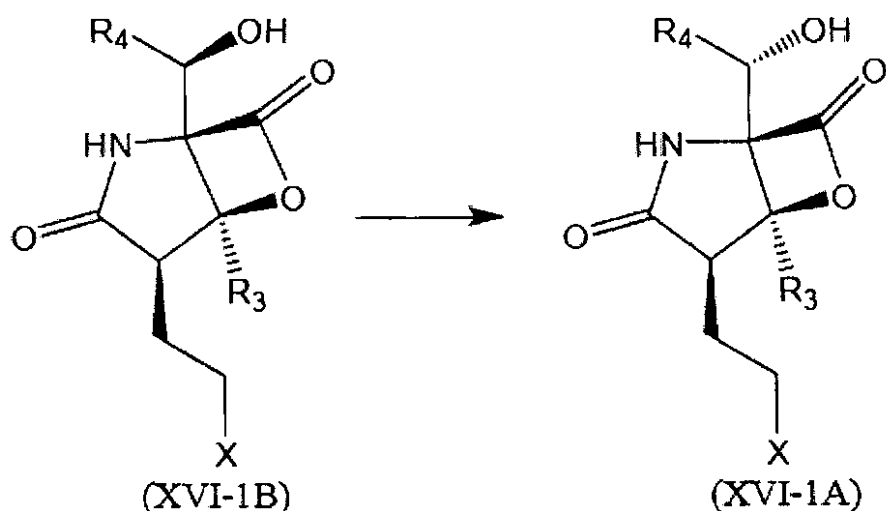
X es un halógeno.

42. El método de la Reivindicación 41, en donde la reducción comprende utilizar una enzima o NaBH₄ como un agente de reducción.

43. El método de la Reivindicación 42, en donde la enzima se selecciona del grupo que consiste de KRED-EXPB1Y y KRED-EXP-C1A.

44. Un método para preparar un compuesto de la fórmula (XVI-A), que comprende invertir la estereoquímica

del grupo hidroxilo secundario del compuesto de la fórmula (XVI-B) para formar un compuesto heterocíclico de la fórmula (XVI-A):



en donde:

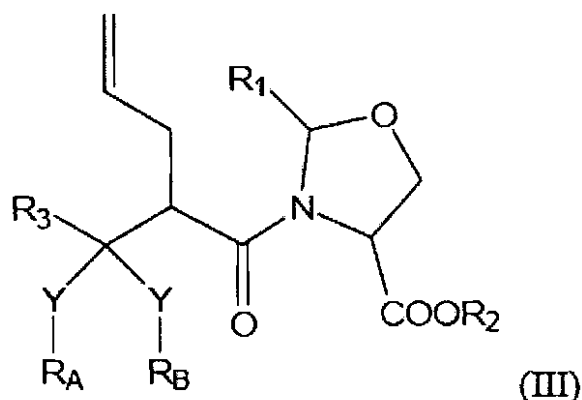
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:
alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo;

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:
alquilo C_{1-C12}, alqueno C_{2-C12}, alquino C_{2-C12}, cicloalquilo C_{3-C12}, cicloalqueno C_{3-C12}, cicloalquino C_{3-C12}, heterociclilo C_{3-C12}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterocicli)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo,

fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

X es un halógeno.

45. Un compuesto de la fórmula (III):



en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

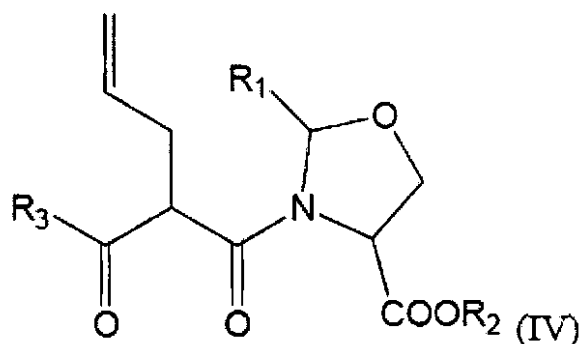
R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C₁₋₆, arilo y arilalquilo;

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

Y es oxígeno o azufre; y

R_A y R_B se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆ y alquinilo C₂₋₆, en donde R_A y R_B opcionalmente pueden enlazarse conjuntamente para formar un heterociclilo de 5, 6, 7 u 8 miembros opcionalmente sustituido.

46. Un compuesto de la fórmula (IV):



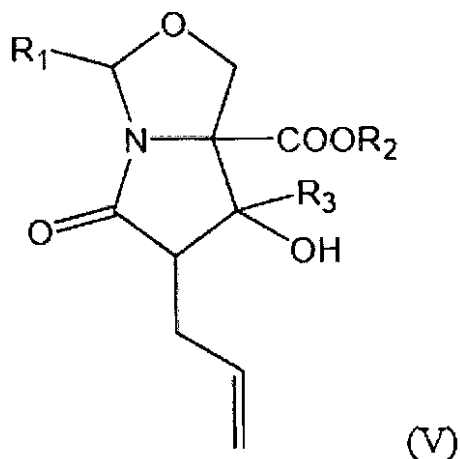
en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo; y

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , arilo y arilalquilo.

47. Un compuesto de la fórmula (V):



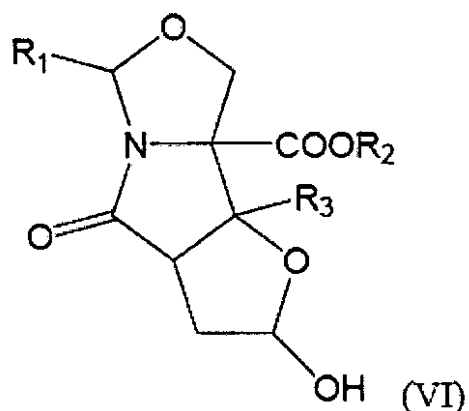
en donde:

R_1 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} sustituido o no sustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C_{1-6} , arilo y arilalquilo; y

R_3 se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alqueno C_{2-6} , cicloalqueno C_{3-6} , arilo y arilalquilo.

48. Un compuesto de la fórmula (VI):



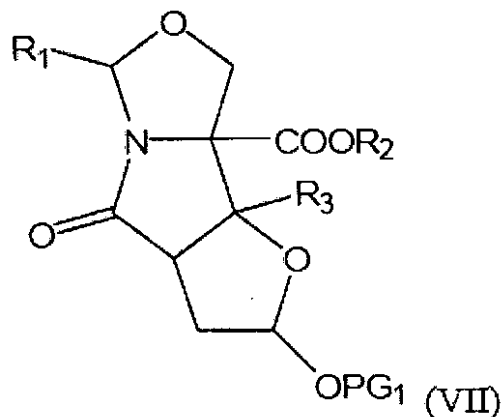
en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C₁₋₆, arilo y arilalquilo; y

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo.

49. Un compuesto de la fórmula (VII):



en donde:

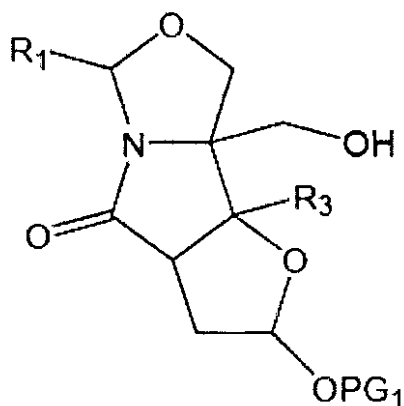
R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes, alquilo C₁₋₆, arilo y arilalquilo;

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

50. Un compuesto de la fórmula (VIII):



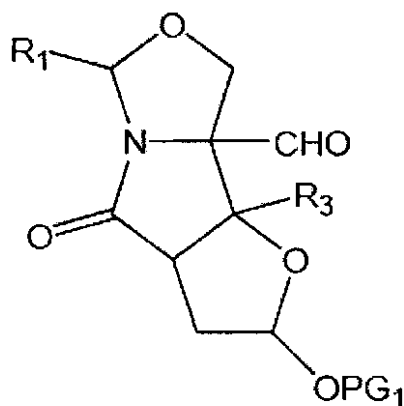
en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

51. Un compuesto de la fórmula (IX):



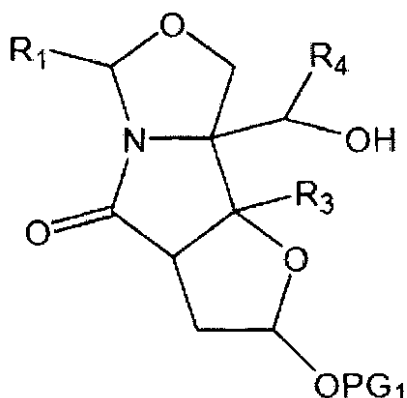
en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

52. Un compuesto de la fórmula (X):



en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

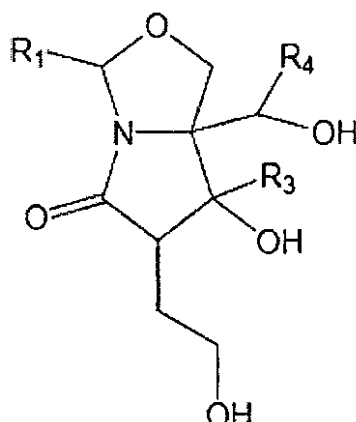
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alquenilo C_{2-C₁₂}, alquinilo C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalquenilo C_{3-C₁₂}, cicloalquinilo C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltiofosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltiofosforil)alquilo, piridinilalquilo,

sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

53. Un compuesto de la fórmula (XXIII):



en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

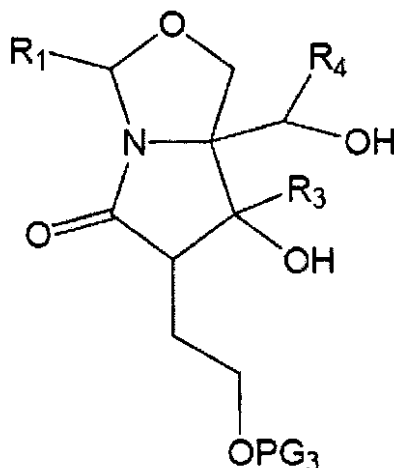
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₁₂, alqueno C₂₋₁₂, alquino C₂₋₁₂, cicloalquilo C₃₋₁₂, cicloalqueno C₃₋₁₂, cicloalquino C₃₋₁₂, heterociclilo C₃₋₁₂, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un

sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilsulfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilsulforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₁ es un residuo del grupo de protección.

54. Un compuesto de la fórmula (XXIV):



en donde:

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ sustituido o no sustituido;

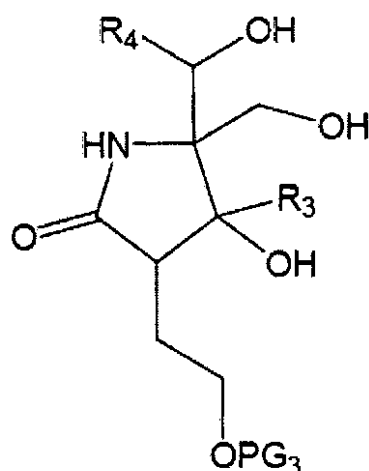
R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alqueno C_{2-C₁₂}, alquino C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalqueno C_{3-C₁₂}, cicloalquino C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano,

alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo,
 alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo
 borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de
 guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo,
 alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un
 sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo,
 fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo,
 (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un
 fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo,
 sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y
 alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₃ es un residuo del grupo de protección.

55. Un compuesto de la fórmula (XXV):



en donde:

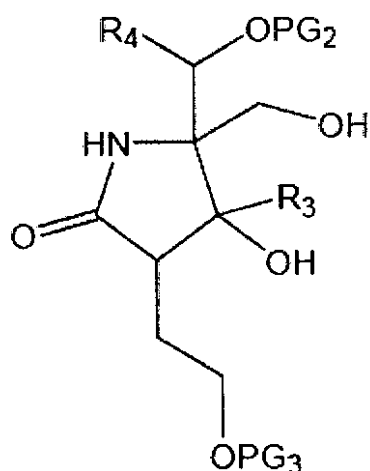
R₃ se selecciona del grupo que consiste de
 variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:
 alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆,
 cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de
 variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:
 alquilo C_{1-C₁₂}, alqueno C_{2-C₁₂}, alquinilo C_{2-C₁₂},
 cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalqueno C_{3-C₁₂}, cicloalquinilo
 C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo,
 arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo,
 (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo,
 alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido,
 azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo,
 carboxialquilo, sal de un carboxialquilo,

alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltiofosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltiofosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₃ es un residuo del grupo de protección.

56. Un compuesto de la fórmula (XXVp):



en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

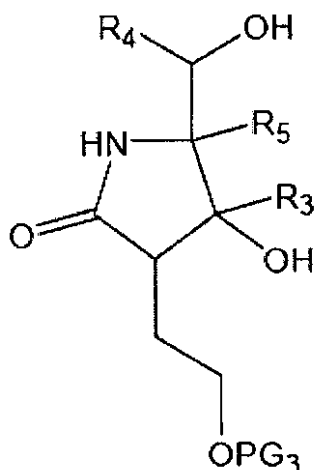
R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C_{1-C12}, alqueno C_{2-C12}, alquino C_{2-C12}, cicloalquilo C_{3-C12}, cicloalqueno C_{3-C12}, cicloalquino C_{3-C12}, heterociclilo C_{3-C12}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo,

(heterociclí)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquiltiofosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquiltiofosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

PG₂ y PG₃ son residuos del grupo de protección.

57. Un compuesto de la fórmula (XXVI):



en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes:

alquilo C_1-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , alquinilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalquenilo C_3-C_{12} , cicloalquinilo C_3-C_{12} , heterociclilo C_3-C_{12} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

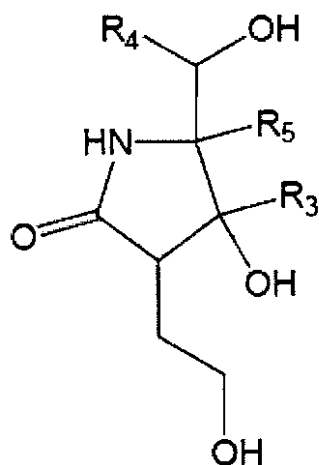
R_5 se selecciona del grupo que consiste de $-C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-C_{24} , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, p-nitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

Z puede ser un halógeno; y

PG_3 es un residuo del grupo de protección.

58. Un compuesto de la fórmula (XXVII):



en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alqueno C_{2-C₁₂}, alquino C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalqueno C_{3-C₁₂}, cicloalquino C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilsulfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilsulforil)alquilo, piridinilalquilo,

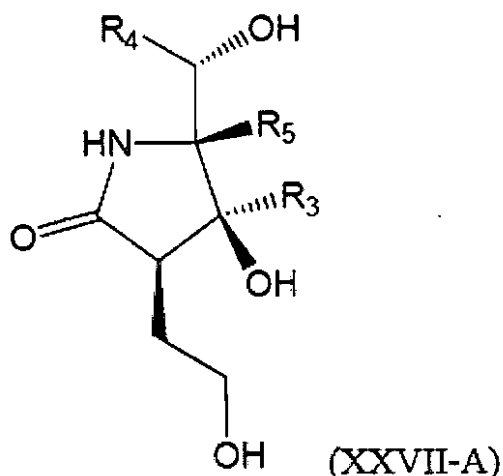
sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

R_5 se selecciona del grupo que consiste de -
 $C(=O)OR_6$, $-C(=O)SR_6$, $-C(=O)NR_6R_6$ y $-C(=O)Z$;

cada R_6 puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno o variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_1-24 , acilo, alquilacilo, arilacilo, arilo, arilalquilo, pnitrofenilo, pentafluorofenilo, pentafluoroetilo, trifluoroetilo, tricloroetilo y heteroarilo;

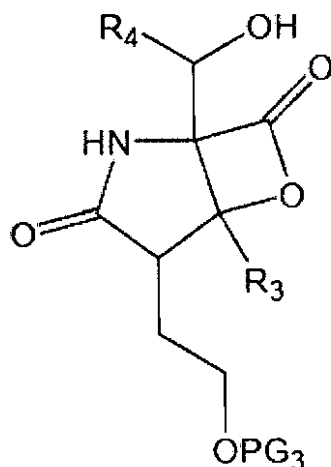
Z puede ser un halógeno; y

con la salvedad de que el compuesto de la fórmula (XXVII) no puede tener la estructura y estereoquímica de un compuesto de la fórmula (XXVII-A):



en donde R_3 es metilo; R_4 es 2-ciclohexenilo, R_5 es $-C(=O)OR_6$ y R_6 es hidrógeno, metilo o t-butilo.

59. Un compuesto de la fórmula (XXVIII):



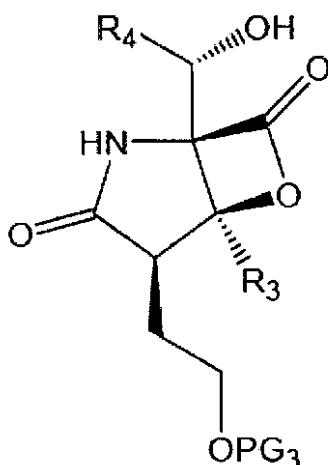
en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C₁₂}, alqueno C_{2-C₁₂}, alquino C_{2-C₁₂}, cicloalquilo C_{3-C₁₂}, cicloalqueno C_{3-C₁₂}, cicloalquino C_{3-C₁₂}, heterociclilo C_{3-C₁₂}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterociclil)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido, azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfoxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado;

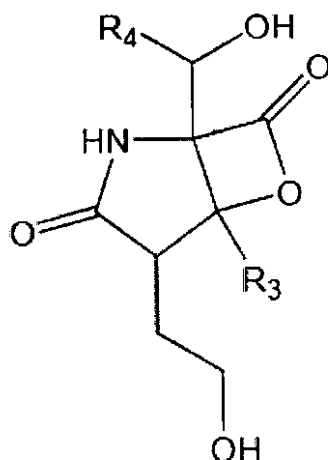
PG₃ es un residuo del grupo de protección; y

con la salvedad de que el compuesto de la fórmula (XXVIII) no puede tener la estructura y estereoquímica de un compuesto de la fórmula (XXVIII-A):



en donde R₃ es metilo; R₄ es 2-ciclohexenilo; y PG₃ es -C(=O)CH₂CH₃ o mesilato.

60. Un compuesto de la fórmula (XV):



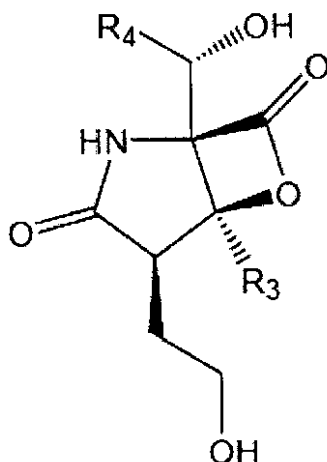
en donde:

R₃ se selecciona del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alqueno C₂₋₆, cicloalqueno C₃₋₆, arilo y arilalquilo:

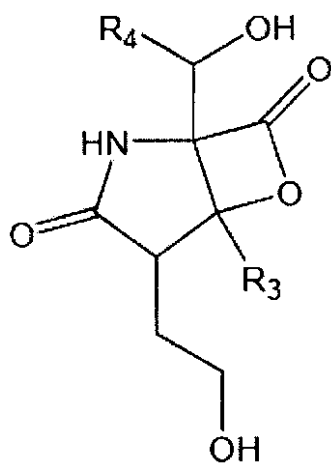
R₄ puede seleccionarse del grupo que consiste de variantes sustituidas o no sustituidas de los siguientes: alquilo C_{1-C12}, alqueno C_{2-C12}, alquino C_{2-C12}, cicloalquilo C_{3-C12}, cicloalqueno C_{3-C12}, cicloalquino C_{3-C12}, heterociclilo C_{3-C12}, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, (cicloalquil)alquilo, (heterocicli)alquilo, acilo, acilalquilo, alquiloxicarbonilo, carbonilacilo, aminocarbonilo, azido,

azidoalquilo, aminoalquilo, sal de un aminoalquilo, carboxialquilo, sal de un carboxialquilo, alquilaminoalquilo, sal de un alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, sal de un dialquilaminoalquilo, fenilo, alquiltioalquilo, ariltioalquilo, carboxi, ciano, alcanosulfonilalquilo, alcanosulfinilalquilo, alcoxisulfinilalquilo, tiocianoalquilo, acidalquilo borónico, esteralquilo borónico, guanidinoalquilo, sal de guanidinoalquilo, sulfoalquilo, sal de un sulfoalquilo, alcoxisulfonilalquilo, sulfooxialquilo, sal de un sulfooxialquilo, alcoxisulfoniloxialquilo, fosfonooxialquilo, sal de un fosfonooxialquilo, (alquilfosfooxi)alquilo, fosforilalquilo, sal de un fosforilalquilo, (alquilfosforil)alquilo, piridinilalquilo, sal de un piridinilalquilo, sal de un heteroarilalquilo y alquilo halogenado, incluyendo alquilo polihalogenado; y

con la salvedad de que el compuesto de la fórmula (XV) no puede tener la estructura y estereoquímica de un compuesto de la fórmula (XV-A):



en donde R₃ es metilo; y R₄ es 2-ciclohexenilo; y con la salvedad de que el compuesto de la fórmula (XV) no puede tener la estructura:



en donde R_3 es metilo; y R_4 es ciclohexilo, isopropilo o fenilo.