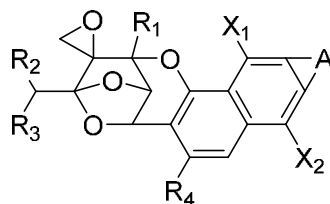


REIVINDICACIONES

Habiéndose descrito la invención como antecede, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes reivindicaciones:

5

1.- Un compuesto de la fórmula:



(I)

10

en donde R₁ es amino, hidroxilo, o mercapto;

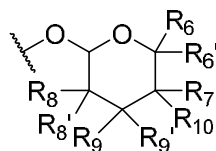
alcoxi (C≤12), cicloalcoxi (C≤12), alquenciloxi (C≤12),
 alquenciloxi (C≤12), aciloxi (C≤12), alquenciltio (C≤12),
 cicloalquenciltio (C≤12), alquenciltio (C≤12), alquenciltio (C≤12),
 15 aciloxi (C≤12), alquencilamino (C≤12), cicloalquencilamino (C≤12),
 alquencilamino (C≤12), alquencilamino (C≤12), dialquencilamino (C≤12),
 dicicloalquencilamino (C≤12), dialquencilamino (C≤12),
 dialquencilamino (C≤12), amido (C≤12), o una versión sustituida de
 cualquiera de estos grupos; o

20

R₁ es un grupo de la fórmula: -O-alcanodiilo
 (C≤8)-alcoxi (C≤12), -O-alcanodiilo (C≤8)-alquenciloxi (C≤12),
 -O-alcanodiilo (C≤8)-alquenciloxi (C≤12), o una versión sustituida
 del mismo; o

R₁ es un grupo de la fórmula:

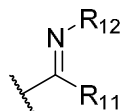
25



en donde:

5 R_6 , R_6' , R_7 , R_8 , R_8' , R_9 , y R_9' son cada uno
independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 8$), alcoxi
($C \leq 8$), aciloxi ($C \leq 8$), alquilo sustituido ($C \leq 8$), alcoxi sustituido
($C \leq 8$), o aciloxi sustituido ($C \leq 8$); y

10 R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi
($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido
($C \leq 12$), acilo sustituido ($C \leq 12$), o un grupo de la fórmula:

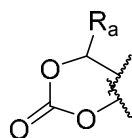


en donde:

15 R_{11} es hidrógeno, alquilo ($C \leq 8$), o alquilo sustituido
($C \leq 8$); y

20 R_{12} es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi
sustituido ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol,
o una versión sustituida de -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo
reactivo tiol, o

R_7 y R_{10} se toman juntos para formar un compuesto
heterocíclico de la fórmula:



en donde:

R_a es hidrógeno, alquilo ($C \leq 6$), o alquilo sustituido ($C \leq 6$);

R_2 y R_3 son independientemente hidrógeno, amino,
5 hidroxilo, mercapto;

alquilo ($C \leq 12$), cicloalquilo ($C \leq 12$), alqueno ($C \leq 12$),
alquino ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), cicloalcoxi ($C \leq 12$), alqueno-
oxi ($C \leq 12$), alquino-oxi ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), cicloalquiltio ($C \leq 12$),
alqueno-iltio ($C \leq 12$), alquino-iltio ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$),
10 cicloalquilamino ($C \leq 12$), alquenoilamino ($C \leq 12$), alquinoilamino
($C \leq 12$), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos;

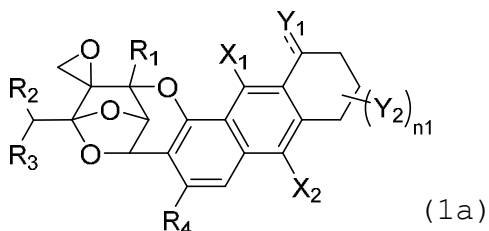
R_2 y R_3 son tomados juntos y son alcóxido ($C \leq 8$),
alquilaminodiol ($C \leq 12$), alquiltiodiol ($C \leq 12$), o una versión
sustituida de cualquiera de estos grupos;

15 R_4 es hidrógeno, amino, halo, hidroxilo, mercapto,
alquilo ($C \leq 12$) o alquilo sustituido ($C \leq 12$);

X_1 y X_2 son cada uno independientemente hidrógeno,
hidroxilo, o

alcoxi ($C \leq 12$), alqueno-oxi ($C \leq 12$), alquino-oxi ($C \leq 12$), o
20 una versión sustituida de cualquiera de estos grupos; y

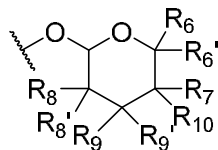
A es un cicloalcanodiol fusionado y tiene la
estructura:



en donde:

Y_1 es hidrógeno, oxo, alcoxi ($C \leq 12$), o alcoxi sustituido ($C \leq 12$), con la condición de que cuando Y_1 es oxo, entonces el átomo al que Y_1 está unido es parte de un doble
5 enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_1 está unido es parte de un enlace doble, entonces Y_1 es oxo;

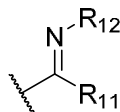
Y_2 es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo; o un grupo de la
10 fórmula:



en donde:

R_6 , R_6' , R_7 , R_8 , R_8' , R_9 , y R_9' son cada uno
15 independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 8$), alcoxi ($C \leq 8$), aciloxi ($C \leq 8$), alquilo sustituido ($C \leq 8$), alcoxi sustituido ($C \leq 8$), o aciloxi sustituido ($C \leq 8$); y

R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido
20 ($C \leq 12$), acilo sustituido ($C \leq 12$), o un grupo de la fórmula:

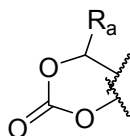


en donde:

R_{11} es hidrógeno, alquilo ($C \leq 8$), o alquilo sustituido
25 ($C \leq 8$); y

R_{12} es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol, o una versión sustituida de -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol; o

5 R_7 y R_{10} se toman juntos para formar un compuesto heterocíclico de la fórmula:

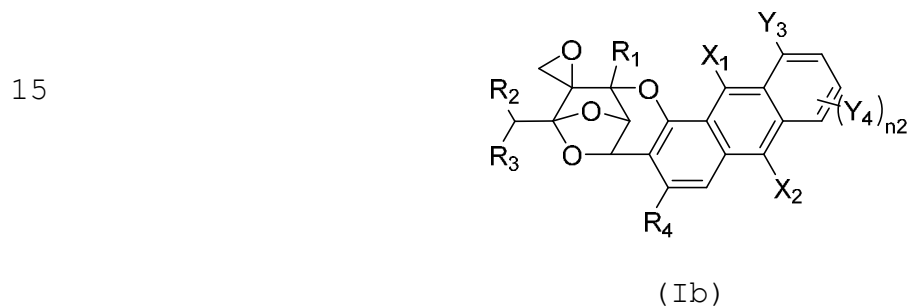


en donde:

10 R_a es hidrógeno, alquilo ($C \leq 6$), o alquilo sustituido ($C \leq 6$); y

n_1 es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; o

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



en donde:

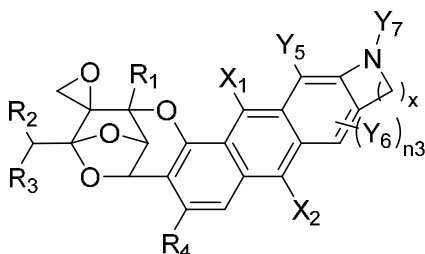
20 Y_3 es hidrógeno, oxo, alcoxi ($C \leq 12$), o alcoxi sustituido ($C \leq 12$), con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un enlace doble, entonces Y_3 es oxo;

25 Y_4 es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi

($C_{\leq 12}$), alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), alquiltio ($C_{\leq 12}$), alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$), alquilamino ($C_{\leq 12}$), alquilamino sustituido ($C_{\leq 12}$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente; y

n_2 es 0, 1, 2 o 3; o

A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



(Ic)

en donde:

Y_5 es hidrógeno, oxo, alcoxi ($C_{\leq 12}$), o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un enlace doble, entonces Y_3 es oxo;

Y_6 es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C_{\leq 12}$), alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), alquiltio ($C_{\leq 12}$), alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$), alquilamino ($C_{\leq 12}$), alquilamino sustituido ($C_{\leq 12}$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$,

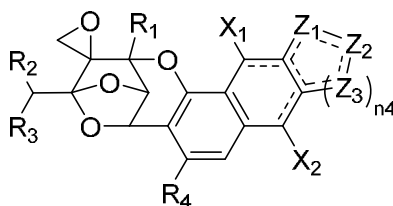
en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

5 Y_7 es hidrógeno, alquilo ($C \leq 12$), o alquilo sustituido ($C \leq 12$);

n_3 es 0 o 1; y

x es 1, 2, 3 o 4; o

A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la
10 estructura:



(Id)

15 en donde:

Z_1 , Z_2 y Z_3 se seleccionan cada uno independientemente entre CR_5R_5' , NR_5'' , O, o S;

R_5 y R_5' son cada uno independientemente hidrógeno, amino, hidroxilo, halo, ciano, nitro, sulfato, sulfamido;

20 alquilo ($C \leq 6$), alcoxi ($C \leq 6$), alquilamino ($C \leq 6$), dialquilamino ($C \leq 12$), amido ($C \leq 6$), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos; y

R_5'' es hidrógeno, alquilo ($C \leq 12$), o alquilo sustituido ($C \leq 12$);

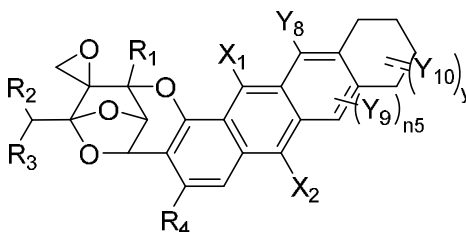
25 con la condición de que al menos uno de Z_1 , Z_2 , o Z_3

sea NR_5'' , O, o S;

n_4 es 1, 2, 3, o 4; o

A es un arenodiilo fusionado con un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

5



(Ie)

10 en donde:

Y_8 e Y_9 se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-\text{OX}_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-\text{SX}_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-\text{NX}_5\text{X}_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

20 Y_{10} es hidrógeno, oxo, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-\text{OX}_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-\text{SX}_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-\text{NX}_5\text{X}_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina

25

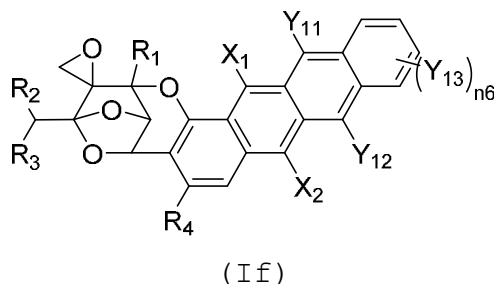
monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente, con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3 está unido es parte de un enlace doble, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, entonces Y_3 es oxo;

n_5 es 0 o 1; y

y es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8;

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:

10



15

en donde:

Y_{11} e Y_{12} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

25

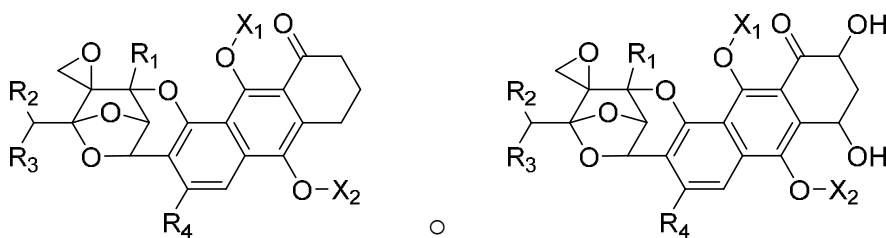
Y_{13} es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi

($c \leq 12$), alcoxi sustituido ($c \leq 12$), alquiltio ($c \leq 12$), alquiltio sustituido ($c \leq 12$), alquilamino ($c \leq 12$), alquilamino sustituido ($c \leq 12$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente, con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3 está unido es parte de un enlace doble, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, entonces Y_3 es oxo; y

n_6 es 0, 1, 2, 3 o 4;

siempre que R_1 no sea hidroxilo y ya sea R_2 o R_3 sea metoxi cuando A es un cicloalcanodiilo fusionado de la fórmula

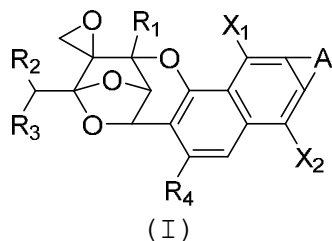
15



o su sal farmacéuticamente aceptable.

20

2.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque se define como:



25

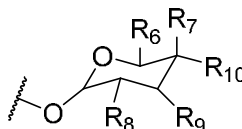
en donde:

R_1 es amino, hidroxilo, o mercapto;

alcoxi ($C \leq 12$), cicloalcoxi ($C \leq 12$), alquenciloxi ($C \leq 12$),
 alquenciloxi ($C \leq 12$), aciloxi ($C \leq 12$), alquenciltio ($C \leq 12$),
 5 cicloalquenciltio ($C \leq 12$), alquenciltio ($C \leq 12$), alquenciltio ($C \leq 12$),
 aciloxi ($C \leq 12$), alquencilamino ($C \leq 12$), cicloalquencilamino ($C \leq 12$),
 alquencilamino ($C \leq 12$), alquencilamino ($C \leq 12$), dialquencilamino ($C \leq 12$),
 dicicloalquencilamino ($C \leq 12$), dialquencilamino ($C \leq 12$),
 dialquencilamino ($C \leq 12$), amido ($C \leq 12$), o una versión sustituida de
 10 cualquiera de estos grupos; o

R_1 es un grupo de la fórmula: -O-alcanodiilo
 ($C \leq 8$)-alcoxi ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 8$)-alquenciloxi ($C \leq 12$),
 -O-alcanodiilo ($C \leq 8$)-alquenciloxi ($C \leq 12$), o una versión sustituida
 del mismo; o

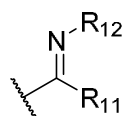
15 R_1 es un grupo de la fórmula:



en donde:

R_6 , R_7 , R_8 y R_9 , son cada uno independientemente
 20 hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 8$), alcoxi ($C \leq 8$), alquilo
 sustituido ($C \leq 8$) o alcoxi sustituido ($C \leq 8$); y

R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi
 ($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido
 ($C \leq 12$), acilo sustituido ($C \leq 12$), o un grupo de la fórmula:



en donde:

R₁₁ es hidrógeno, alquilo (C≤8), o alquilo sustituido

5 (C≤8); y

R₁₂ es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi (C≤12), alcoxi sustituido (C≤12), -O-alcanodiilo (C≤12)- un grupo reactivo tiol, o una versión sustituida de -O-alcanodiilo (C≤12)- un grupo reactivo tiol, o

10 R₂ y R₃ son independientemente hidrógeno, amino, hidroxilo, mercapto;

alquilo (C≤12), cicloalquilo (C≤12), alqueno (C≤12), alquino (C≤12), alcoxi (C≤12), cicloalcoxi (C≤12), alquenoilo (C≤12), alquinoilo (C≤12), alquiltio (C≤12), cicloalquiltio (C≤12), alquenoiltio (C≤12), alquinoiltio (C≤12), alquilamino (C≤12), cicloalquilamino (C≤12), alquenoilamino (C≤12), alquinoilamino (C≤12), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos;

15 R₂ y R₃ son tomados juntos y son alcoxidiilo (C≤8), alquilaminodiilo (C≤12), alquiltiodiilo (C≤12), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos;

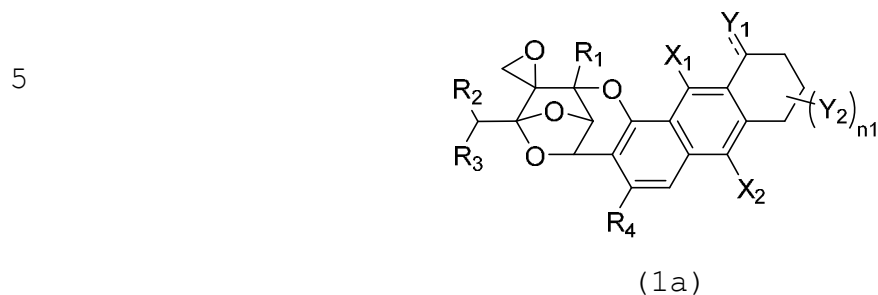
R₄ es hidrógeno, amino, halo, hidroxilo, mercapto, alquilo (C≤12) o alquilo sustituido (C≤12);

X₁ y X₂ son cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, o

25 alcoxi (C≤12), alquenoilo (C≤12), alquinoilo (C≤12), o

una versión sustituida de cualquiera de estos grupos; y

A es un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



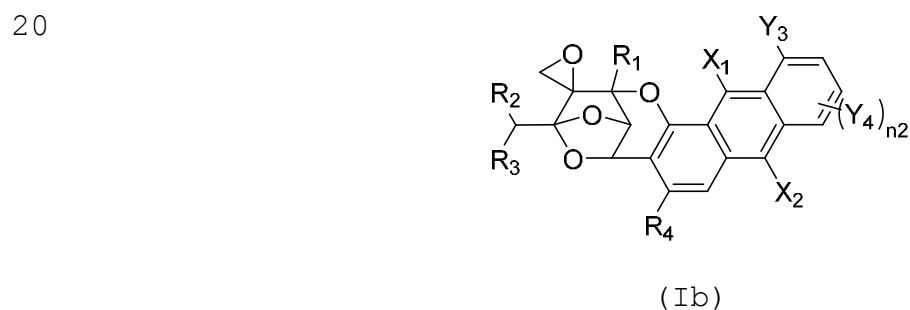
en donde:

10 Y_1 es hidrógeno, oxo, alcoxi ($C_{\leq 12}$), o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), con la condición de que cuando Y_1 es oxo, entonces el átomo al que Y_1 está unido es parte de un doble enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_1 está unido es parte de un enlace doble, entonces Y_1 es oxo;

15 Y_2 es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C_{\leq 12}$), alquilo sustituido ($C_{\leq 12}$), alcoxi ($C_{\leq 12}$), alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), o $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo; y

n_1 es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; o

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



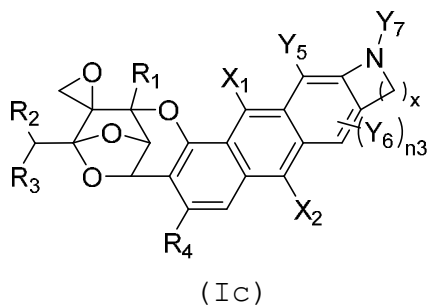
25 en donde:

Y₃ es hidrógeno, oxo, alcoxi (C≤12), o alcoxi sustituido (C≤12), con la condición de que cuando Y₃ es oxo, entonces el átomo al que Y₃ está unido es parte de un doble enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y₃ está unido es parte de un enlace doble, entonces Y₃ es oxo;

Y₄ es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi (C≤12), alcoxi sustituido (C≤12), alquiltio (C≤12), alquiltio sustituido (C≤12), alquilamino (C≤12), alquilamino sustituido (C≤12), -OX₃, en donde X₃ es un grupo protector hidroxilo, -SX₄, en donde X₄ es un grupo protector tio, o -NX₅X₆, en donde ya sea X₅ o X₆ es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X₅ y X₆ se toman juntos y son un grupo protector amina divalente; y

n₂ es 0, 1, 2 o 3; o

A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



en donde:

Y₅ es hidrógeno, oxo, alcoxi (C≤12), o alcoxi sustituido (C≤12), con la condición de que cuando Y₃ es oxo, entonces el átomo al que Y₃ está unido es parte de un doble

enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un enlace doble, entonces Y_3 es oxo;

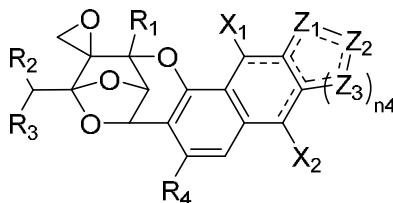
Y_6 es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

Y_7 es hidrógeno, alquilo ($C \leq 12$), o alquilo sustituido ($C \leq 12$);

n_3 es 0 o 1; y

x es 1, 2, 3 o 4; o

A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la estructura:



(Id)

en donde:

Z_1 , Z_2 y Z_3 se seleccionan cada uno independientemente entre CR_5R_5' , NR_5'' , O, o S;

R_5 y R_5' son cada uno independientemente hidrógeno, amino, hidroxilo, halo, ciano, nitro, sulfato, sulfamido;

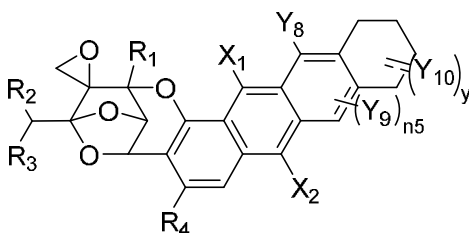
alquilo ($C \leq 6$), alcoxi ($C \leq 6$), alquilamino ($C \leq 6$),
dialquilamino ($C \leq 12$), amido ($C \leq 6$), o una versión sustituida de
cualquiera de estos grupos; y

R_5'' es hidrógeno, alquilo ($C \leq 12$), o alquilo sustituido
5 ($C \leq 12$);

con la condición de que al menos uno de Z_1 , Z_2 , o Z_3
sea NR_5'' , O, o S;

n_4 es 1, 2, 3, o 4; o

A es un arenodiilo fusionado con un
10 cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



15 (Ie)

en donde:

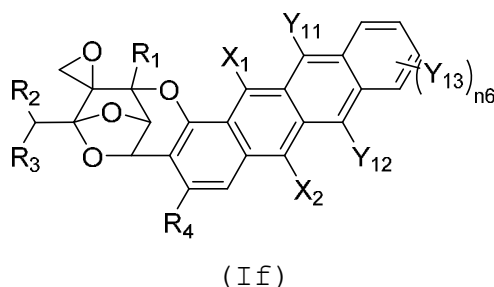
Y_8 e Y_9 se seleccionan cada uno independientemente
de hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi
sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$),
20 alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_3$, en donde
 X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un
grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un
grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o
 X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina
25 divalente;

Y_{10} es hidrógeno, oxo, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxilo ($C \leq 12$), alcoxilo sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector
 5 hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente, con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3
 10 está unido es parte de un enlace doble, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, entonces Y_3 es oxo;

n_5 es 0 o 1; y

y es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8;

15 A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



20

en donde

Y_{11} e Y_{12} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxilo ($C \leq 12$), alcoxilo sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$),
 25 alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_3$, en donde

X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina

5 divalente;

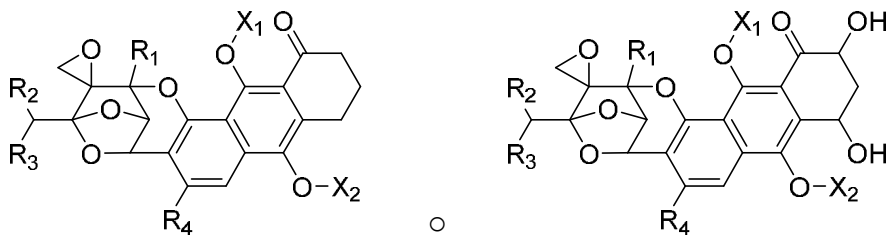
Y_{13} es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde ya sea X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente, con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3 está unido es parte de un

10 enlace doble, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, entonces Y_3 es oxo; y

15 n_6 es 0, 1, 2, 3 o 4;

siempre que R_1 no sea hidroxilo y ya sea R_2 o R_3 sea metoxi cuando A es un cicloalcanodiilo fusionado de la

20 fórmula



25 o su sal farmacéuticamente aceptable.

3.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado porque la fórmula se define además como Ia.

4.- El compuesto de conformidad con la
5 reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado porque la fórmula se define además como Ib.

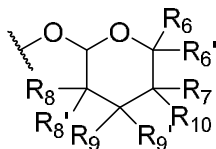
5.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado porque la fórmula se define además como Ic.

10 6.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado porque la fórmula se define además como Id.

7.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado porque la
15 fórmula se define además como Ie.

8.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado porque la fórmula se define además como If.

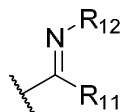
9.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
20 las reivindicaciones 1 o 3-8, caracterizado porque R₁ es:



en donde R₆, R_{6'}, R₇, R₈, R_{8'}, R₉, y R_{9'} son cada uno
25 independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo (C₁₋₈), alcoxi

($C \leq 8$), aciloxi ($C \leq 8$), alquilo sustituido ($C \leq 8$), alcoxi sustituido ($C \leq 8$), o aciloxi sustituido ($C \leq 8$); y

R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), aciloxi sustituido ($C \leq 12$), o un grupo de la fórmula:

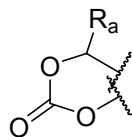


en donde:

R_{11} es hidrógeno, alquilo ($C \leq 8$), o alquilo sustituido ($C \leq 8$); y

R_{12} es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol, o una versión sustituida de -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol; o

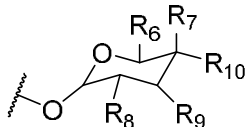
R_7 y R_{10} se toman juntos para formar un compuesto heterocíclico de la fórmula:



en donde:

R_a es hidrógeno, alquilo ($C \leq 6$), o alquilo sustituido ($C \leq 6$).

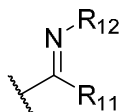
10.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque R_1 es:



en donde:

R_6 , R_7 , R_8 y R_9 son cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 8$), alcoxi ($C \leq 8$), alquilo sustituido ($C \leq 8$), o alcoxi sustituido ($C \leq 8$), y

5 R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), aciloxi sustituido ($C \leq 12$), o un grupo de la fórmula:



10 en donde:

R_{11} es hidrógeno, alquilo ($C \leq 8$), o alquilo sustituido ($C \leq 8$); y

R_{12} es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol,
15 o una versión sustituida de -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol;

11.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 10, caracterizado porque el grupo reactivo de R_{12} es una maleimida.

20 12.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, caracterizado porque R_1 es un grupo de la fórmula: -O-alcanodiilo ($C \leq 8$)-alcoxi ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 8$)-alqueniloxi ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 8$)-alquinoxio ($C \leq 12$), o una versión sustituida del mismo.

25 13.- El compuesto de conformidad con la

reivindicación 12, caracterizado porque el alcanodiilo ($C_{\leq 8}$) de R_1 es $-CH_2-$.

14.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, caracterizado porque R_1 es alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

15.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 14, caracterizado porque R_1 es alcoxi ($C_{\leq 12}$).

16.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 14, caracterizado porque R_1 es alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

17.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 15, caracterizado porque R_1 es $-O(CH_2)_6OH$ o $-OCH_2CH_2SH$.

18.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, caracterizado porque R_1 es alquiniilo ($C_{\leq 12}$) o alquiniilo sustituido ($C_{\leq 12}$).

19.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 18, caracterizado porque R_1 es alquiniilo ($C_{\leq 12}$).

20.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 19, caracterizado porque R_1 es $-CH_2C\equiv CH$.

21.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, caracterizado porque R_1 es alquiltio ($C_{\leq 12}$) o alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$).

22.- El compuesto de conformidad con la

reivindicación 21, caracterizado porque R_1 es alquiltio ($C_{\leq 12}$).

23.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 22, caracterizado porque R_1 es $-SCH_2CH_3$.

24.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque R_2 es hidrógeno.

25.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque R_2 es alquilo ($C_{\leq 12}$) o alquilo sustituido ($C_{\leq 12}$).

26.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 25, caracterizado porque R_2 es alquilo ($C_{\leq 12}$).

27.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado porque R_2 es metilo.

28.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, caracterizado porque R_2 es alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

29.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado porque R_2 es alcoxi ($C_{\leq 12}$).

30.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado porque R_2 es metoxi.

31.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque R_2 es alquiltio ($C_{\leq 12}$) o alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$).

32.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 31, caracterizado porque R_2 es alquiltio ($C_{\leq 12}$).

33.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 32, caracterizado porque R_2 es $-SCH_3$.

34.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque R_2 y R_3 se toman juntos y es alcoxidiilo ($C \leq 12$) o alcoxidiilo sustituido ($C \leq 12$).

35.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 34, caracterizado porque R_2 y R_3 se toman juntos y son alcoxidiilo ($C \leq 12$).

36.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 35, caracterizado porque R_2 y R_3 son $-OCH_2CH_2O-$, $-OCH_2CH_2CH_2O-$, o $-OCH_2C(CH_3)_2CH_2O-$.

37.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 34, caracterizado porque R_2 y R_3 se toman juntos y son alcoxialquilo ($C \leq 12$).

38.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 35, caracterizado porque R_2 y R_3 son $-OCH_2CH(CH_2OH)CH_2O-$, $-OCH_2CH(CH_2SH)CH_2O-$, o $-OCH_2CH(CH_2NHAc)CH_2O-$.

39.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque R_2 y R_3 se toman juntos y es alquiltiodiilo ($C \leq 12$) o alquiltiodiilo sustituido ($C \leq 12$).

40.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 39, caracterizado porque R_2 y R_3 se toman

juntos y son alquiltiodiilo ($C_{\leq 12}$).

41.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 40, caracterizado porque R_2 y R_3 son $-SCH_2CH_2CH_2S-$ o $-SCH_2C(CH_3)_2CH_2S-$.

5 42.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-33, caracterizado porque R_3 es hidrógeno.

 43.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque R_3 es alquilo
10 ($C_{\leq 12}$) o alquilo sustituido ($C_{\leq 12}$).

 44.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 43, caracterizado porque R_3 es alquilo ($C_{\leq 12}$).

 45.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 44, caracterizado porque R_3 es metilo.

15 46.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-33, caracterizado porque R_3 es alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

 47.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 46, caracterizado porque R_3 es alcoxi ($C_{\leq 12}$).

20 48.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 47, caracterizado porque R_3 es metoxi.

 49.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-33, caracterizado porque R_3 es alquiltio ($C_{\leq 12}$) o alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$).

25 50.- El compuesto de conformidad con la

reivindicación 49, caracterizado porque R_3 es alquiltio ($C \leq 12$).

51.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 50, caracterizado porque R_3 es $-SCH_3$.

52.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, caracterizado porque R_4 es halo.

53.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 52, caracterizado porque R_4 es flúor, cloro o bromo.

54.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 53, caracterizado porque R_4 es fluoro.

55.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, caracterizado porque R_4 es alquilo ($C \leq 12$) o alquilo sustituido ($C \leq 12$).

56.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 55, caracterizado porque R_4 es alquilo ($C \leq 12$).

57.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 56, caracterizado porque R_4 es metilo.

58.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 55, caracterizado porque R_4 es alquilo sustituido ($C \leq 12$).

59.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 58, caracterizado porque R_4 es trifluorometilo.

60.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-59, caracterizado porque X_1 es hidrógeno.

61.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-59, caracterizado porque X_1 es hidroxilo.

62.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, caracterizado porque X_1 es alcoxi
5 $(C \leq 12)$ o alcoxi sustituido $(C \leq 12)$.

63.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 62, caracterizado porque X_1 es alcoxi $(C \leq 12)$.

64.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 63, caracterizado porque X_1 es metoxi.

10 65.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 62, caracterizado porque X_1 es alcoxi sustituido $(C \leq 12)$.

66.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 65, caracterizado porque X_1 es $-O(CH_2)_3NH_2$,
15 $-O(CH_2)_2C(O)NH_2$, o $-O(CH_2)_3SH$.

67.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-59, caracterizado porque X_1 es alquenciloxi $(C \leq 12)$.

68.- El compuesto de conformidad con la
20 reivindicación 67, caracterizado porque X_1 es $-OCH_2CHCH_2$.

69.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-59, caracterizado porque X_1 es alquenciloxi $(C \leq 12)$.

70.- El compuesto de conformidad con la
25 reivindicación 69, caracterizado porque X_1 es $-OCH_2CCH$.

71.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-64, caracterizado porque X_2 es hidrógeno.

72.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-64, caracterizado porque X_2 es hidroxilo.

73.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-64, caracterizado porque X_2 es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

74.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 73, caracterizado porque X_2 es alcoxi ($C \leq 12$).

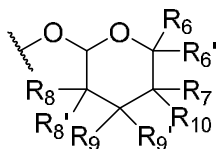
75.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 74, caracterizado porque X_2 es metoxi.

76.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1-3 o 14-75, caracterizado porque Y_1 es oxo.

77.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1-3 o 14-76, caracterizado porque Y_2 es hidrógeno.

78.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-3, o 14-76 caracterizado porque Y_2 es hidroxilo.

79.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-3, o 14-76, caracterizado porque Y_2 es:



en donde:

R_6 , R_6' , R_7 , R_8 , R_8' , R_9 , y R_9' son cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 8$), alcoxi ($C \leq 8$), aciloxi ($C \leq 8$), alquilo sustituido ($C \leq 8$), alcoxi sustituido ($C \leq 8$), o aciloxi sustituido ($C \leq 8$); y

R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), aciloxi sustituido ($C \leq 12$), o un grupo de la fórmula:



en donde:

R_{11} es hidrógeno, alquilo ($C \leq 8$), o alquilo sustituido ($C \leq 8$); y

R_{12} es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol, o una versión sustituida de -O-alcanodiilo ($C \leq 12$)- un grupo reactivo tiol; o

R_7 y R_{10} se toman juntos para formar un compuesto heterocíclico de la fórmula:

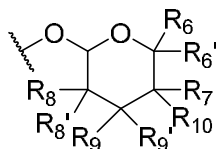


en donde:

R_a es hidrógeno, alquilo ($C \leq 6$), o alquilo sustituido ($C \leq 6$).

25 80.- El compuesto de conformidad con la

reivindicación 79, caracterizado porque Y_2 es:



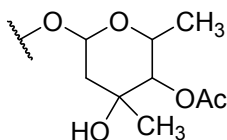
5 en donde:

R_6 , R_6' , R_7 , R_8 , R_8' , R_9 , y R_9' son cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 8$), alcoxi ($C \leq 8$), aciloxi ($C \leq 8$), alquilo sustituido ($C \leq 8$), alcoxi sustituido ($C \leq 8$), o aciloxi sustituido ($C \leq 8$); y

10 R_{10} es hidrógeno, hidroxilo, alquilo ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), acilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), aciloxi sustituido ($C \leq 12$), o acilo sustituido ($C \leq 12$).

81.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 79, caracterizado porque Y_2 es:

15



20

82.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-3 o 14-81, caracterizado porque n_1 es 0, 1, 2 o 3.

83.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 82, caracterizado porque n_1 es 0, 1 o 2.

84.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 4, o 14-75, caracterizado porque Y_3 es
25 hidroxilo.

85.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 4, o 14-75, caracterizado porque Y_3 es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

86.- El compuesto de conformidad con la
5 reivindicación 85, caracterizado porque Y_3 es alcoxi ($C \leq 12$).

87.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 86, caracterizado porque Y_3 es metoxi.

88.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 85, caracterizado porque Y_3 es alcoxi
10 sustituido ($C \leq 12$).

89.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 88, caracterizado porque Y_3 es metoximetoxi.

90.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 4, 14-75 o 84-89, caracterizado
15 porque Y_4 es hidrógeno.

91.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 4, 14-75 o 84-89, caracterizado porque Y_4 es hidroxí.

92.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
20 las reivindicaciones 1, 4, 14-75 o 84-89, caracterizado porque Y_4 es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

93.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 92, caracterizado porque Y_4 es alcoxi ($C \leq 12$).

94.- El compuesto de conformidad con la
25 reivindicación 93, caracterizado porque Y_4 es metoxi.

95.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 4, 14-75 o 84-89, caracterizado porque Y_4 es alquilamino ($C \leq 12$) o alquilamino sustituido ($C \leq 12$).

96.- El compuesto de conformidad con la
5 reivindicación 95, caracterizado porque Y_4 es alquilamino ($C \leq 12$).

97.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 96, caracterizado porque Y_4 es metilamino.

98.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
10 las reivindicaciones 1, 4, 14-75 o 84-97, caracterizado porque n_2 es 1, 2 o 3.

99.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, o 14-75, caracterizado porque Y_5 es hidroxí.

15 100.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, o 14-75, caracterizado porque Y_5 es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

101.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 100, caracterizado porque Y_5 es alcoxi ($C \leq 12$).

20 102.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 101, caracterizado porque Y_5 es metoxi.

103.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75 o 99-102, caracterizado porque Y_6 es hidrógeno.

25 104.- El compuesto de conformidad con cualquiera de

las reivindicaciones 1, 5, 14-75 o 99-102, caracterizado porque Y_6 es hidroxil.

105.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75, o 99-102, caracterizado porque Y_6 es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

106.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 105, caracterizado porque Y_6 es alcoxi ($C \leq 12$).

107.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 106, caracterizado porque Y_6 es metoxil.

108.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75, o 99-107, caracterizado porque Y_7 es hidrógeno.

109.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75 o 99-107, caracterizado porque Y_7 es alquilo ($C \leq 12$) o alquilo sustituido ($C \leq 12$).

110.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75, o 99-109, caracterizado porque x es 2 o 3.

111.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 110, caracterizado porque x es 2.

112.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 110, caracterizado porque x es 3.

113.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75 o 99-109, caracterizado porque n_3 es 0.

114.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 5, 14-75 o 99-109, caracterizado porque n_3 es 1.

115.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, o 14-75, caracterizado porque Z_1 es S.

116.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, o 14-75, caracterizado porque Z_1 es N.

117.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, o 14-75, caracterizado porque Z_1 es O.

118.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-117, caracterizado porque Z_2 es S.

119.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-117, caracterizado porque Z_2 es N.

120.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-117, caracterizado porque Z_2 es O.

121.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-117, caracterizado porque Z_2 es CR_5 ".

122.- El compuesto de conformidad con la

reivindicación 121, caracterizado porque R_5'' es hidrógeno, hidroxilo, halo, alquilo ($C \leq 12$), alquilo sustituido ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

123.- El compuesto de conformidad con la
5 reivindicación 122, caracterizado porque R_5'' es hidrógeno.

124.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 122, caracterizado porque R_5'' es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

125.- El compuesto de conformidad con la
10 reivindicación 124, caracterizado porque R_5'' es metoxi.

126.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 122, caracterizado porque R_5'' es alquilo ($C \leq 12$) o alquilo sustituido ($C \leq 12$).

127.- El compuesto de conformidad con la
15 reivindicación 126, caracterizado porque R_5'' es metilo.

128.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-128, caracterizado porque Z_3 es S.

129.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
20 las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-128, caracterizado porque Z_3 es N.

130.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-128, caracterizado porque Z_3 es O.

25 131.- El compuesto de conformidad con cualquiera de

las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-128, caracterizado porque Z_3 es CR_5 ".

132.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 131, caracterizado porque R_5'' es hidrógeno, 5 hidroxilo, halo, alquilo ($C_{\leq 12}$), alquilo sustituido ($C_{\leq 12}$), alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

133.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 131, caracterizado porque R_5'' es hidrógeno.

134.- El compuesto de conformidad con la 10 reivindicación 132, caracterizado porque R_5'' es alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

135.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 134, caracterizado porque R_5'' es metoxi.

136.- El compuesto de conformidad con la 15 reivindicación 132, caracterizado porque R_5'' es alquilo ($C_{\leq 12}$) o alquilo sustituido ($C_{\leq 12}$).

137.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 136, caracterizado porque R_5'' es metilo.

138.- El compuesto de conformidad con cualquiera de 20 las reivindicaciones 1, 6, 14-75 o 115-137, caracterizado porque n_4 es 1, 2 o 3.

139.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75, caracterizado porque Y_8 es hidrógeno.

25 140.- El compuesto de conformidad con cualquiera de

las reivindicaciones 1, 7, 14-75, caracterizado porque Y_8 es hidroxilo.

141.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75, caracterizado porque Y_8 es alcoxilo ($C \leq 12$) o alcoxilo sustituido ($C \leq 12$).

142.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 141, caracterizado porque Y_8 es alcoxilo ($C \leq 12$).

143.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 142, caracterizado porque Y_8 es metoxilo.

144.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-143, caracterizado porque Y_9 es hidrógeno.

145.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-143, caracterizado porque Y_9 es hidroxilo.

146.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-143, caracterizado porque Y_9 es alcoxilo ($C \leq 12$) o alcoxilo sustituido ($C \leq 12$).

147.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 146, caracterizado porque Y_9 es alcoxilo ($C \leq 12$).

148.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 147, caracterizado porque Y_9 es metoxilo.

149.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-148, caracterizado porque Y_{10} es hidrógeno.

150.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-148, caracterizado porque Y₁₀ es hidroxí.

151.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-148, caracterizado porque Y₁₀ es oxo.

152.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75, o 139-148, caracterizado porque Y₁₀ es alcoxi (C≤12) o alcoxi sustituido (C≤12).

153.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 152, caracterizado porque Y₁₀ es alcoxi (C≤12).

154.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 153, caracterizado porque Y₁₀ es metoxi.

155.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 139-148, caracterizado porque Y₁₀ es alquilamino (C≤12) o alquilamino sustituido (C≤12).

156.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 146, caracterizado porque Y₁₀ es alquilamino (C≤12).

157.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 147, caracterizado porque Y₁₀ es metilamino.

158.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-154, caracterizado porque n₅ es 1.

159.- El compuesto de conformidad con cualquiera de

las reivindicaciones 1, 7, 14-75 o 139-158, caracterizado porque y es 1, 2, 3, 4, 5 o 6.

160.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75, caracterizado porque Y_{11} es
5 hidrógeno.

161.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75, caracterizado porque Y_{11} es hidroxí.

162.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
10 las reivindicaciones 1, 8, 14-75, caracterizado porque Y_{11} es alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

163.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 141, caracterizado porque Y_{11} es alcoxi ($C_{\leq 12}$).

164.- El compuesto de conformidad con la
15 reivindicación 142, caracterizado porque Y_{11} es metoxi.

165.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-164, caracterizado porque Y_{12} es hidrógeno.

166.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
20 las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-164, caracterizado porque Y_{12} es hidroxí.

167.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-164, caracterizado porque Y_{12} es alcoxi ($C_{\leq 12}$) o alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$).

25 168.- El compuesto de conformidad con la

reivindicación 146, caracterizado porque Y_{12} es alcoxi ($C \leq 12$).

169.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 147, caracterizado porque Y_{12} es metoxi.

170.- El compuesto de conformidad con cualquiera de
5 las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-169, caracterizado porque Y_{13} es hidrógeno.

171.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-169, caracterizado porque Y_{13} es hidroxí.

10 172.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-169, caracterizado porque Y_{13} es oxo.

173.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-169, caracterizado
15 porque Y_{13} es alcoxi ($C \leq 12$) o alcoxi sustituido ($C \leq 12$).

174.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 152, caracterizado porque Y_{13} es alcoxi ($C \leq 12$).

175.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 153, caracterizado porque Y_{13} es metoxi.

20 176.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-169, caracterizado porque Y_{13} es alquilamino ($C \leq 12$) o alquilamino sustituido ($C \leq 12$).

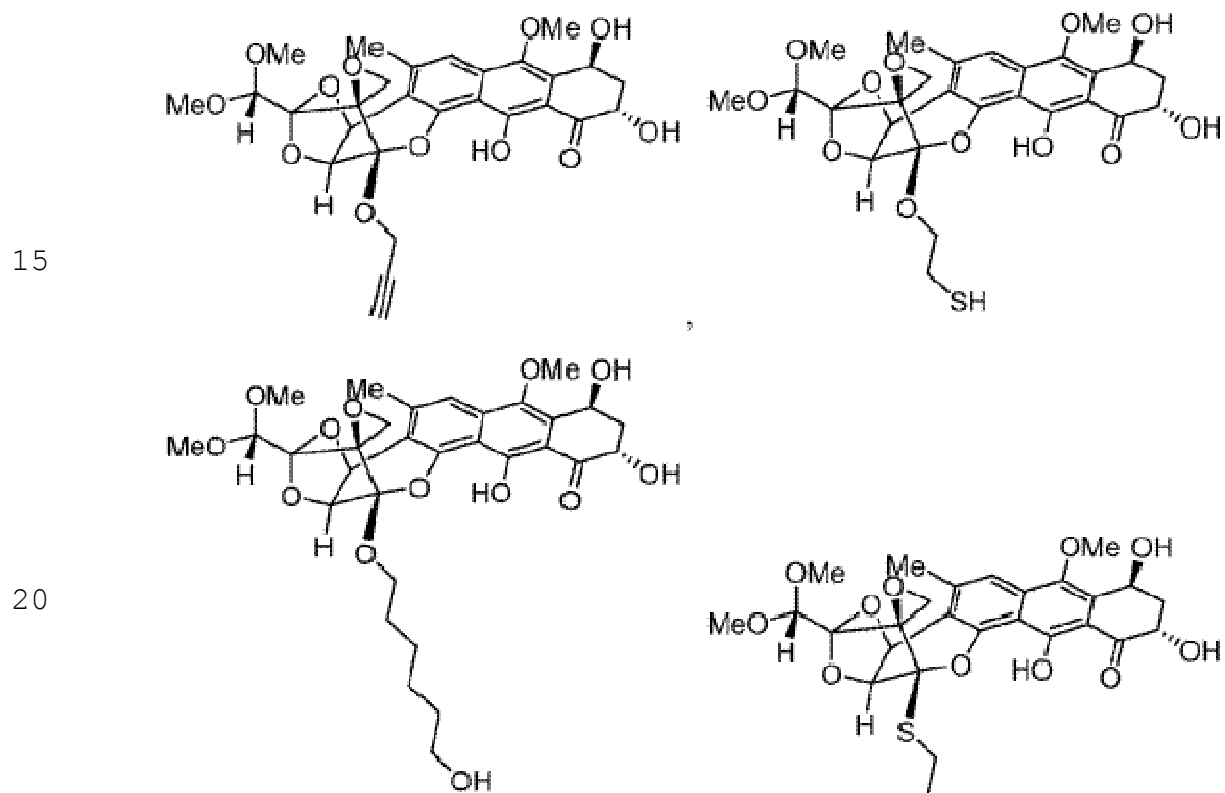
177.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 146, caracterizado porque Y_{13} es alquilamino
25 ($C \leq 12$).

178.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 147, caracterizado porque Y_{13} es metilamino.

179.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 8, 14-75 o 160-154, caracterizado porque n_6 es 1, 2 o 3.

180.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 179, caracterizado porque n_6 es 2 o 3.

181.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-180, caracterizado porque el compuesto se define además como:



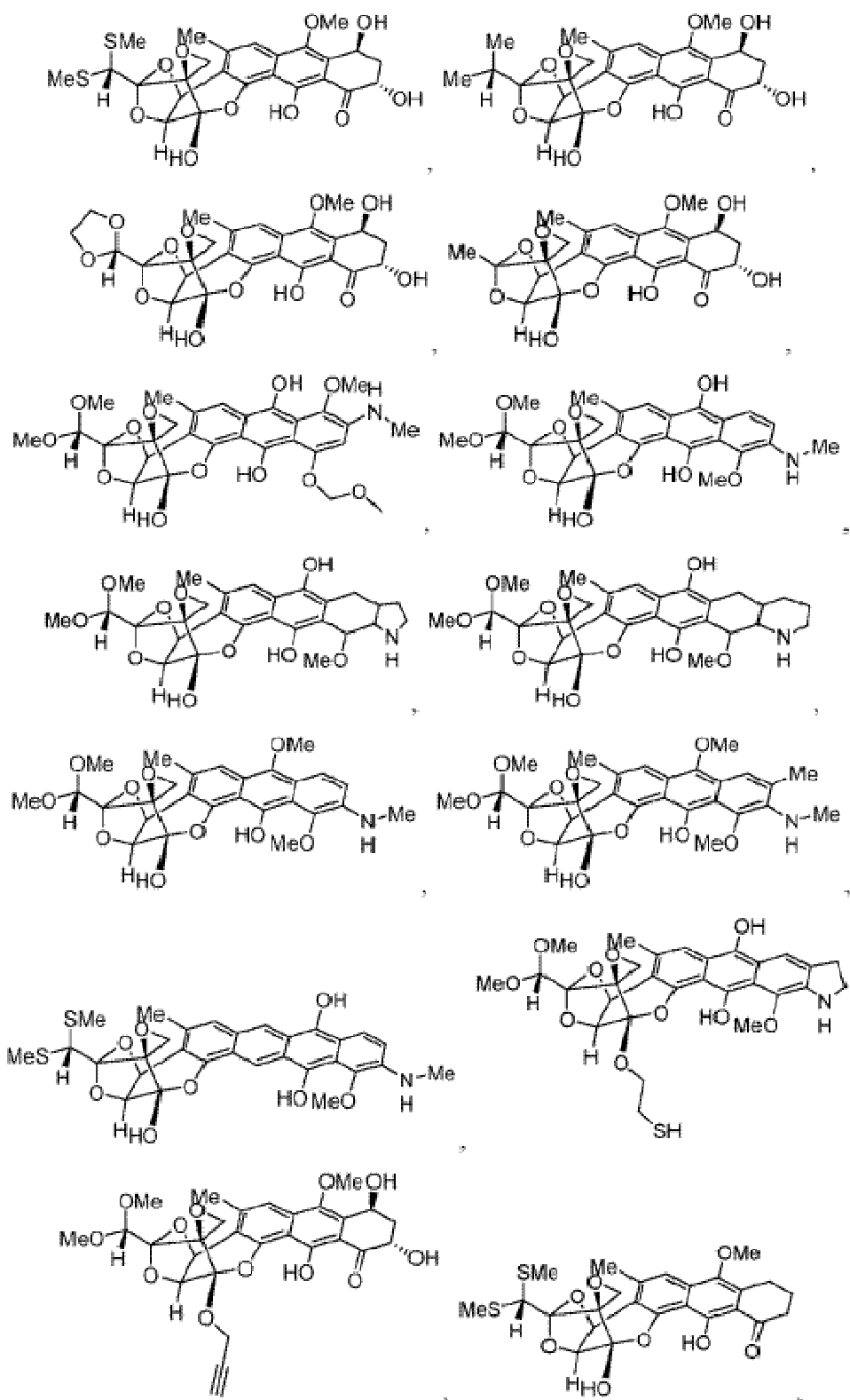
5

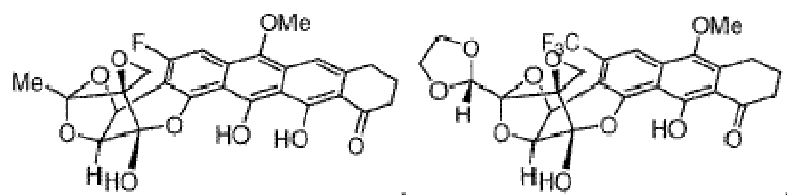
10

15

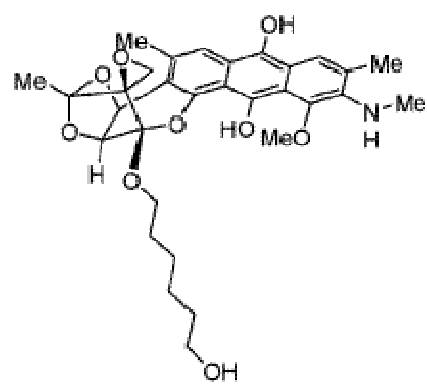
20

25

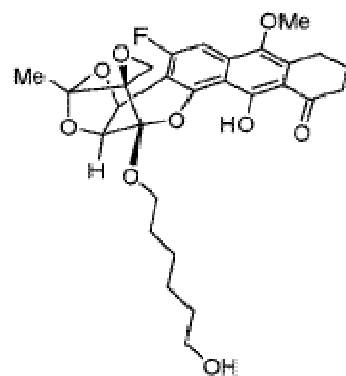




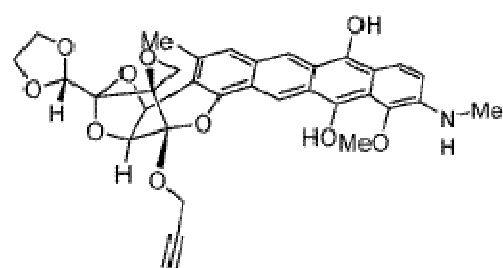
5



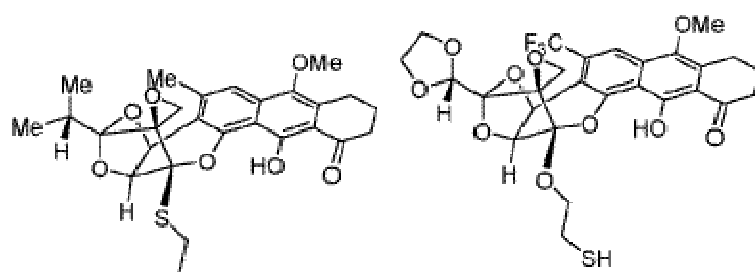
10



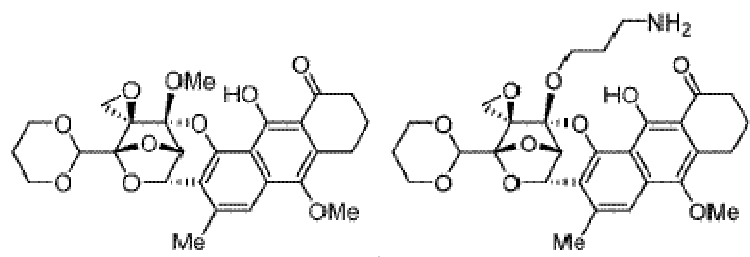
15



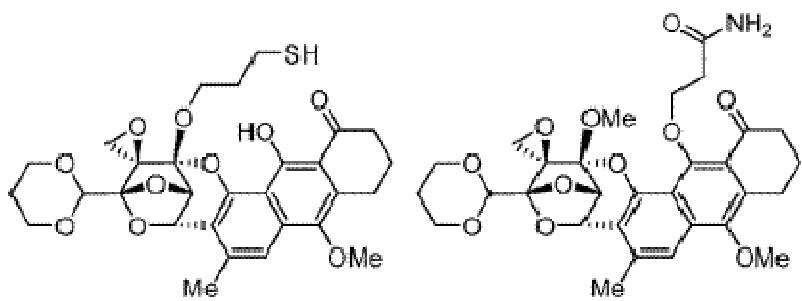
20



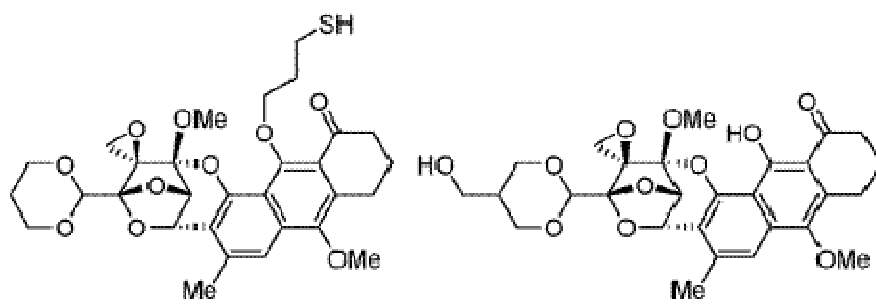
25



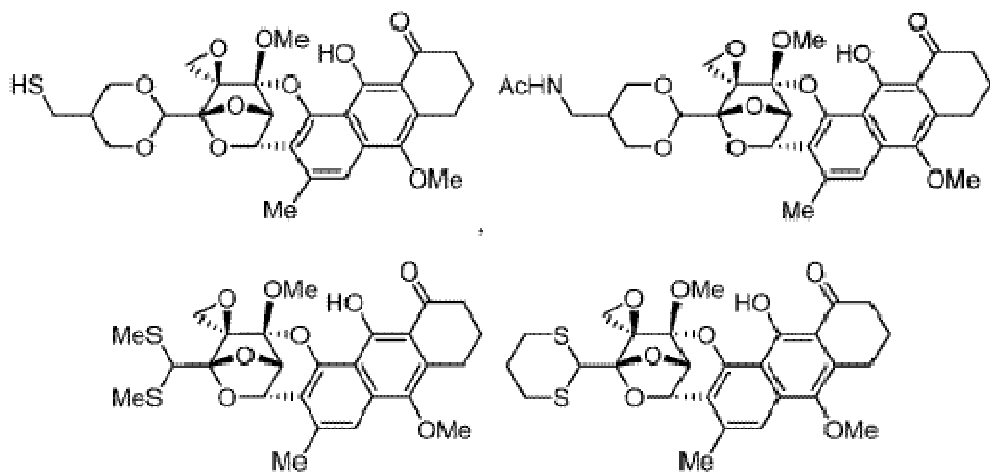
5



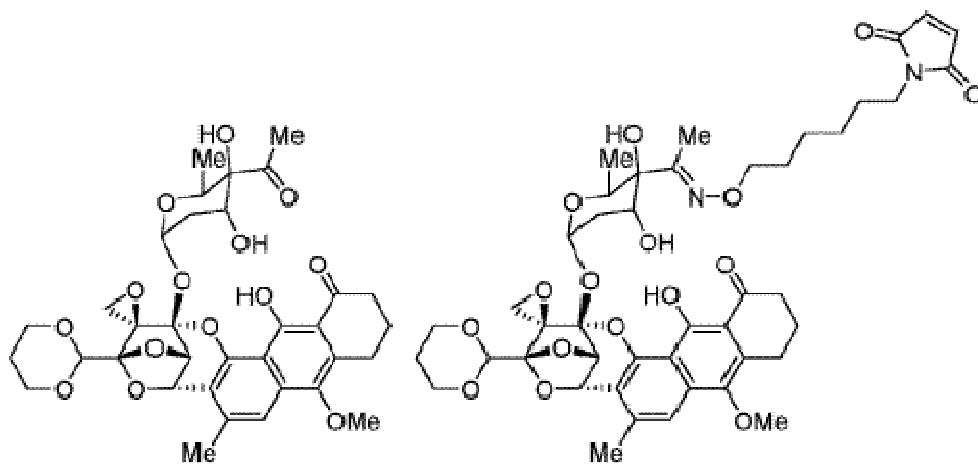
10



15

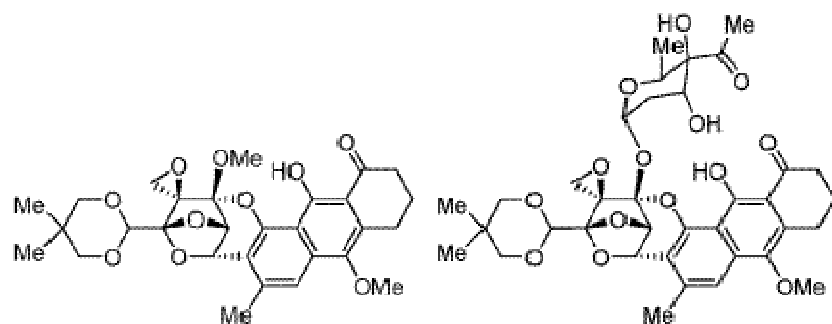


20

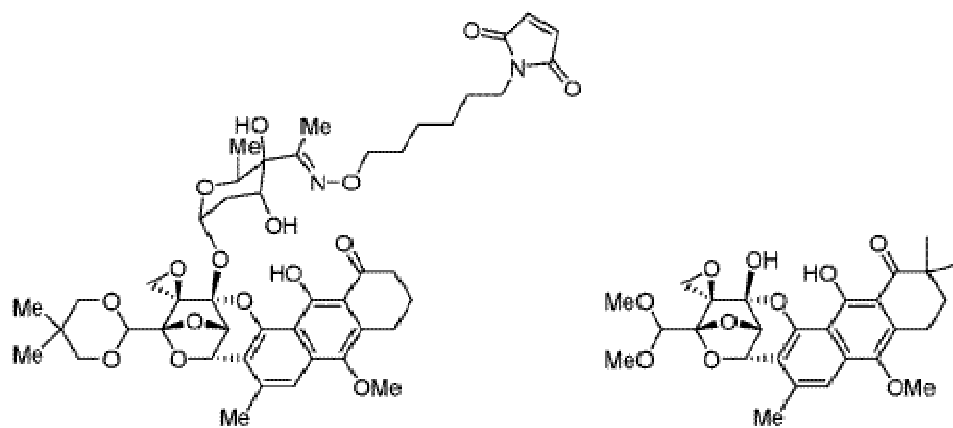


25

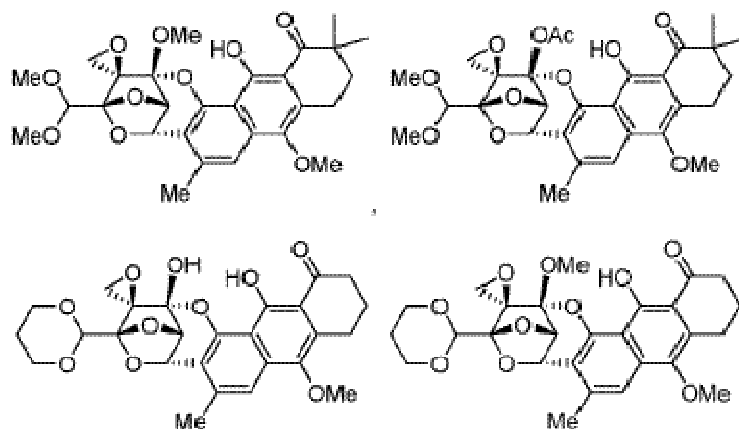
5



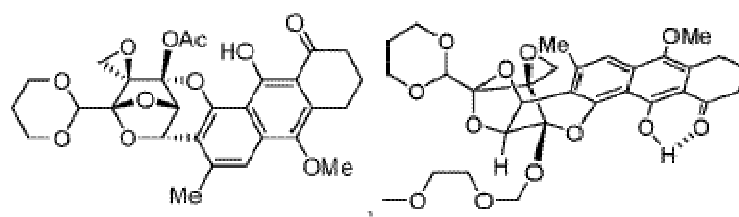
10



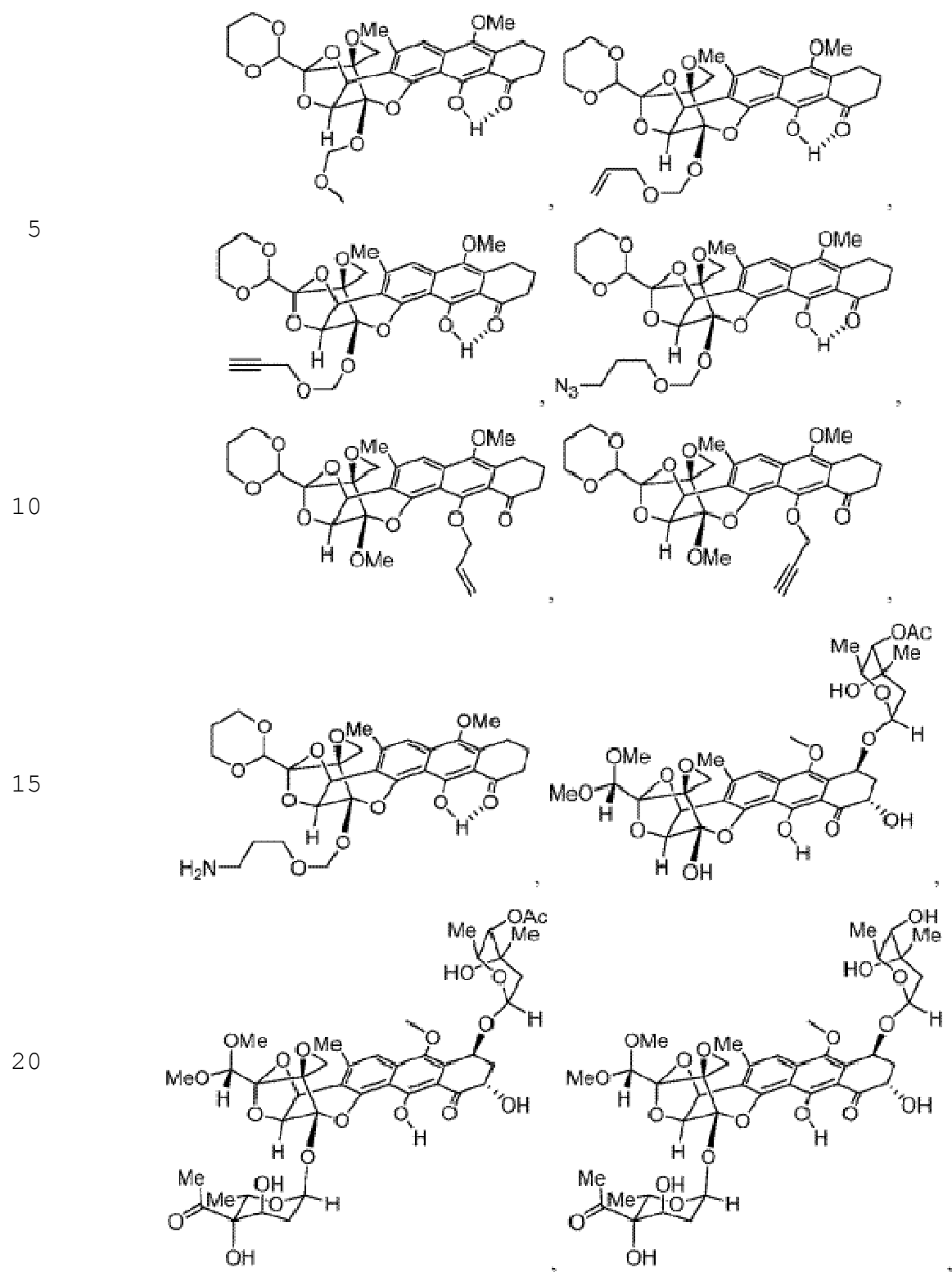
15



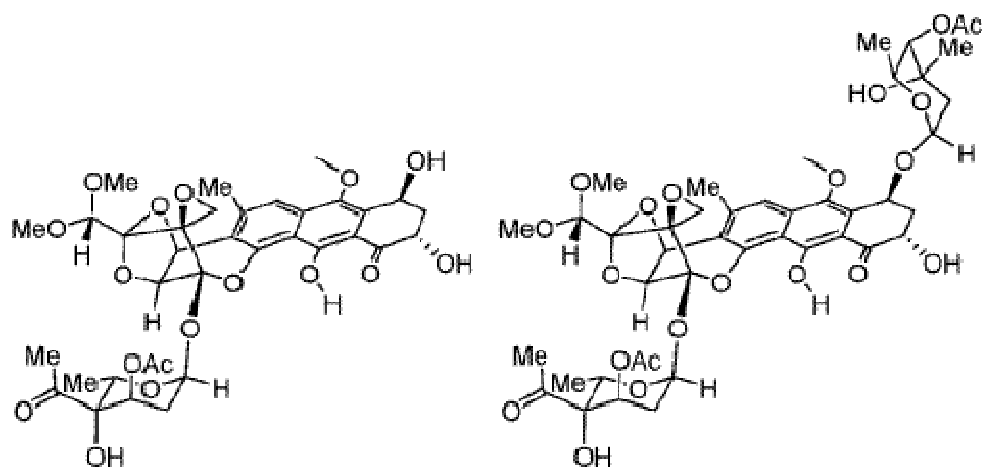
20



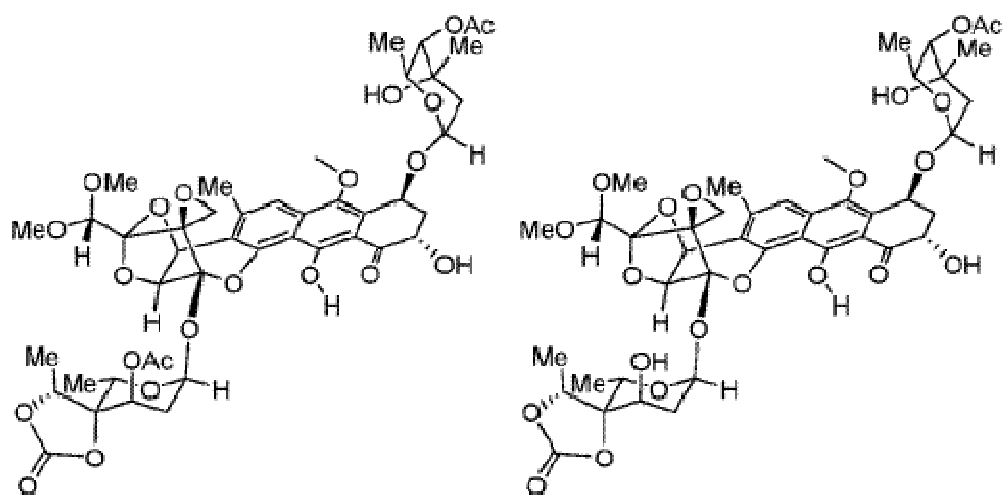
25



5

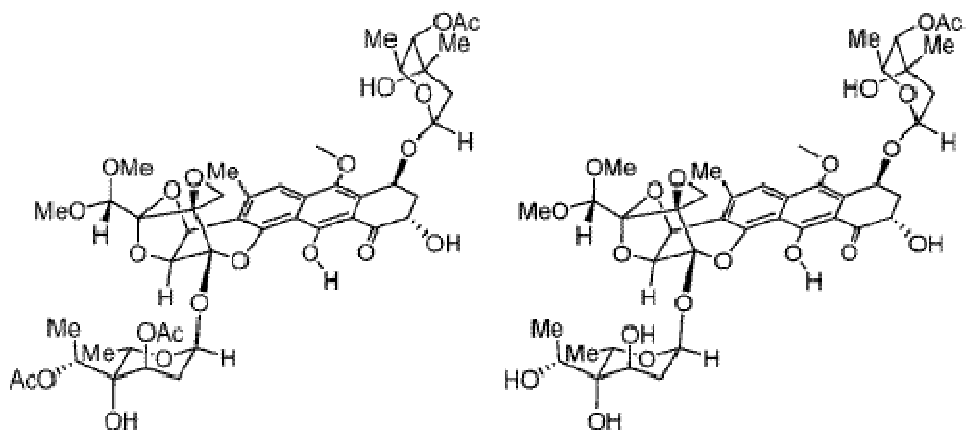


10

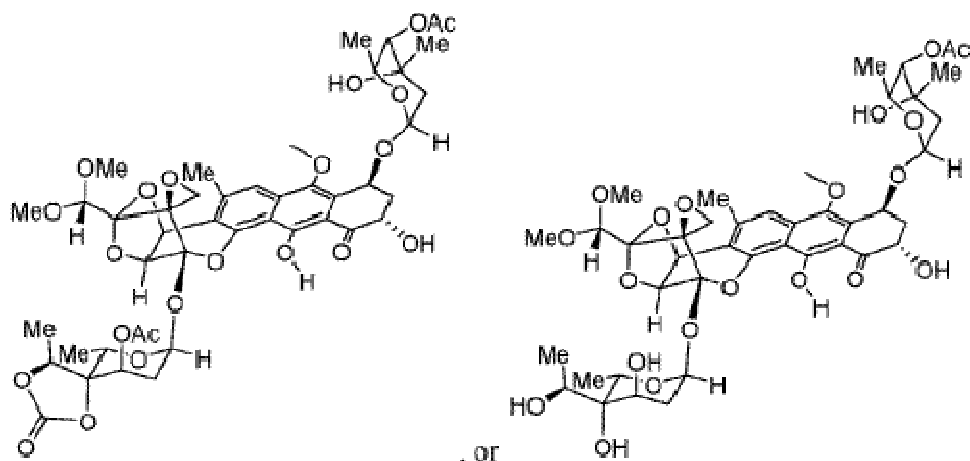


15

5



10



15

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

182.- Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-181 y un portador farmacéuticamente aceptable.

183.- La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 182, caracterizada porque la composición se formula para administración: oralmente, intraadiposalmente, intraarterialmente, intraarticularmente, intracranealmente, intradérmicamente, intralesionalmente,

intramuscularmente, intranasalmente, intraocularmente,
intrapericardialmente, intraperitonealmente,
intrapleuralmente, intraprostalmente, intrarrectalmente,
intratecalmente, intratraquealmente, intratumoralmente,
5 intraumbilicalmente, intravaginalmente intravenosamente,
intravesicularmente, intravítreamente, liposómicamente,
localmente, mucosamente, parenteralmente, rectalmente,
subconjuntivalmente, subcutáneamente, sublingualmente,
tópicamente, transbucalmente, transdérmicamente,
10 vaginalmente, en cremas, en composiciones lipídicas, vía un
catéter, vía un lavado, vía infusión continua, vía infusión,
vía inhalación, vía inyección, vía suministro local, o vía
perfusión localizada.

184.- Un método para tratar una enfermedad o
15 trastorno en un paciente que lo necesite, que comprende
administrar al paciente una cantidad farmacéuticamente
efectiva de un compuesto o composición de conformidad con
cualquiera de las reivindicaciones 1-183.

185.- El método de conformidad con la
20 reivindicación 184, caracterizado porque la enfermedad o
trastorno es cáncer.

186.- El método de conformidad con la
reivindicación 185, caracterizado porque el cáncer es un
carcinoma, sarcoma, linfoma, leucemia, melanoma, mesotelioma,
25 mieloma múltiple o seminoma.

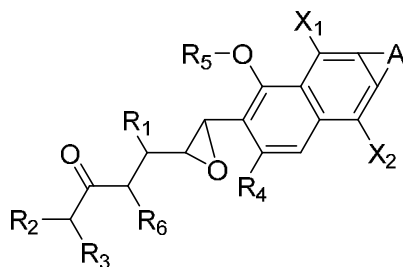
187.- El método de conformidad con la reivindicación 185, caracterizado porque el cáncer es de vejiga, sangre, hueso, cerebro, mama, sistema nervioso central, cuello uterino, colon, endometrio, esófago, vesícula biliar, tracto gastrointestinal, genitales, tracto genitourinario, cabeza, riñón, laringe, hígado, pulmón, tejido muscular, cuello, mucosa oral o nasal, ovario, páncreas, próstata, piel, bazo, intestino delgado, intestino grueso, estómago, testículo o tiroides.

188.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 184-187, caracterizado porque comprende además un segundo agente o modalidad terapéutica.

189.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 184-188, caracterizado porque el compuesto se administra una vez.

190.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 184-188, caracterizado porque el compuesto se administra dos o más veces.

191.- Un método para preparar un compuesto que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula:



(II)

en donde:

R_1 es amino, hidroxilo o mercapto; o $-OX_3$, en donde X_3 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_4$, en donde X_4 es un grupo protector tio, o $-NX_5X_6$, en donde X_5 o X_6 es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_5 y X_6 se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

R_2 y R_3 se seleccionan independientemente de hidrógeno, amino, hidroxilo, mercapto;

alquilo ($C \leq 12$), cicloalquilo ($C \leq 12$), alqueno ($C \leq 12$), alquino ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), cicloalcoxi ($C \leq 12$), alquenoiloxi ($C \leq 12$), alquinoiloxi ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), cicloalquiltio ($C \leq 12$), alquenoiltio ($C \leq 12$), alquinoiltio ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), cicloalquilamino ($C \leq 12$), alquenoilamino ($C \leq 12$), alquinoilamino ($C \leq 12$), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos, o $-OX_7$, en donde X_7 es un grupo protector hidroxilo, $-SX_8$, en donde X_8 es un grupo protector tio, o $-NX_9X_{10}$, en donde ya sea X_9 o X_{10} es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_9 y X_{10} se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

R_2 y R_3 se toman juntos y son alcoxidiilo ($C \leq 12$), alquilaminodiilo ($C \leq 12$), alquiltiodiilo ($C \leq 12$), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos;

R_4 es hidrógeno, amino, halo, hidroxilo, mercapto, alquilo ($C \leq 12$), o alquilo sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_{11}$, en donde X_{11} es un grupo protector hidroxilo, $-SX_{12}$, en donde X_{12} es un grupo

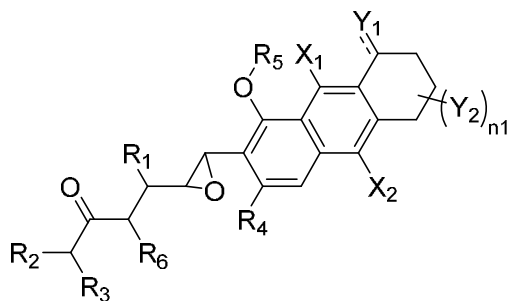
protector tio, o $-NX_{13}X_{14}$, en donde ya sea X_{13} o X_{14} es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_{13} y X_{14} se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

R_5 es hidrógeno o un grupo protector hidroxil;

5 R_6 es hidrógeno o alquilideno ($C \leq 12$), alquilo ($C \leq 12$), cicloalquilo ($C \leq 12$), alquenilo ($C \leq 12$), alquinilo ($C \leq 12$), alcoxi ($C \leq 12$), cicloalcoxi ($C \leq 12$), alqueniloxi ($C \leq 12$), alquiniloxi ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), dialquilamino ($C \leq 12$), o una versión sustituida de cualquiera de estos grupos;

10 X_1 y X_2 , son cada uno independientemente hidrogeno, hidroxil, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_{15}$, en donde X_{15} es un grupo protector hidroxil; o X_{15} y R_5 se toman juntos y son un grupo divalente diol protector; y

15 A es un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



20

(IIIa)

en donde:

Y_1 es hidrógeno, oxo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_{16}$, en donde X_{16} es un grupo protector hidroxil; con
25 la condición de que cuando Y_1 es oxo, entonces el átomo al que

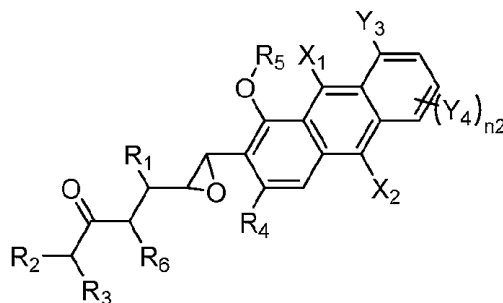
Y_1 está unido es parte de un doble enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_1 está unido es parte de un doble enlace, entonces Y_1 es oxo;

Y_2 es hidrógeno, hidroxilo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_{17}$, en donde X_{17} es un grupo protector hidroxilo; y

n_1 es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; o

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:

10



(IIIb)

15

en donde:

Y_3 es hidrógeno, oxo, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_{18}$, en donde X_{18} es un grupo protector hidroxilo; con la condición de que cuando Y_3 es oxo, entonces el átomo al que Y_3 está unido es parte de un doble enlace, y siempre que cuando el átomo al que Y_3 está unido forme parte de un doble enlace, entonces Y_3 es oxo;

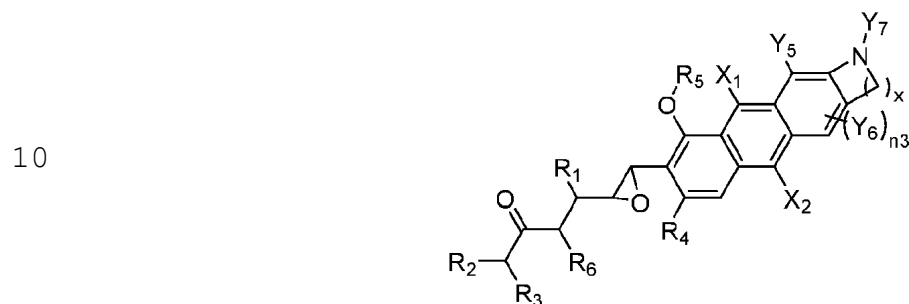
Y_4 es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_{19}$, en donde X_{19} es un grupo protector hidroxilo, $-SX_{20}$,

25

en donde X_{20} es un grupo protector tio, o $-NX_{21}X_{22}$, en donde X_{21} o X_{22} es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_{21} y X_{22} se toman juntos y son un grupo protector amina divalente; y

5 n_2 es 0, 1, 2 o 3; o

A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



(IIIc)

en donde:

15 Y_5 es hidrógeno, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), o $-OX_{23}$, en donde X_{23} es un grupo protector hidroxil;

Y_6 es hidrógeno, hidroxil, amino, mercapto, alcoxi ($C \leq 12$), alcoxi sustituido ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), alquiltio sustituido ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), alquilamino sustituido ($C \leq 12$), $-OX_{24}$, en donde X_{24} es un grupo protector hidroxil, $-SX_{25}$, en donde X_{25} es un grupo protector tio, o $-NX_{26}X_{27}$, en donde ya sea X_{26} o X_{27} es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_{26} y X_{27} se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

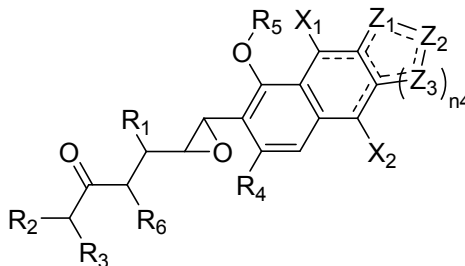
25 Y_7 es hidrógeno, alquilo ($C \leq 12$), o alquilo sustituido

(C_{≤12});

n₃ es 0 o 1; y

x es 1, 2, 3 o 4; o

A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la
5 estructura:



10 (IIId)

en donde:

Z₁, Z₂ y Z₃ se seleccionan cada uno
independientemente de CR₆R₆', NR₇, O o S;

R₆ y R₆' son cada uno independientemente hidrógeno,
15 amino, hidroxilo, halo, ciano, nitro, sulfato, sulfamido;

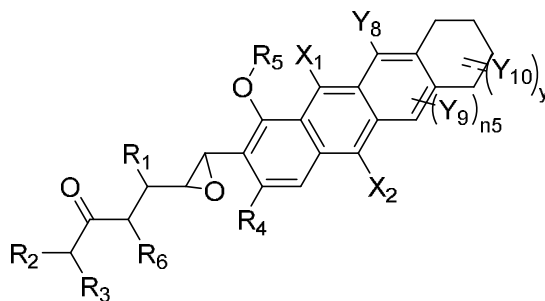
alquilo (C_{≤6}), alcoxi (C_{≤6}), alquilamino (C_{≤6}),
dialquilamino (C_{≤12}), amido (C_{≤12}), o una versión sustituida de
cualquiera de estos grupos; y

R₇ es hidrógeno, alquilo (C_{≤12}), o alquilo sustituido
20 (C_{≤12});

con la condición de que al menos uno de Z₁, Z₂ o Z₃
sea NR₆, O o S;

n₄ es 1, 2, 3 o 4; o

A es un arenodiilo fusionado con un
25 cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



(IIIe)

en donde:

Y₈ e Y₉ se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi (C≤12), alcoxi sustituido (C≤12), alquiltio (C≤12), alquiltio sustituido (C≤12), alquilamino (C≤12), alquilamino sustituido (C≤12), -OX₂₈, en donde X₂₈ es un grupo protector hidroxilo, -SX₂₉, en donde X₂₉ es un grupo protector tio, o -NX₃₀X₃₁, en donde X₃₀ o X₃₁ es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X₃₀ y X₃₁ se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

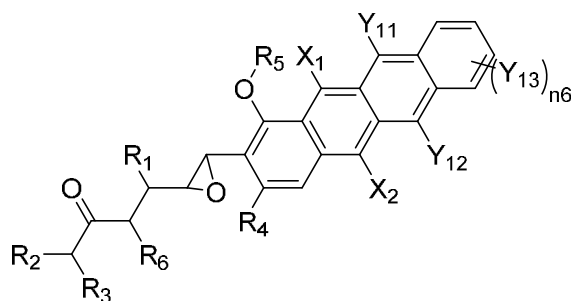
Y₁₀ es hidrógeno, oxo, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi (C≤12), alcoxi sustituido (C≤12), alquiltio (C≤12), alquiltio sustituido (C≤12), alquilamino (C≤12), alquilamino sustituido (C≤12), -OX₃₂, en donde X₃₂ es un grupo protector hidroxilo, -SX₃₃, en donde X₃₃ es un grupo protector tio, o -NX₃₄X₃₅, en donde X₃₄ o X₃₅ es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X₃₄ y X₃₅ se toman juntos y son un grupo protector amina divalente, con la condición de que cuando Y₁₀ es oxo, entonces el átomo al que Y₁₀ está unido es parte de un doble enlace, y siempre que

cuando el átomo al que Y_{10} está unido es parte de un doble enlace, entonces Y_{10} es oxo;

n_5 es 0 o 1; e

y es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8;

5 A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



10

(IIIIf)

en donde:

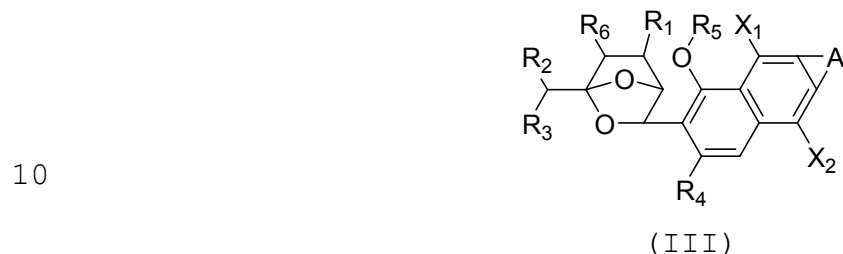
Y_{11} e Y_{12} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C_{\leq 12}$), alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), alquiltio ($C_{\leq 12}$), alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$),
 15 alquilamino ($C_{\leq 12}$), alquilamino sustituido ($C_{\leq 12}$), $-OX_{36}$, en donde X_{36} es un grupo protector hidroxilo, $-SX_{37}$, en donde X_{37} es un grupo protector tio, o $-NX_{38}X_{39}$, en donde ya sea X_{38} o X_{39} es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o
 20 X_{38} y X_{39} se toman juntos y son un grupo protector amina divalente;

Y_{13} es hidrógeno, hidroxilo, amino, mercapto, alcoxi ($C_{\leq 12}$), alcoxi sustituido ($C_{\leq 12}$), alquiltio ($C_{\leq 12}$), alquiltio sustituido ($C_{\leq 12}$), alquilamino ($C_{\leq 12}$), alquilamino sustituido
 25 ($C_{\leq 12}$), $-OX_{40}$, en donde X_{40} es un grupo protector hidroxilo, $-SX_{41}$,

en donde X_{41} es un grupo protector tio, o $-NX_{42}X_{43}$, en donde ya sea X_{42} o X_{43} es un grupo protector amina monovalente y el otro es un hidrógeno o X_{42} y X_{43} son tomados juntos y son un grupo protector amina divalente; y

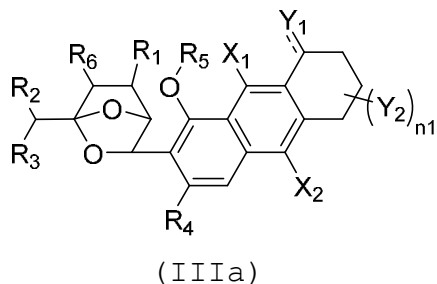
5 n_6 es 0, 1, 2, 3 o 4;

con un ácido de Lewis en condiciones suficientes para producir un compuesto de la fórmula:



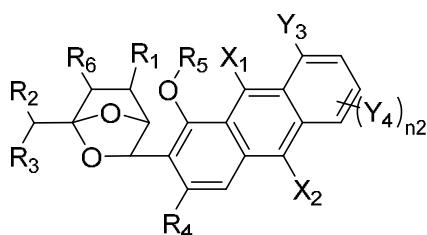
en donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , X_1 , y X_2 son como se define anteriormente;

15 A es un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



20 en donde; Y_1 , Y_2 y n_1 son como se define anteriormente;

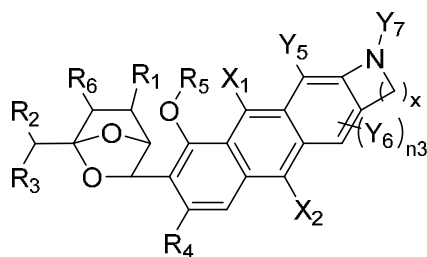
A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



(IIIb)

en donde: Y_3 , Y_4 y n_2 son como se define anteriormente;

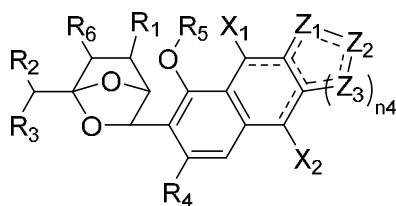
A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



(IIIc)

en donde: Y_5 , Y_6 , Y_7 , x y n_3 son como se define anteriormente;

A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la estructura:

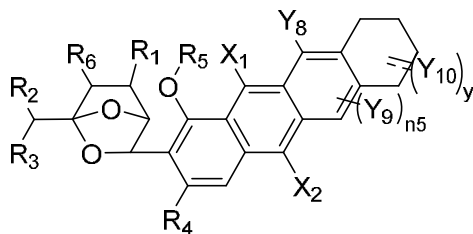


(IIId)

en donde: Z_1 , Z_2 , Z_3 y n_4 son como se define anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado con un

cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

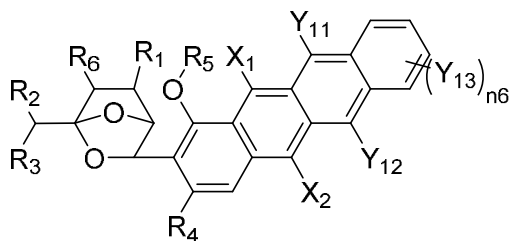


5

(IIIe), o

en donde: Y_8 , Y_9 y n_5 son como se definen anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



10

(IIIIf)

en donde: Y_{11} , Y_{12} , Y_{13} , y n_6 son como se define anteriormente;

15

o una sal del mismo.

192.- El método de conformidad con la reivindicación 191, caracterizado porque el ácido de Lewis es un metal de transición o un complejo de boro.

20

193.- El método de conformidad con la reivindicación 191 o reivindicación 192, caracterizado porque el ácido de Lewis es un complejo de boro.

194.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191-193, caracterizado porque el ácido

25

de Lewis es eterato de trifluoruro de boro.

195.- El método de conformidad con la reivindicación 191 o reivindicación 192, caracterizado porque el ácido de Lewis es un complejo de metal de transición.

5 196.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191, 192 o 195, caracterizado porque el ácido de Lewis es SnCl_4 .

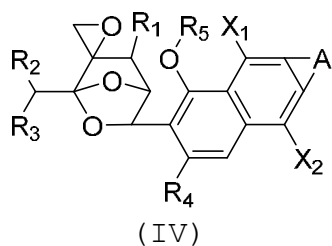
10 197.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191-196, caracterizado porque el método comprende además un solvente.

198.- El método de conformidad con la reivindicación 197, caracterizado porque el solvente es cloroalcano ($\text{C}_{\leq 12}$).

15 199.- El método de conformidad con la reivindicación 198, caracterizado porque el solvente es diclorometano.

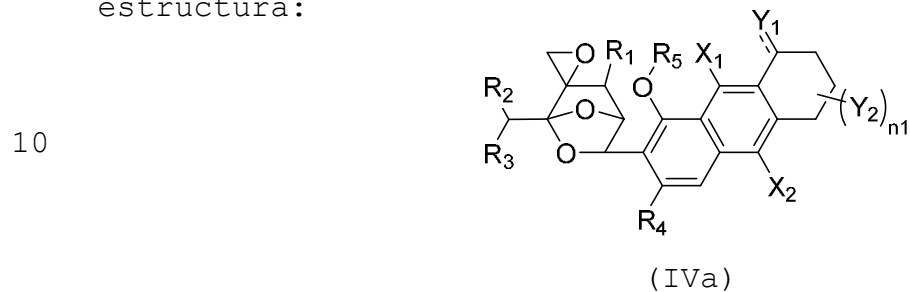
200.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191-196, caracterizado porque R_6 es alquilideno ($\text{C}_{\leq 12}$) o alquildieno sustituido ($\text{C}_{\leq 12}$).

20 201.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191-199, caracterizado porque el método además comprende hacer reaccionar el compuesto con un agente epoxidante bajo condiciones suficientes para producir un compuesto de la fórmula:



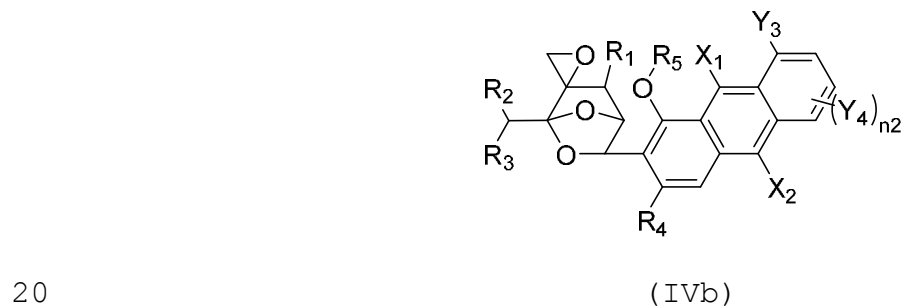
5 en donde: R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X_1 , y X_2 son como se define anteriormente,

A es un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



10 en donde: Y_1 , Y_2 y n_1 son como se define anteriormente;

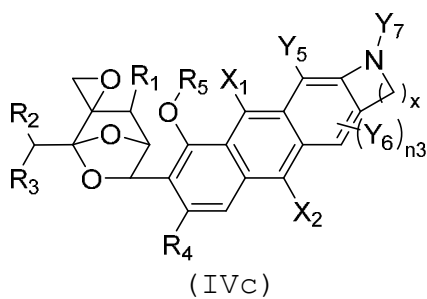
15 A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



20 en donde: Y_3 , Y_4 y n_2 son como se define anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

25

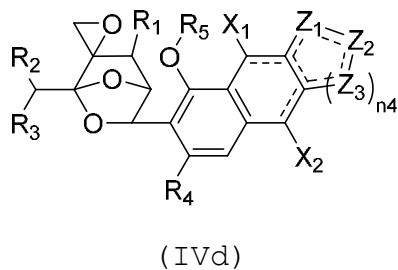


5

en donde: Y_5 , Y_6 , Y_7 , x y n_3 son como se define anteriormente;

A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la estructura:

10

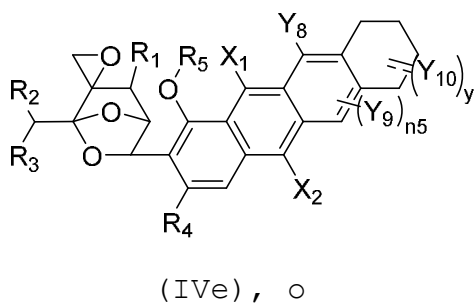


15

en donde: Z_1 , Z_2 , Z_3 y n_4 son como se define anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado con un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

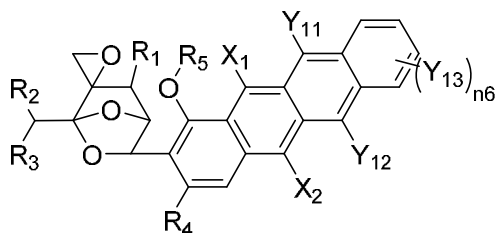
20



en donde: Y_8 , Y_9 y n_5 son como se define anteriormente;

25

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



(IVf)

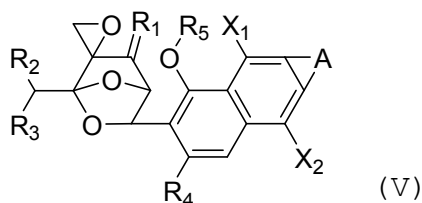
en donde: Y_{11} , Y_{12} , Y_{13} , y n_6 son como se define anteriormente,

o su sal.

202.- El método de conformidad con la reivindicación 201, caracterizado porque el agente de epoxidación es tetraóxido de osmio con cloruro de tosilo y una base.

203.- El método de conformidad con la reivindicación 202, caracterizado porque el tetraóxido de osmio se añade al compuesto y después de un período de tiempo de aproximadamente 1 hora a aproximadamente 24 horas, se añaden el cloruro de tosilo y la base.

204.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191-203, caracterizado porque el método comprende además hacer reaccionar el compuesto con un agente oxidante bajo condiciones suficientes para producir un compuesto de la fórmula:

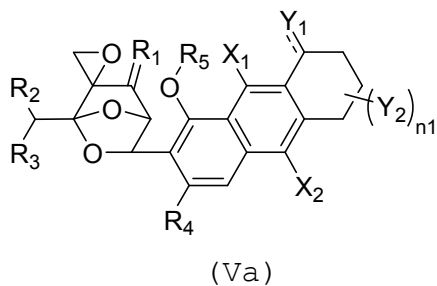


(V)

en donde: R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X_1 , y X_2 son como se define anteriormente;

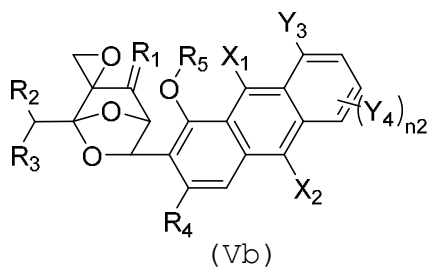
R_1 es O, S o NH; y

A es un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



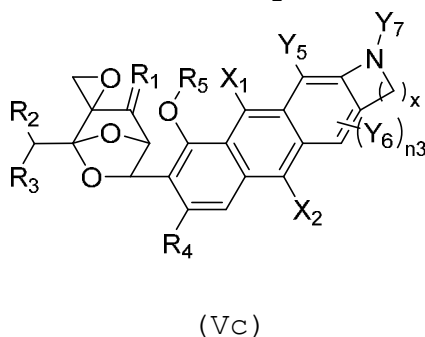
en donde: Y_1 , Y_2 , y n_1 son como se define anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



en donde: Y_3 , Y_4 , y n_2 son como se define anteriormente;

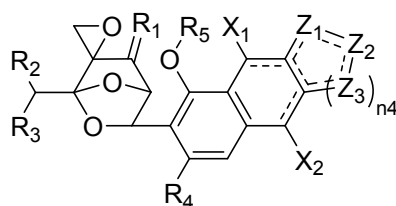
A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



en donde: Y_5 , Y_6 , Y_7 , x y n_3 son como se define anteriormente;

A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la estructura:

5



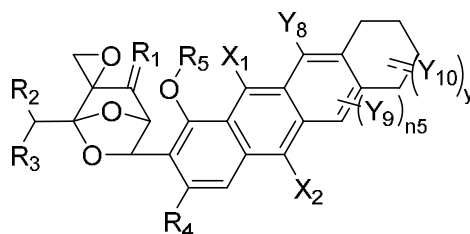
(Vd)

en donde: Z_1 , Z_2 , Z_3 y n_4 son como se define anteriormente;

10

A es un arenodiilo fusionado con un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

15

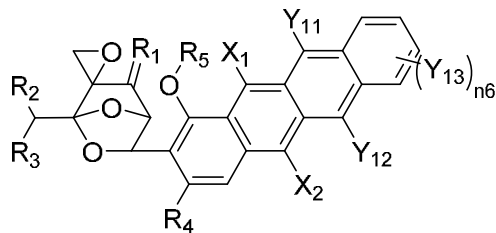


(Ve) o

en donde: Y_8 , Y_9 y n_5 son como se define anteriormente;

20

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



(Vf)

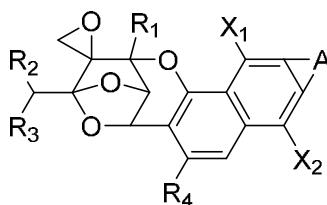
25

en donde: Y_{11} , Y_{12} , Y_{13} , y n_6 son como se define anteriormente;

o una sal del mismo.

205.- El método de conformidad con la
5 reivindicación 204, caracterizado porque el agente oxidante es perrutenato de tetrapropilamonio y N-óxido de N-metilmorfolina.

204.- El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 191-205, caracterizado porque el método
10 comprende además hacer reaccionar el compuesto con una fuente de fluoruro bajo condiciones suficientes para producir un compuesto de la fórmula:



(I)

en donde: R_2 , R_3 , R_4 , X_1 , y X_2 son como se define anteriormente;

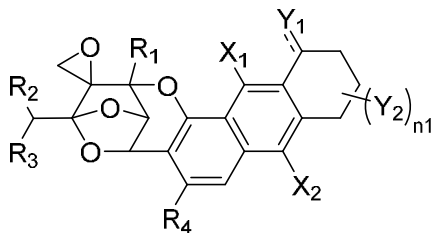
R_1 es amino, hidroxilo o mercapto;

20 alcoxi ($C \leq 12$), cicloalcoxi ($C \leq 12$), alquenciloxi ($C \leq 12$), alquenciloxi ($C \leq 12$), alquiltio ($C \leq 12$), cicloalquiltio ($C \leq 12$), alquenciltío ($C \leq 12$), alquenciltío ($C \leq 12$), alquilamino ($C \leq 12$), cicloalquilamino ($C \leq 12$), alquencilamino ($C \leq 12$), alquencilamino ($C \leq 12$), dialquilamino ($C \leq 12$), dicicloalquilamino ($C \leq 12$),
25 dialquencilamino ($C \leq 12$), dialquencilamino ($C \leq 12$), o una versión

sustituida de cualquiera de estos grupos;

A es un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

5

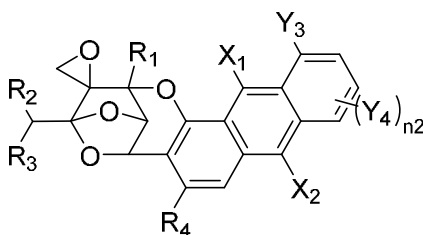


(Ia)

en donde: Y_1 , Y_2 y n_1 son como se define anteriormente;

10

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



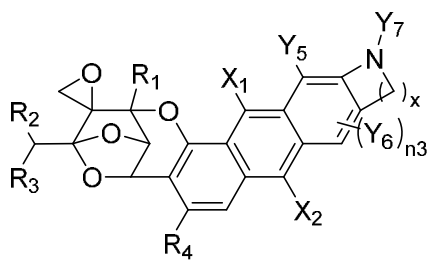
15

(Ib)

en donde: Y_3 , Y_4 y n_2 son como se define anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado con un heterocicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:

20



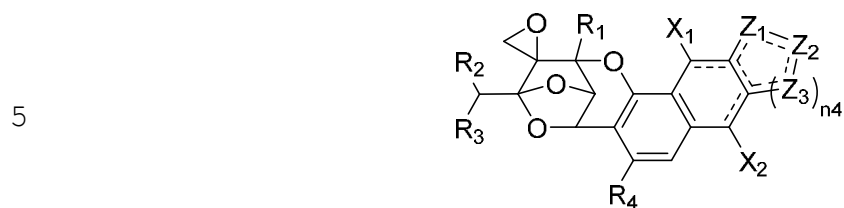
(Ic)

25

en donde: Y_5 , Y_6 , Y_7 , x y n_3 son como se define

anteriormente;

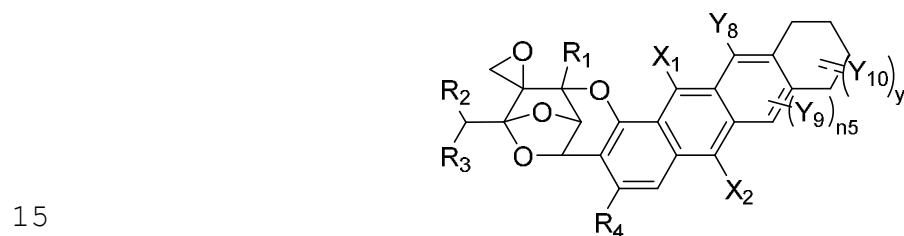
A es un heteroarenodiilo fusionado y tiene la estructura:



(Id)

en donde: Z_1 , Z_2 , Z_3 y n_4 son como se define anteriormente;

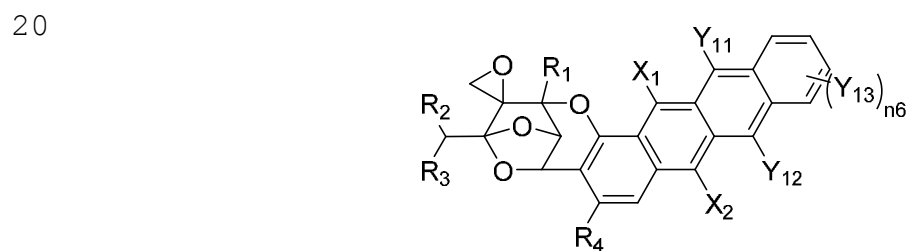
10 A es un arenodiilo fusionado con un cicloalcanodiilo fusionado y tiene la estructura:



(Ie)

en donde: Y_8 , Y_9 y n_5 son como se define anteriormente;

A es un arenodiilo fusionado y tiene la estructura:



(If)

25 en donde: Y_{11} , Y_{12} , Y_{13} , y n_6 son como se define

anteriormente;

o una sal del mismo.

207.- El método de conformidad con la
reivindicación 206, caracterizado porque la fuente de
5 fluoruro es $\text{Et}_3\text{N} \cdot 3\text{HF}$.

208.- El método de conformidad con cualquiera de
las reivindicaciones 191-207, caracterizado porque el método
comprende además una o más etapas de desprotección.

209.- Un conjugado de la fórmula:

10 $(\text{A-L})_n \text{X (VI)}$

en donde:

A es un compuesto de conformidad con cualquiera de
las reivindicaciones 1-181;

L es un enlace covalente o un enlazador;

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

X es un radical de direccionamiento celular.