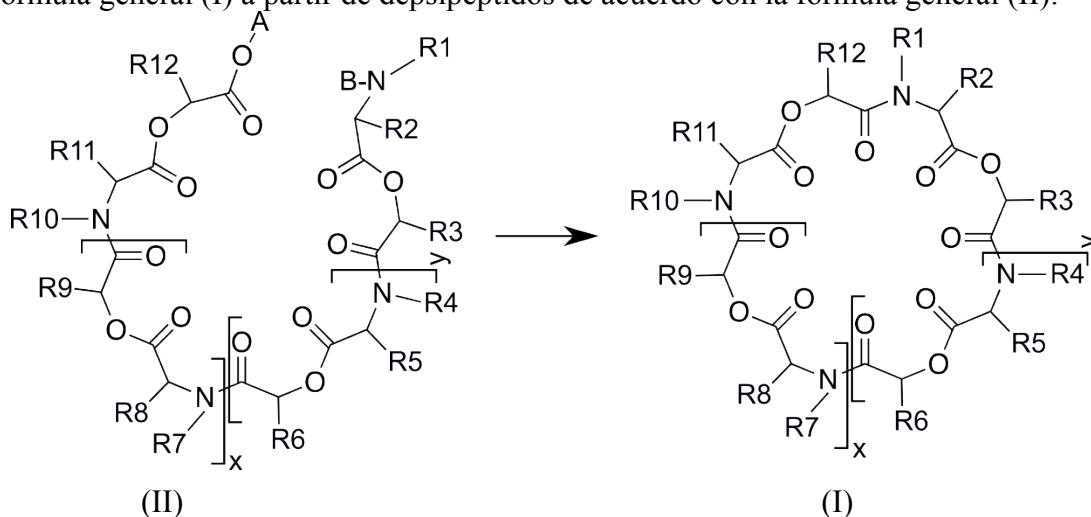


## REIVINDICACIONES

1.- Un método para la síntesis de depsipéptidos cíclicos de acuerdo con la fórmula general (I) a partir de depsipéptidos de acuerdo con la fórmula general (II):



donde B es un grupo protector amino y A es un grupo protector ácido carboxílico,

el método comprende las etapas de:

- desproteger el grupo amino que se protege por el grupo B, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
- desproteger el ácido carboxílico que se protege por el grupo A, obteniendo así un grupo ácido carboxílico desprotegido;
- condensación de los grupos amino y ácido carboxílico desprotegidos, obteniendo así el depsipéptido cíclico (I)

por lo que x e y son, independientemente uno del otro, 0, 1 o 2 con la condición de que  $x+y \geq 1$  (preferentemente, x e y son 1) y R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R10, R11 y R12 cada uno, independientemente uno del otro, representan hidrógeno, alquilo-C1-C8 de cadena recta o ramificada, en particular, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, isopentilo, sec-pentilo, hexilo, isohexilo, sec-hexilo, heptilo, isoheptilo, sec-heptilo, terc-heptilo, octilo, isooctilo, sec-octilo, alquilo C1-C8 halogenado de cadena recta o ramificada, en particular, sec-butilo fluorinado, hidroxialquilo-C1-C6, en particular, hidroximetilo, 1-hidroxietilo, alcanoiilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, acetoximetilo, 1-acetoxietilo, alcoxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metoximetilo, 1-metoxietilo, aril-alquilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, benciloximetilo, 1-benciloxietilo, mercapto-alquilo-C1-C6, en particular, mercaptometilo, alquiltio-C1-C4-alquilo-C1-C6,

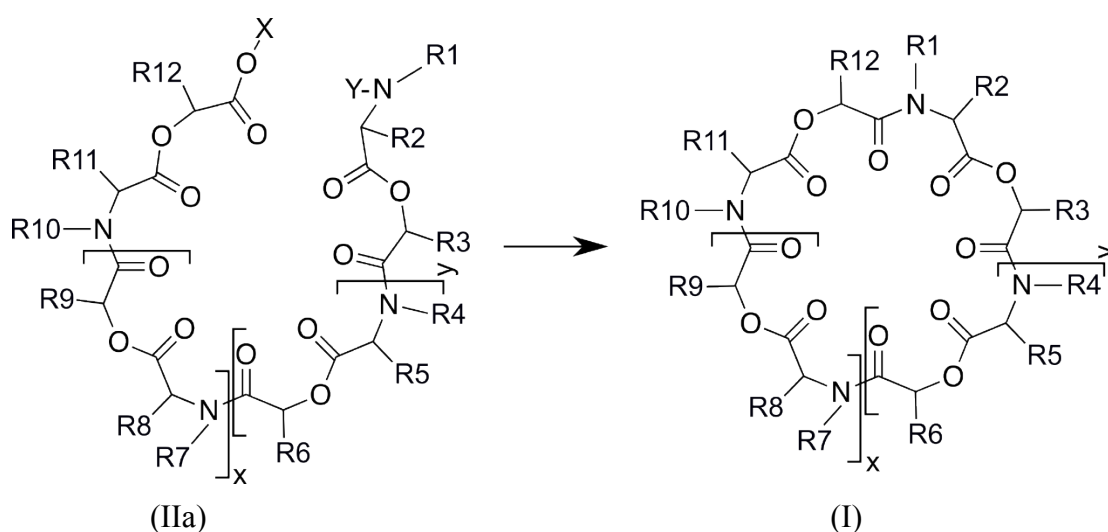
en particular, metiltioetilo, alquilsulfinilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metilsulfiniletilo, alquilsulfonilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metilsulfoniletilo, carboxi-alquilo-C1-C6, en particular, carboximetilo, carboxietilo, alcoxicarbonil-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metoxycarbonilmetilo, etoxycarboniletilo, 5 arilalcoxicarbonil-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, benciloxycarbonilmetilo, carbamoil-alquilo-C1-C6, en particular, carbamoilmetilo, carbamoiletilo, amino-alquilo-C1-C6, en particular, aminopropilo, aminobutilo, alquilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metilaminopropilo, metilaminobutilo, dialquilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, dimetilaminopropilo, dimetilaminobutilo, guanidino-alquilo-C1-C6, en 10 particular, guanidinopropilo, alcoxicarbonilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, terc-butoxicarbonilaminopropilo, terc-butoxicarbonilaminobutilo, 9-fluorenilmetoxycarbonil(Fmoc)amino-alquilo-C1-C6, en particular, 9-fluorenilmetoxycarbonil(Fmoc)aminopropilo, 9-fluorenilmetoxycarbonil(Fmoc)aminobutilo, alquenilo-C2-C8, en particular, vinilo, alilo, 15 butenilo, cicloalquilo-C3-C7, en particular, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, cicloalquilo-C3-C7-alquilo-C1-C4, en particular, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, cicloheptilmetilo, bencilo, bencilo sustituido, fenilo, fenil-alquilo-C1-C4, en particular, fenilmetilo que puede estar opcionalmente sustituido por radicales del grupo que consiste en halógeno, en particular, flúor, cloro, bromo o yodo

20

2.- El método de acuerdo con la reivindicación 1, donde x es 1, y es 1, R1, R4, R7 y R10 son metilo, R6 y R12 son metilo, R5 y R11 son, independientemente uno del otro, alquilo-C1-C4 de cadena recta o ramificada o alquilo-C1-C4 halogenado de cadena recta o ramificada y R3 y R9 son, independientemente uno del otro, bencilo o 25 bencilo sustituido.

3.- El método de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde R3 y/o R9 son bencilo sustituido con p-morfolino

30 4.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3, por lo que los depsipéptidos cíclicos de acuerdo con la fórmula general (1) se sintetizan de acuerdo con la fórmula general (2) a partir de depsipéptidos de acuerdo con la fórmula general (IIa):



donde Y un grupo protector amino y X es un grupo protector ácido carboxílico, el método comprende las etapas de:

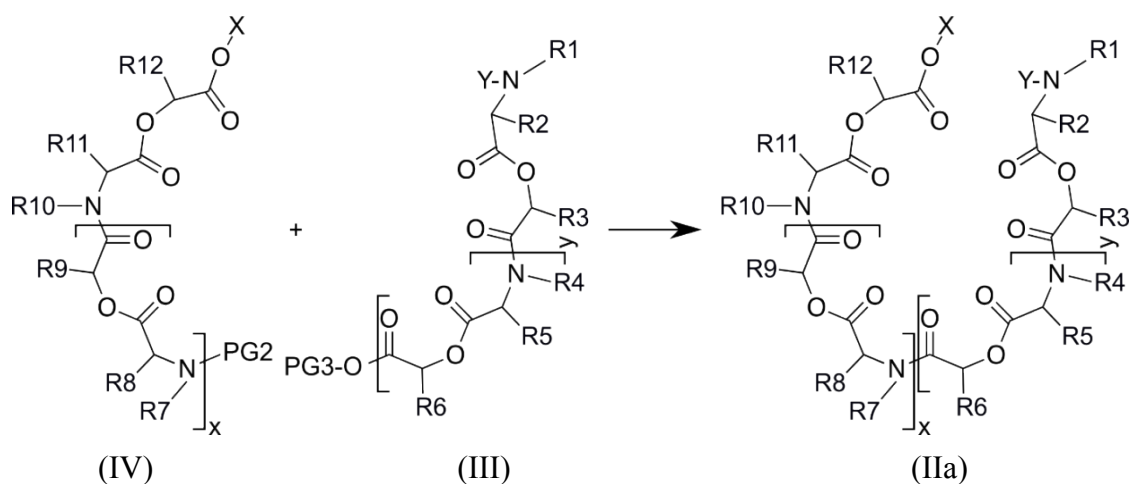
- 5        - desproteger el grupo amino que se protege por el grupo Y en presencia de un ácido, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
- desproteger el ácido carboxílico que se protege por el grupo X por hidrogenólisis, obteniendo así un grupo ácido carboxílico desprotegido;
- condensación de los grupos amino y ácido carboxílico desprotegidos,
- 10      obteniendo así el depsipéptido cíclico (I)

5.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, por lo que X es un grupo  $-\text{CH}_2\text{-Arilo}$  sustituido o insustituido.

15        6.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, por lo que X se selecciona del grupo benzoilo (Bn), 4-metoxi-benzoilo (PMB), 3,4-dimetoxibenzoilo (DPMB), 4-fenil-benzoilo (PPB), 2-naftilmetilo (Nap), Benciloximetil acetal (BOM)

20        7.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, por lo que Y es t.-Butiloxicarbonilo (BOC).

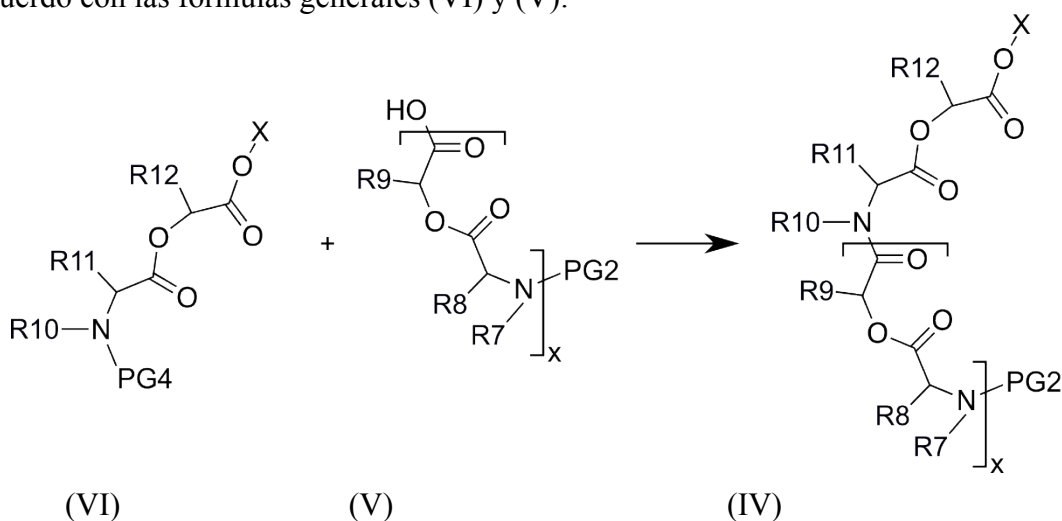
         8.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 7, donde el depsipéptido de acuerdo con la fórmula general (IIa) se obtiene a partir de precursores  
 25      de acuerdo con las fórmulas generales (IV) y (III):



por:

- en el precursor (IV), desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG2 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
  - en el precursor (III), desproteger el ácido carboxílico que se protege por el grupo PG3 en presencia de un ácido, obteniendo así un grupo ácido carboxílico desprotegido;
  - condensación de los grupos amino y ácido carboxílico desprotegidos, obteniendo así el depsipéptido (II);
- donde R1 a R12, X, Y, x, e y tienen un significado como se define en una de las reivindicaciones 1 a 4, PG2 es un grupo protector amino y PG3 es un grupo protector ácido carboxílico.

9.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (IV) se obtiene a partir de precursores de acuerdo con las fórmulas generales (VI) y (V):



por:

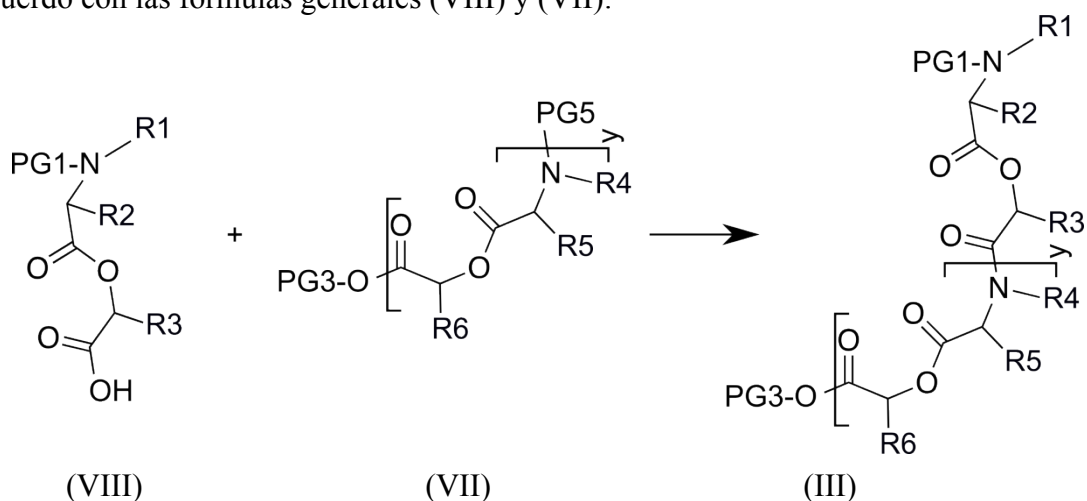
- en el precursor (VI), desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG4 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;

- condensación del grupo amino desprotegido del precursor (VI) y grupo ácido carboxílico del precursor (V), obteniendo así el precursor (IV);

5 donde R7 a R12, X y x tienen un significado como se define anteriormente (en particular, x puede ser 1), PG2 tiene un significado como se define anteriormente y PG4 es un grupo protector amino. Los métodos de desprotección y condensación pueden ser iguales que los señalados con relación a la reacción de compuestos (II) a (I) anteriormente.

10

10.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (III) se obtiene a partir de precursores de acuerdo con las fórmulas generales (VIII) y (VII):



15

por:

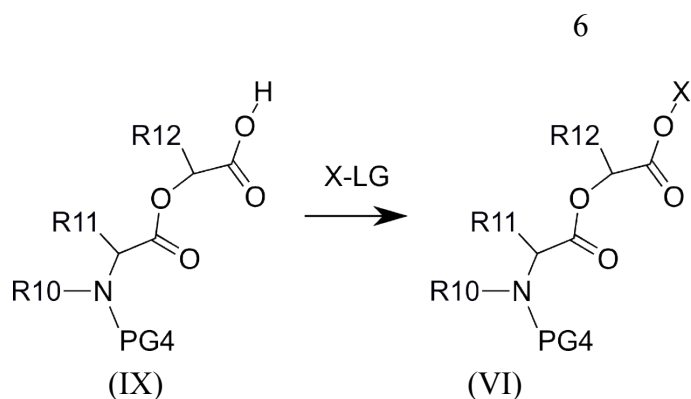
- en el precursor (VII), desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG5 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;

20 - condensación del grupo amino desprotegido del precursor (VII) y grupo ácido carboxílico del precursor (VIII), obteniendo así el precursor (III);

donde R1 a R6, PG1 e y tienen un significado como se define en una de las reivindicaciones 1 a 4, PG3 tiene un significado como se define en la reivindicación 4 y PG5 es un grupo protector amino.

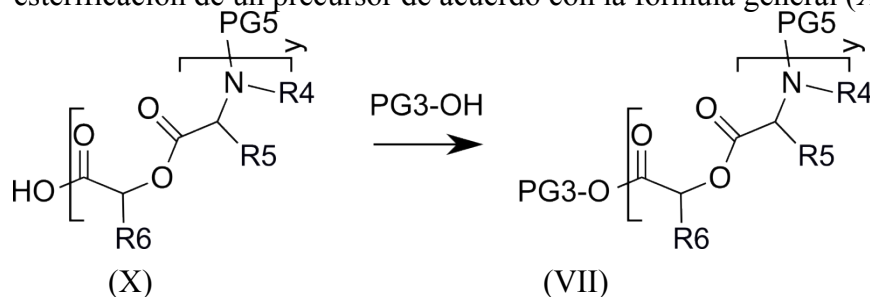
25

11.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (VI) se obtiene a partir de la esterificación de un precursor de acuerdo con la fórmula general (IX) con X-LG:



donde R10 a R12, y X tienen un significado como se define anteriormente y PG4 tiene un significado como se define anteriormente y LG es un grupo saliente.

12.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (VII) se obtiene a partir de la esterificación de un precursor de acuerdo con la fórmula general (X) con PG3-OH:



donde R4 a R6, e y tienen un significado como se define anteriormente, PG3 también tiene un significado como se define anteriormente y PG5 también tiene un significado como se define anteriormente

13.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 12, donde PG3 es X

14.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, donde los precursores (III) y (IV) son idénticos.

15.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, donde R3 y R9 son idénticos, R1 y R7 son idénticos, R2 y R8 son idénticos, R4 y R10 son idénticos, R5 y R11 son idénticos y R6 y R12 son idénticos.

16.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, que incluye el paso de síntesis de depsipéptidos cíclicos de acuerdo con la fórmula general (1) a partir de depsipéptidos de acuerdo con la fórmula general (IIb):

5 el método comprende las etapas de:

- desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG1 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
- desproteger el ácido carboxílico que se protege por el grupo TAG en presencia de un ácido, obteniendo así un grupo ácido carboxílico desprotegido;
- condensación de los grupos amino y ácido carboxílico desprotegidos, obteniendo así el depsipéptido cíclico (I);

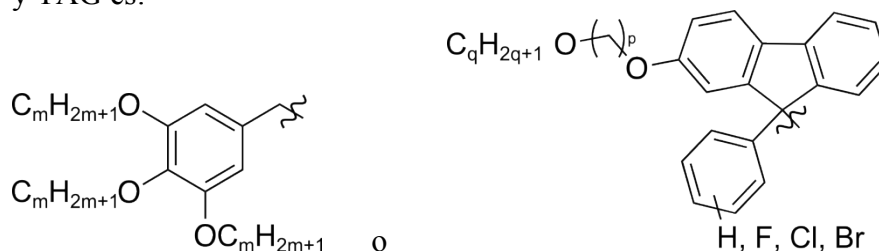
donde  $x$  e  $y$  son, independientemente uno del otro, 0, 1 o 2 con la condición de  
15      que  $x+y \geq 1$

y donde R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R10, R11 y R12 cada uno, independientemente uno del otro, representan hidrógeno, alquilo-C1-C8 de cadena recta o ramificada, alquilo-C1-C8 halogenado de cadena recta o ramificada, hidroxi-alquilo-C1-C6, alcanoiloxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, alcoxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, arilo-alquiloxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, mercapto-alquilo-C1-C6, alquiltio-C1-C4-alquilo-C1-C6, alquilsulfinilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, alquilsulfonilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, carboxi-alquilo-C1-C6, alcoxicarbonilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, arilalcoxicarbonilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, carbamoil-alquilo-C1-C6, amino-alquilo-C1-C6, alquilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, dialquilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, guanidino-alquilo-C1-C6, alcoxicarbonilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, terc-butoxicarbonilaminobutilo, 9-fluorenilmetoxycarbonil(Fmoc)amino-alquilo-C1-C6, alquenilo-C2-C8, cicloalquilo-C3-C7, cicloalquilo-C3-C7-alquilo-C1-C4, bencilo, bencilo sustituido, fenilo, fenil-alquilo-

C1-C4, hidroxilo, alcoxi-C1-C4 o alquilo-C1-C4.

17.- El método de acuerdo con la reivindicación 16, donde PG1 es 9-fluorenilmetoxycarbonilo (Fmoc), t-butil carbamato (Boc), bencil carbamato (Z), acetamida, trifluoroacetamida, ftalimida, bencilo (Bn), trifenilmetilo (Tr), bencilideno o p-toluenosulfonamida (Ts)

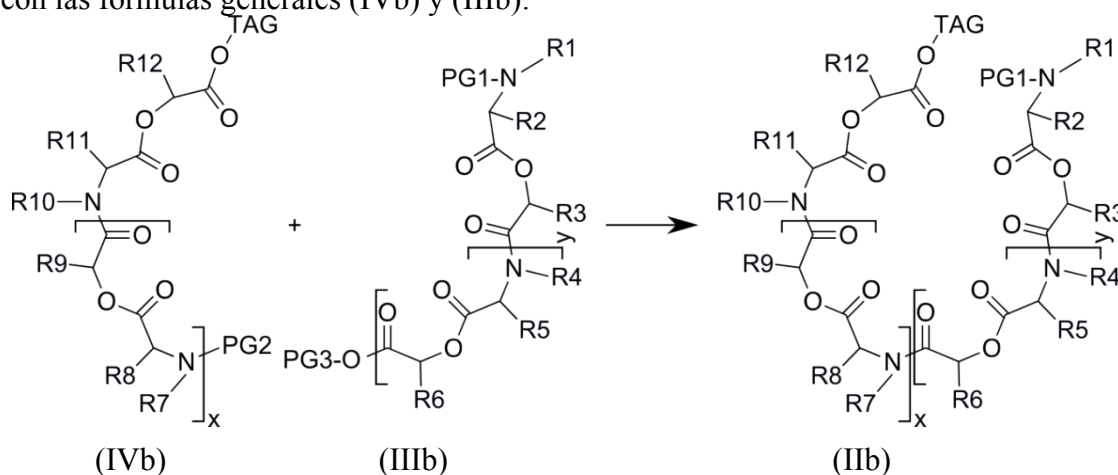
y TAG es:



donde m es  $\geq 15$  a  $\leq 25$ , p es  $\geq 8$  a  $\leq 18$  y q es  $\geq 15$  a  $\leq 25$ .

10

18.- El método de acuerdo con la reivindicación 16 o 17, donde el depsipéptido de acuerdo con la fórmula general (IIb) se obtiene a partir de precursores de acuerdo con las fórmulas generales (IVb) y (IIIb):



15

por:

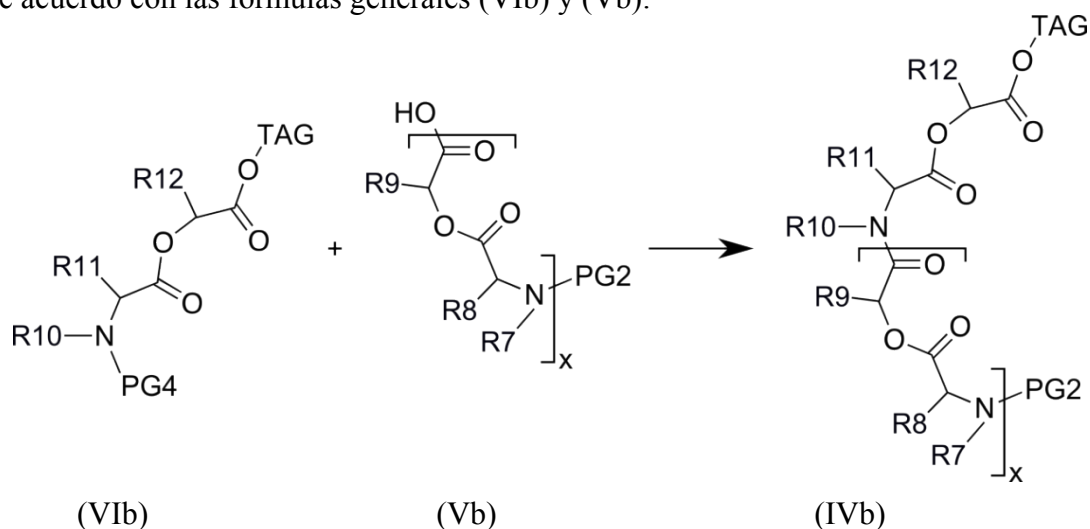
- en el precursor (IVb), desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG2 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
- en el precursor (IIIb), desproteger el ácido carboxílico que se protege por el grupo PG3 en presencia de un ácido, obteniendo así un grupo ácido carboxílico desprotegido;
- condensación de los grupos amino y ácido carboxílico desprotegidos, obteniendo así el depsipéptido (IIb);

20

donde R1 a R12, TAG, PG1, x, e y tienen un significado como se define en una

de las reivindicaciones 1 a 3, PG2 es un grupo protector amino y PG3 es un grupo protector ácido carboxílico.

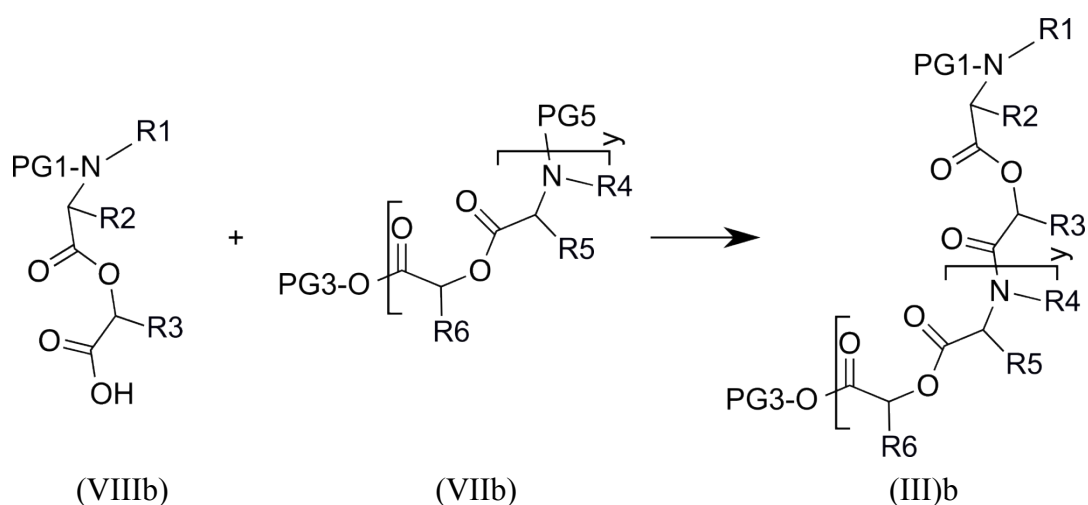
- 19.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 18, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (IVb) se obtiene a partir de precursores de acuerdo con las fórmulas generales (VIb) y (Vb):



por:

- en el precursor (VI), desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG4 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
  - condensación del grupo amino desprotegido del precursor (VI) y grupo ácido carboxílico del precursor (V), obteniendo así el precursor (IV);
- donde R7 a R12, TAG y x tienen un significado como se define en una de las reivindicaciones 1 a 18, PG2 tiene un significado como se define en la reivindicación 17 y PG4 es un grupo protector amino.

- 20.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 19, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (IIIb) se obtiene a partir de precursores de acuerdo con las fórmulas generales (VIIIb) y (VIIb):

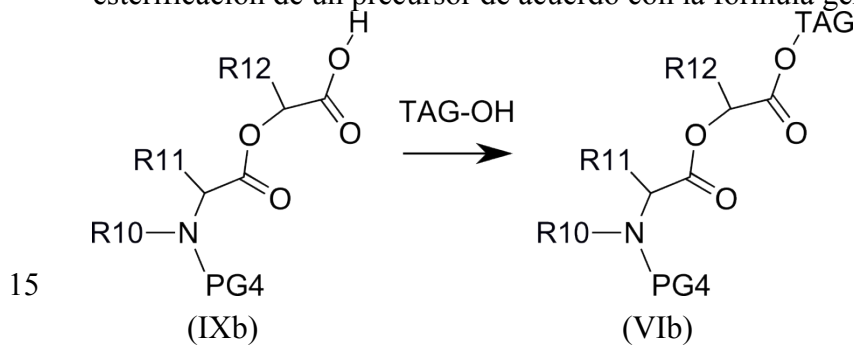


por:

- en el precursor (VIIb), desproteger el grupo amino que se protege por el grupo PG5 en presencia de una base, obteniendo así un grupo amino desprotegido;
- condensación del grupo amino desprotegido del precursor (VIIb) y grupo ácido carboxílico del precursor (VIIIb), obteniendo así el precursor (IIIb);

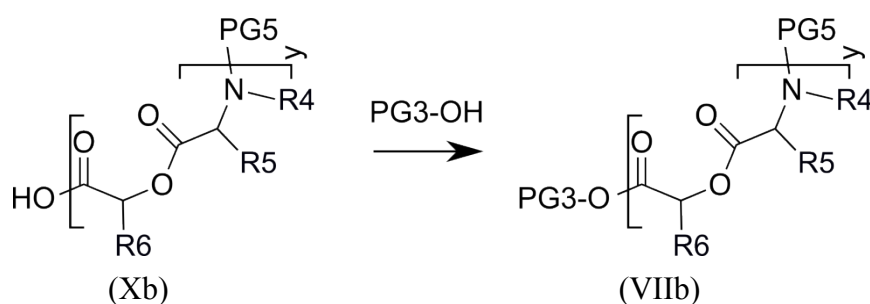
donde R1 a R6, PG1 e y tienen un significado como se define en una de las reivindicaciones 1 a 18, PG3 tiene un significado como se define en la reivindicación 17 y PG5 es un grupo protector amino.

21.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 20, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (VIb) se obtiene a partir de la esterificación de un precursor de acuerdo con la fórmula general (IXb) con TAG-OH:



donde R10 a R12 y TAG tienen un significado como se define en una de las reivindicaciones 1 a 18 y PG4 tiene un significado como se define en la reivindicación 17.

22.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 21, donde el precursor de acuerdo con la fórmula general (VIIb) se obtiene a partir de la esterificación de un precursor de acuerdo con la fórmula general (Xb) con PG3-OH:



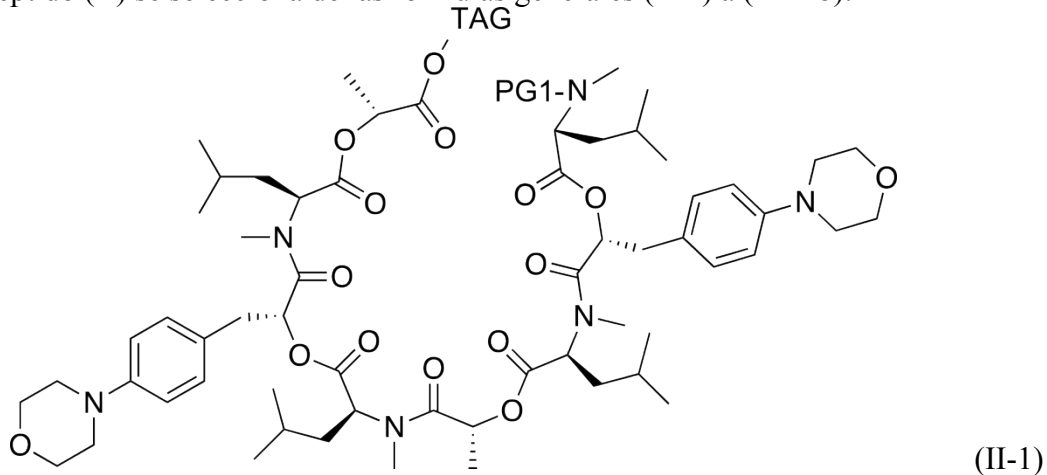
donde R4 a R6 e y tienen un significado como se define en una de las reivindicaciones 1 a 20, PG3 tiene un significado como se define en la reivindicación 17 y PG5 tiene un significado como se define en la reivindicación 19.

23.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 16 a 22, donde PG3 es TAG como se define en cualquiera de las reivindicaciones 16 a 22.

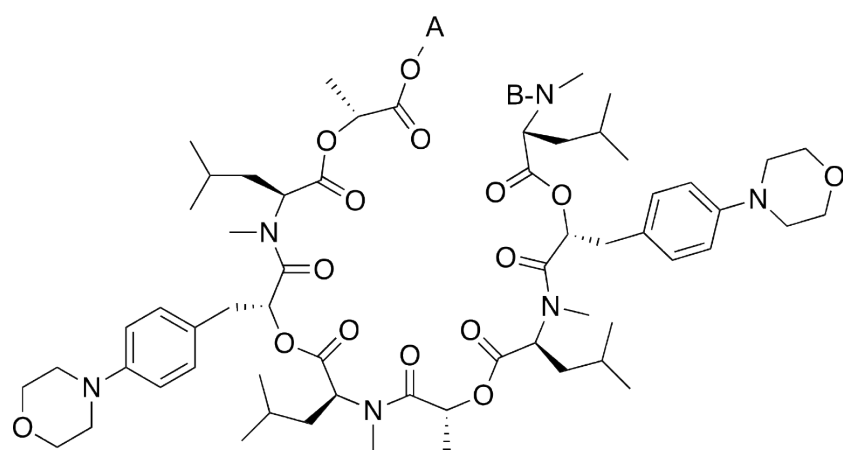
24.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 16 a 23, donde al menos un paso de reacción de los pasos de reacción que resultan en una molécula con TAG es seguido por la precipitación de producto de reacción bruto en metanol, purificando así el producto de reacción bruto.

25.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 16 a 23, donde al menos un paso de los pasos de reacción donde los grupos de ácido carboxílico protegidos por TAG se desprotegen es seguido por la precipitación de TAG-OH escindido en metanol y remoción del precipitado por filtración, purificando así el producto de reacción bruto.

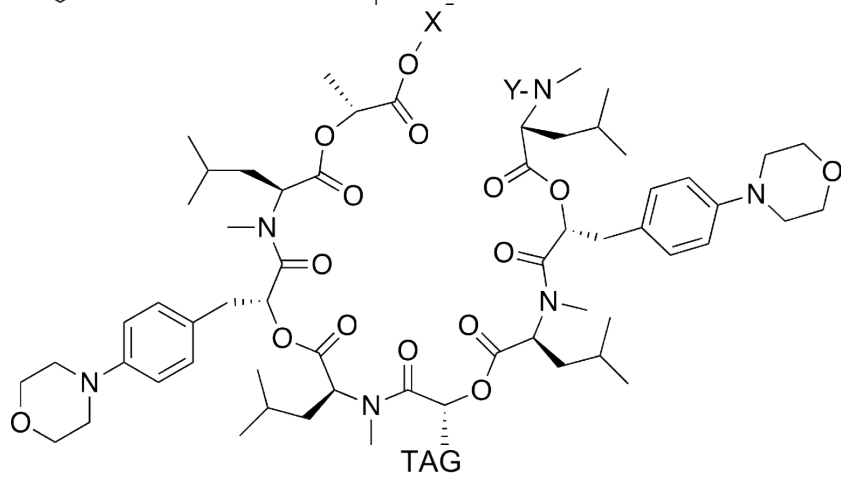
26.- El método de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 25, donde el depsipéptido (II) se selecciona de las fórmulas generales (II-1) a (II-14b):



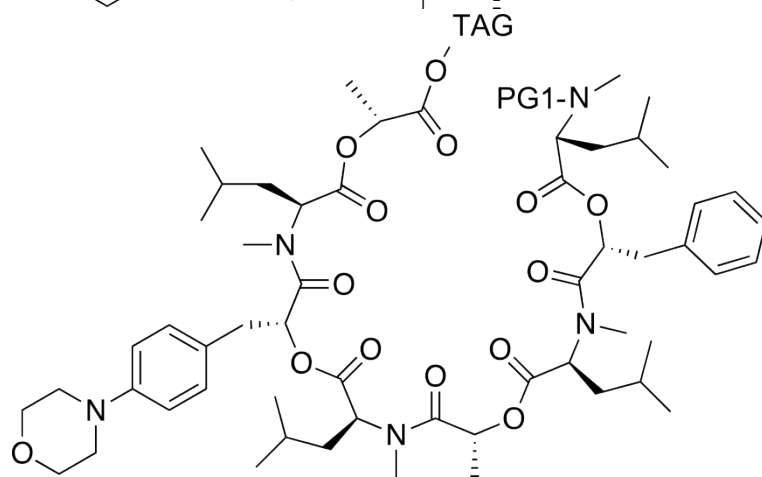
12



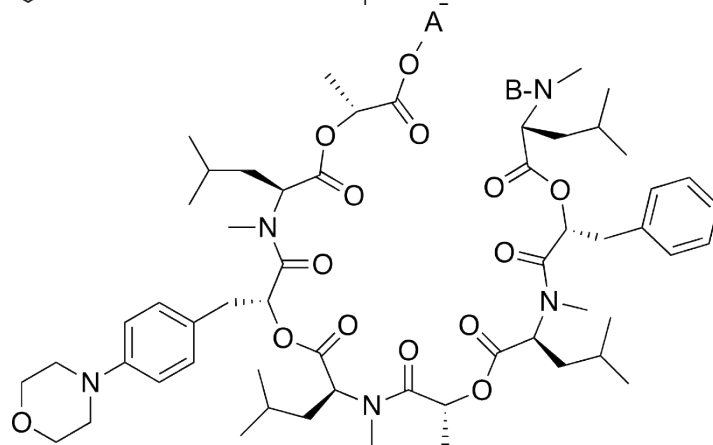
(II- 1a)



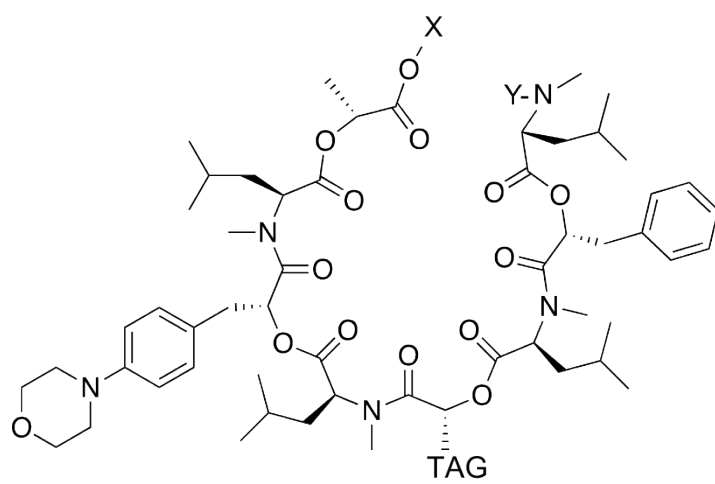
(II- 1b)



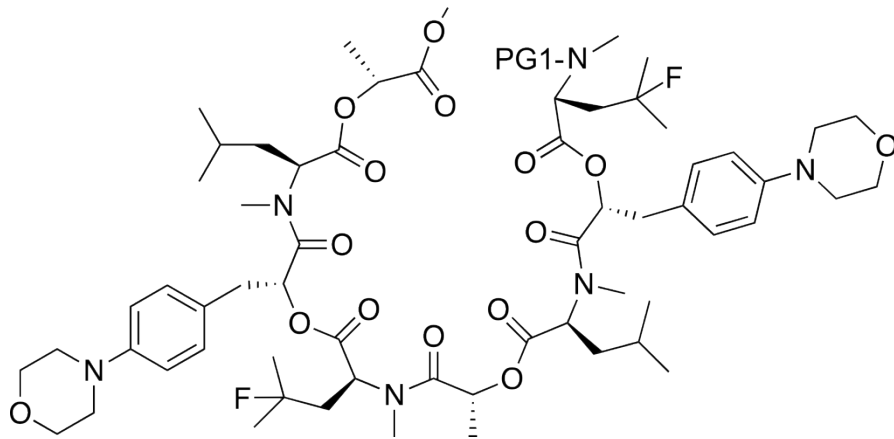
(II-2)



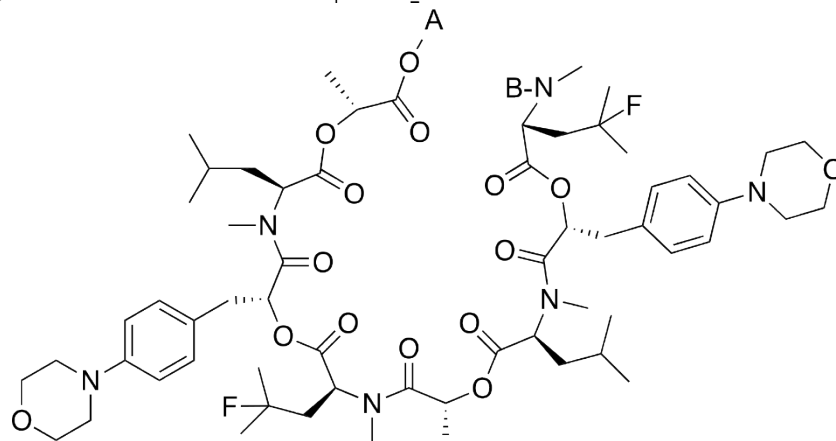
(II-2a)



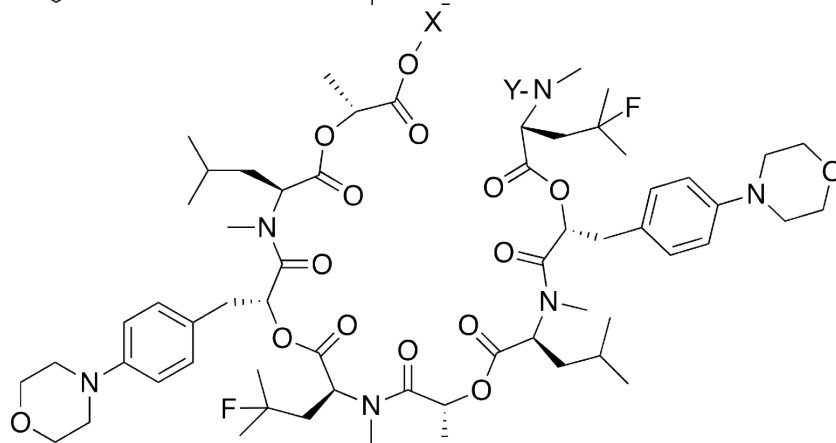
(II- 2b)



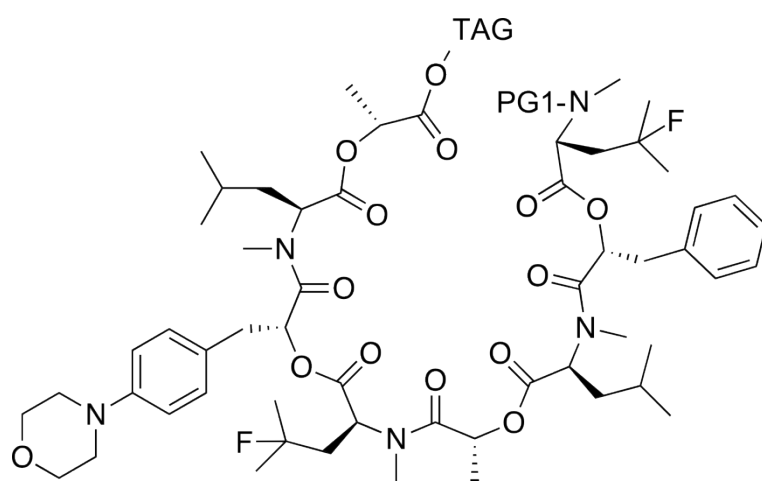
(II-3)



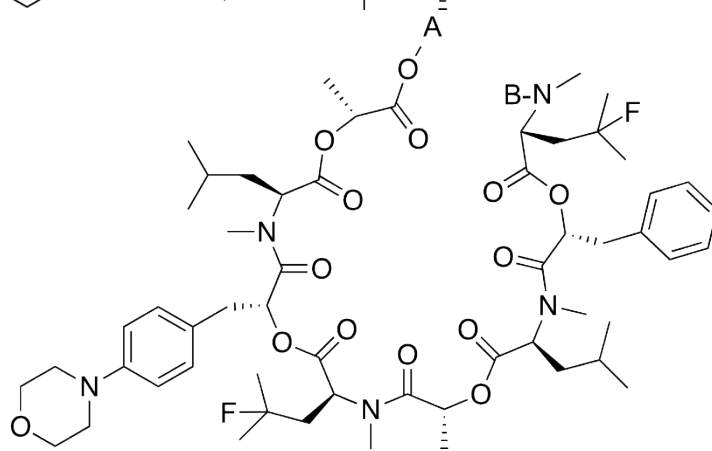
(II-3a)



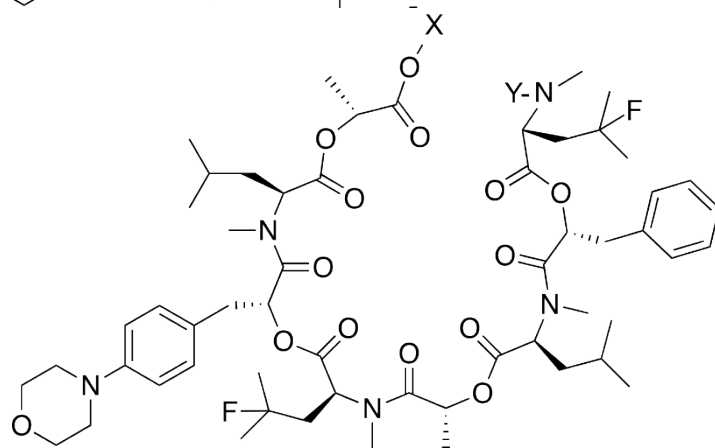
(II-3b)



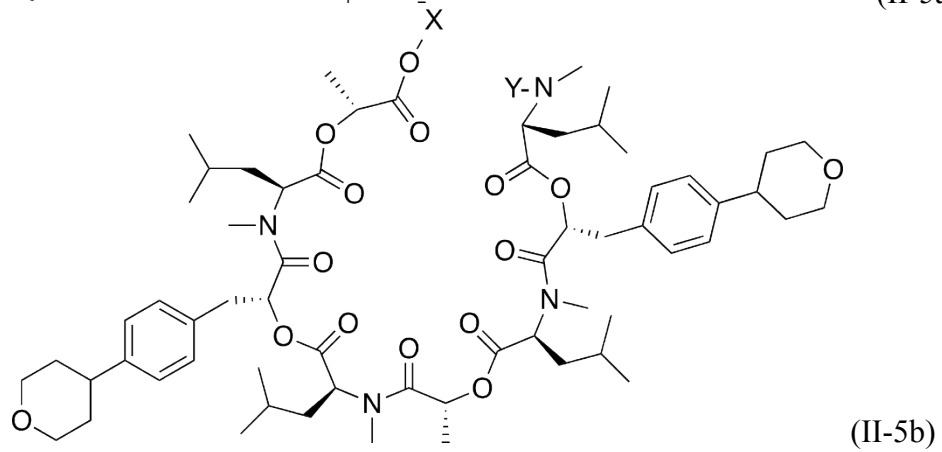
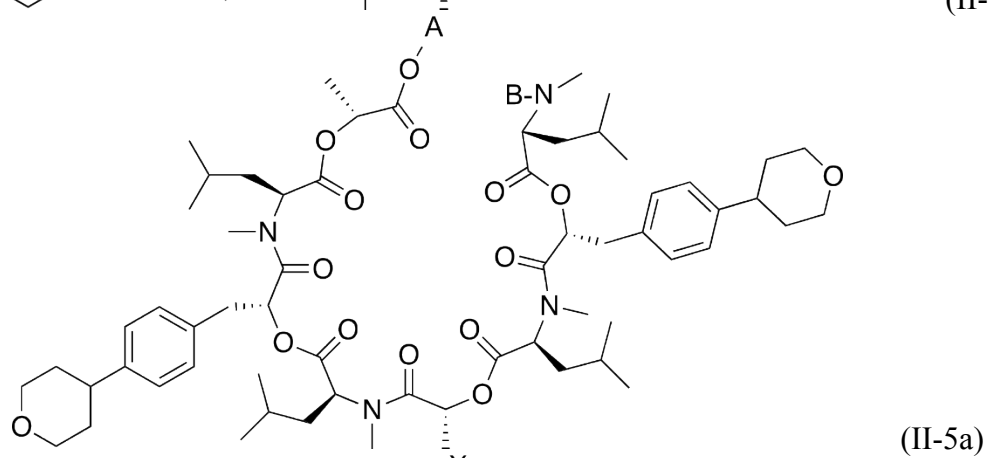
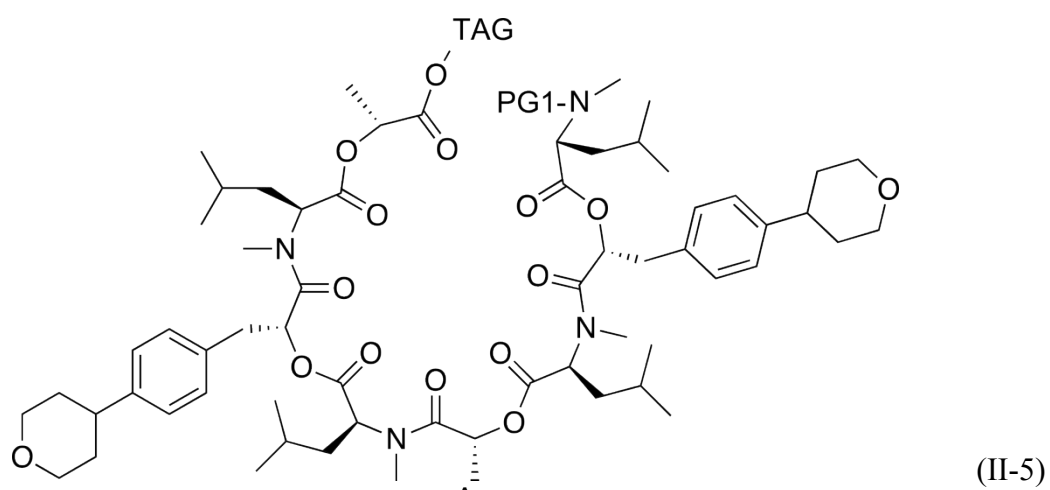
(II-4)

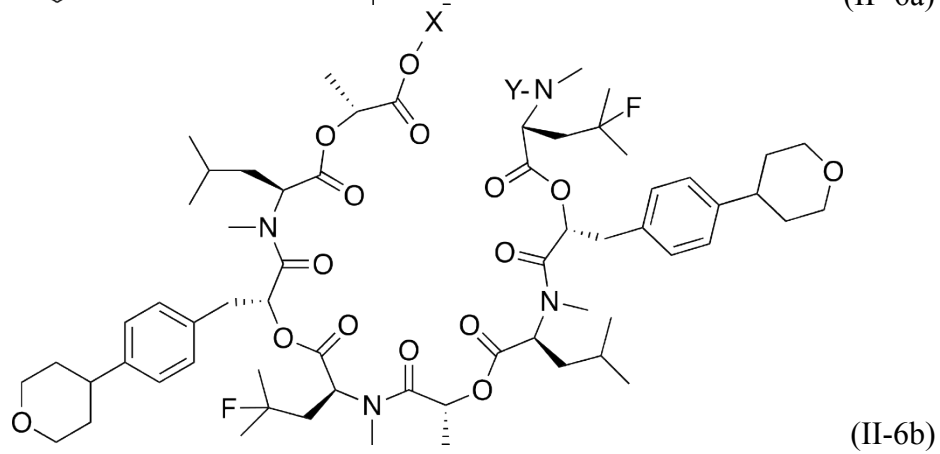
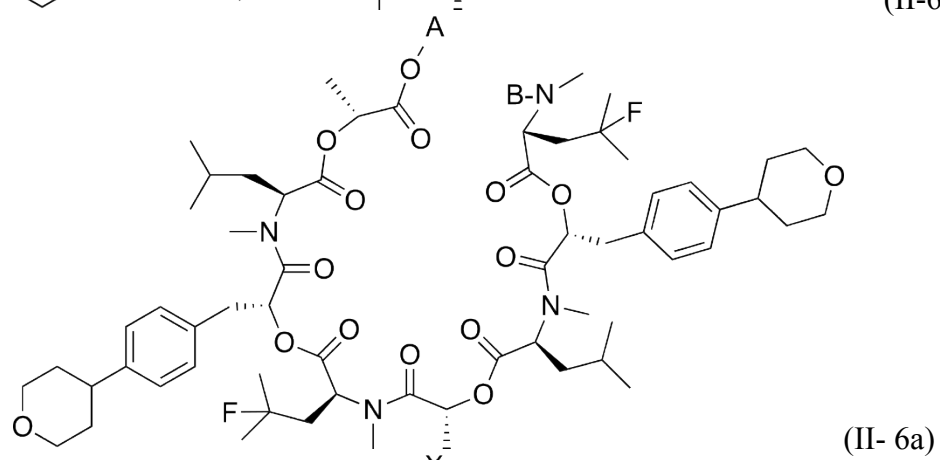
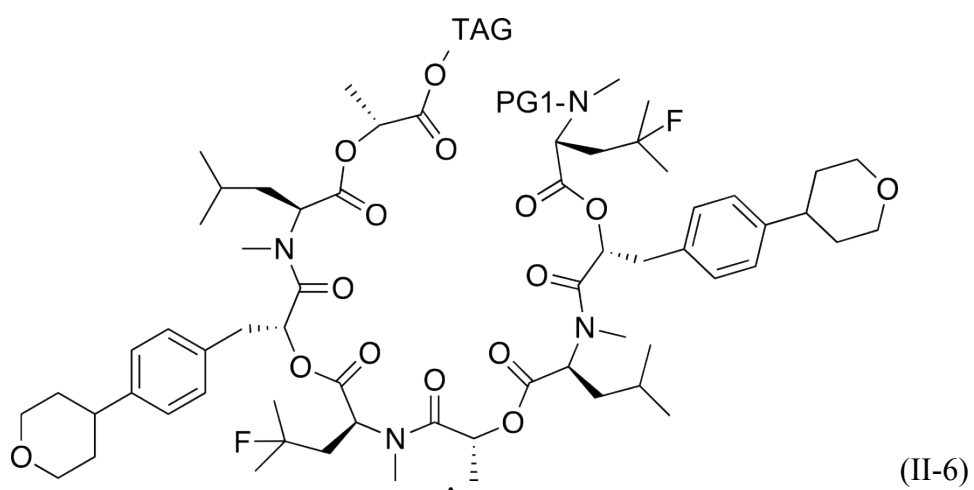


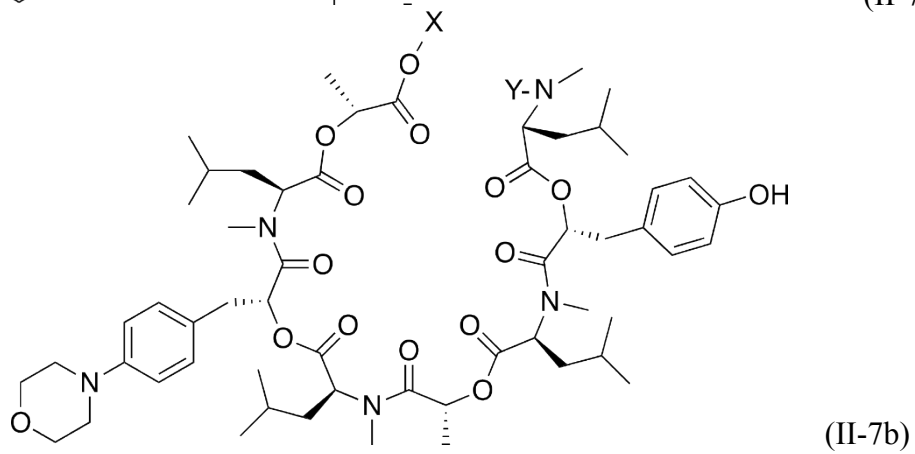
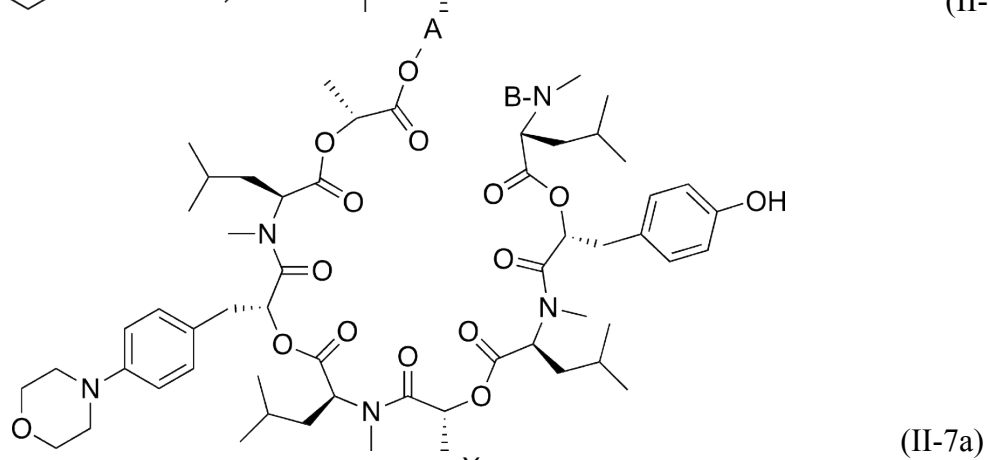
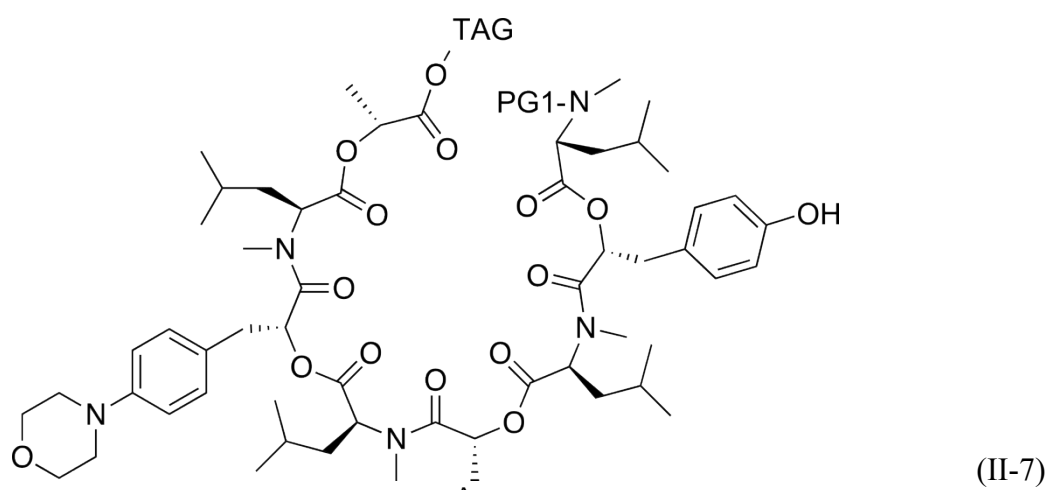
(II-4a)

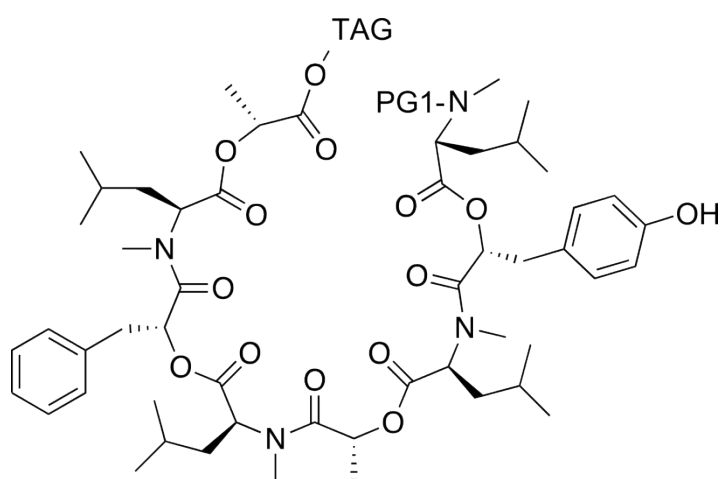


(II-4b)

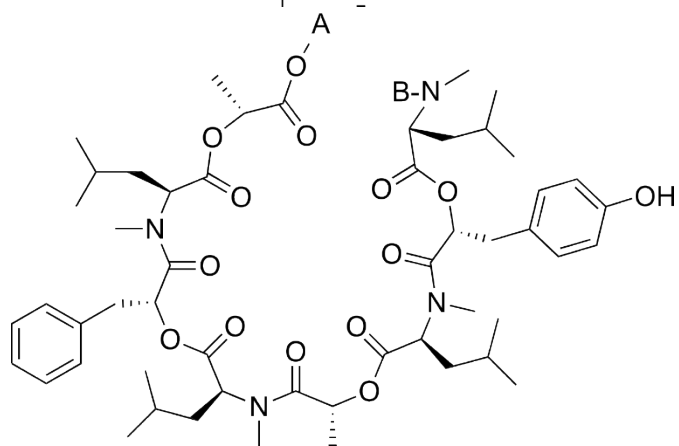




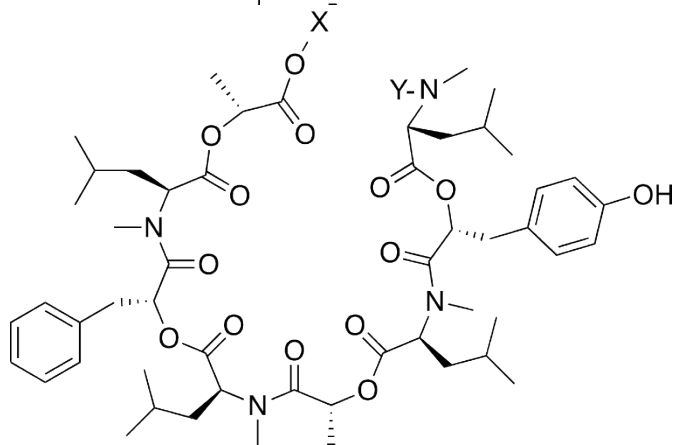




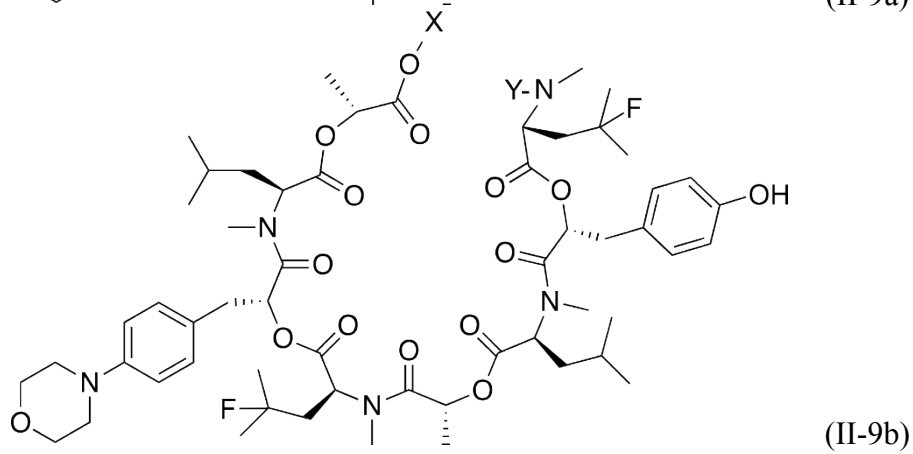
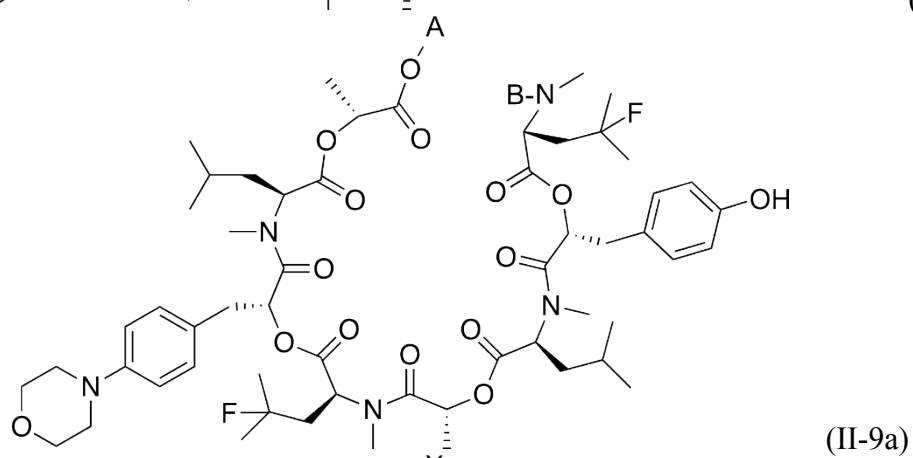
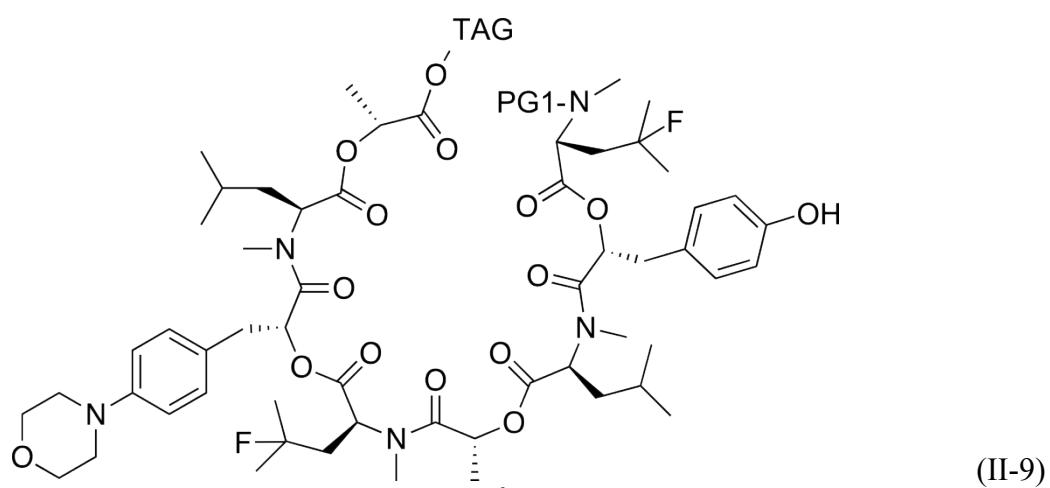
(II-8)

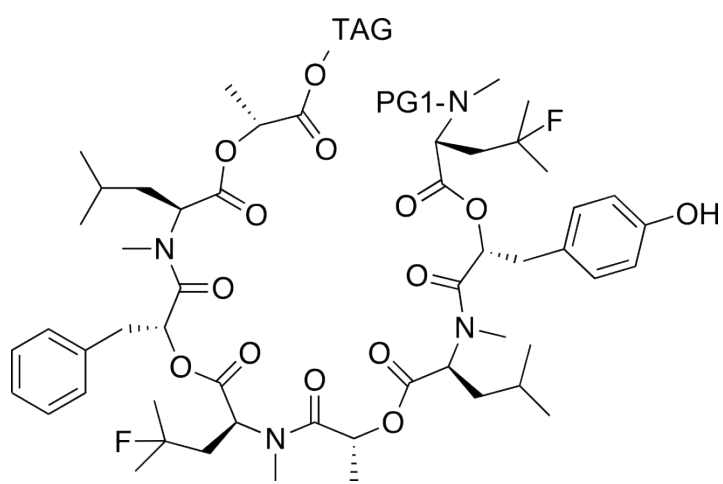


(II-8a)

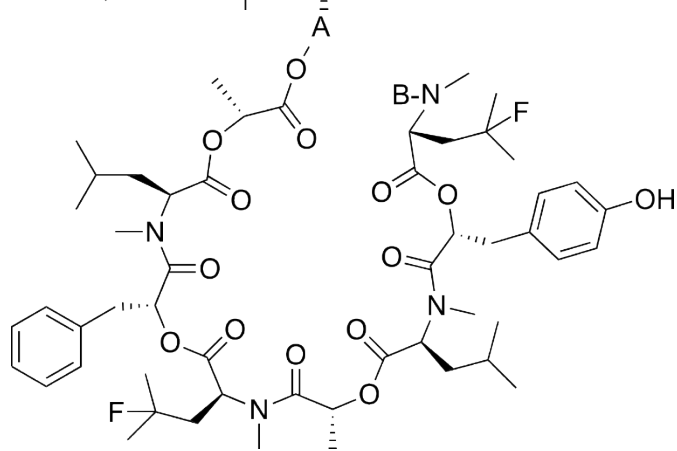


(II-8b)

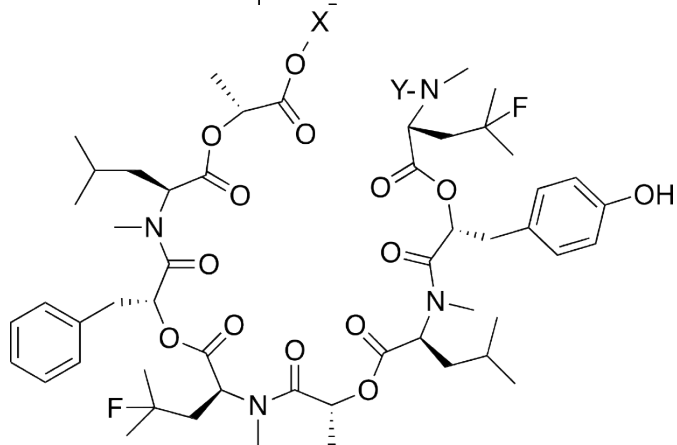




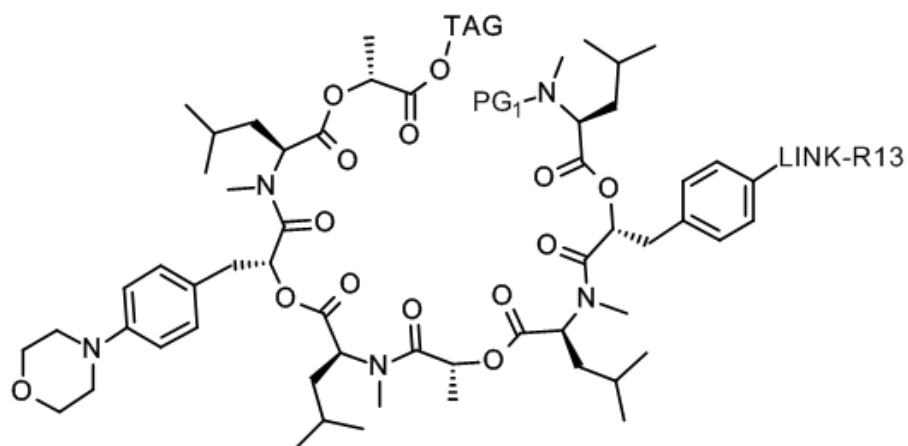
(II-10)



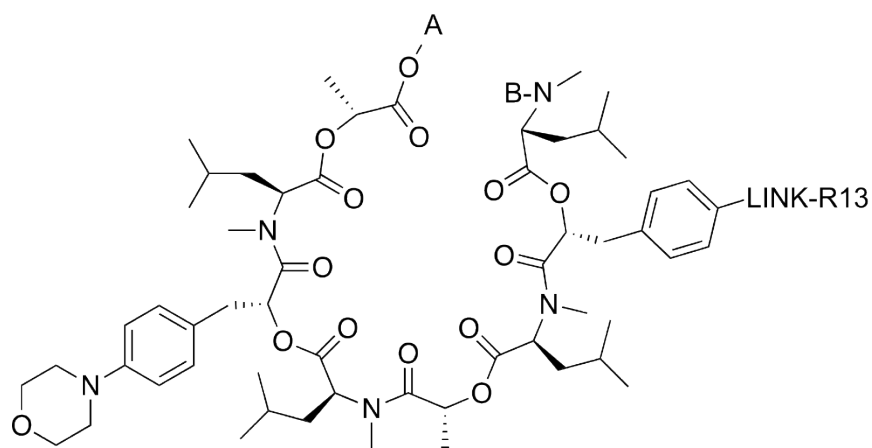
(II-10a)



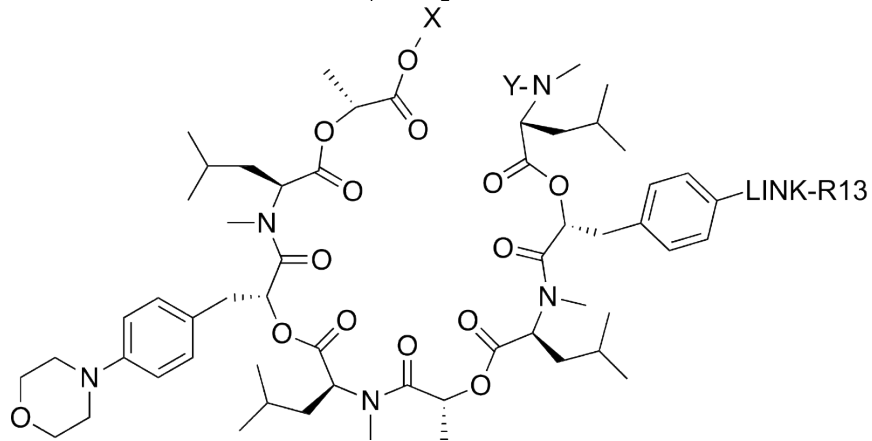
(II-10b)



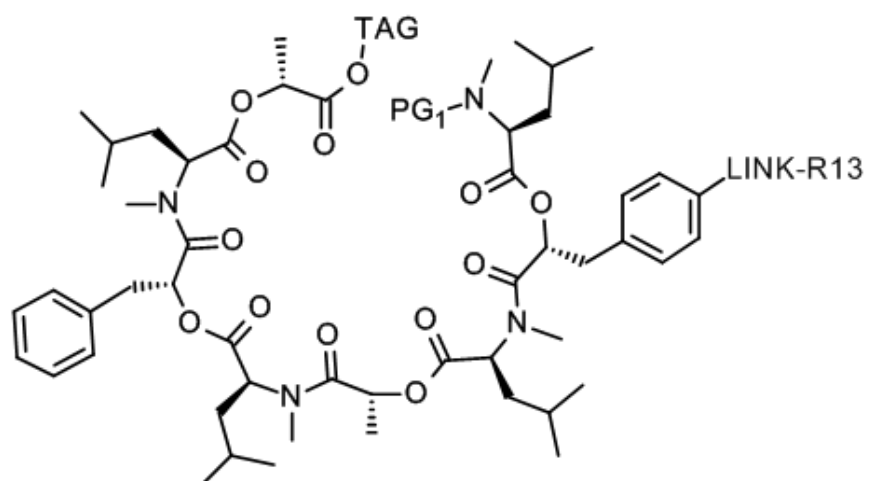
(II-11)



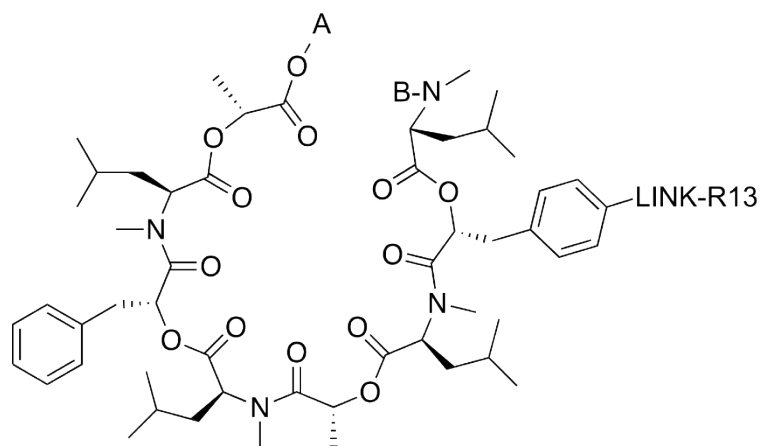
(II-11a)



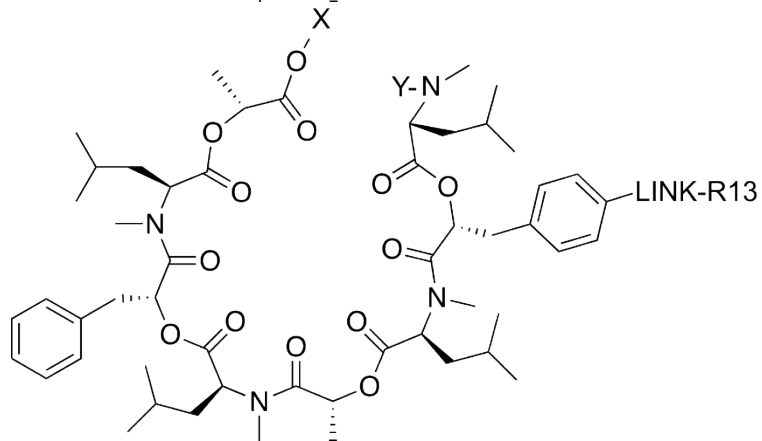
(II-11b)



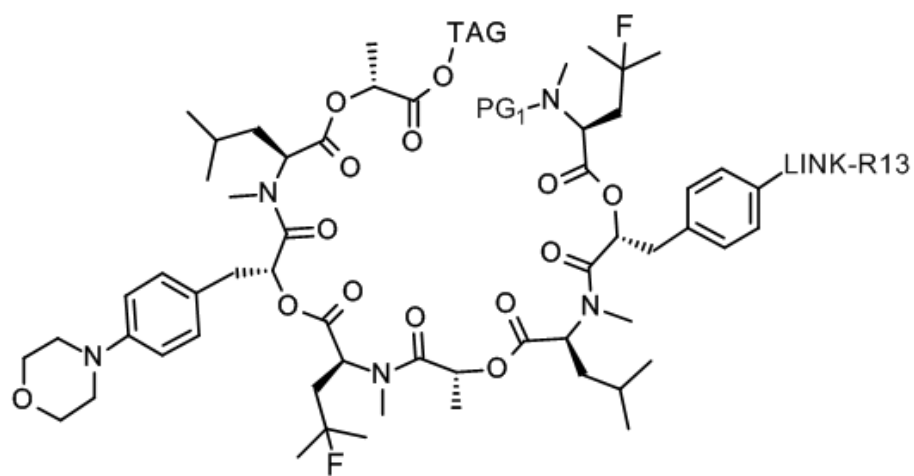
(II-12)



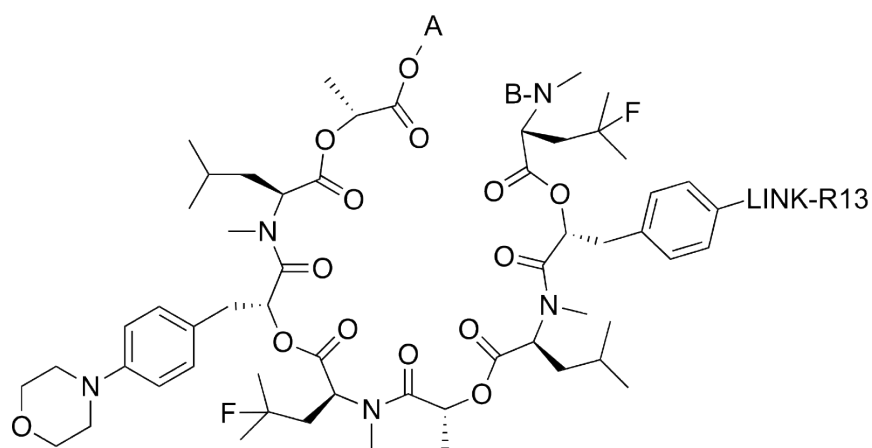
(II-12a)



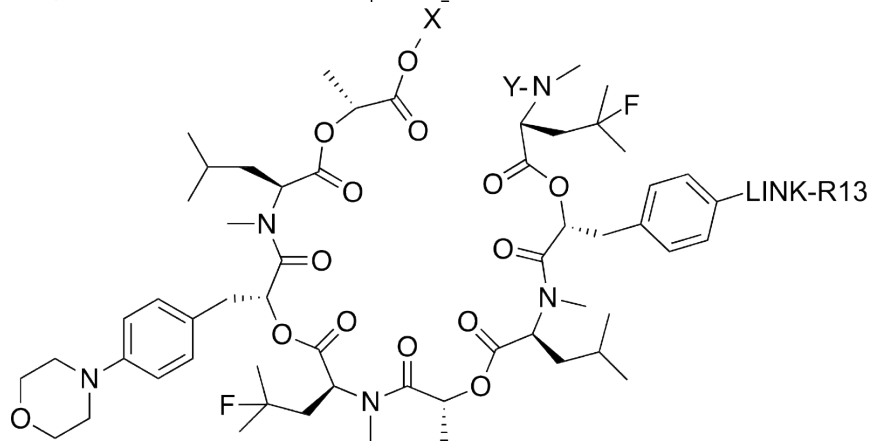
(II-12b)



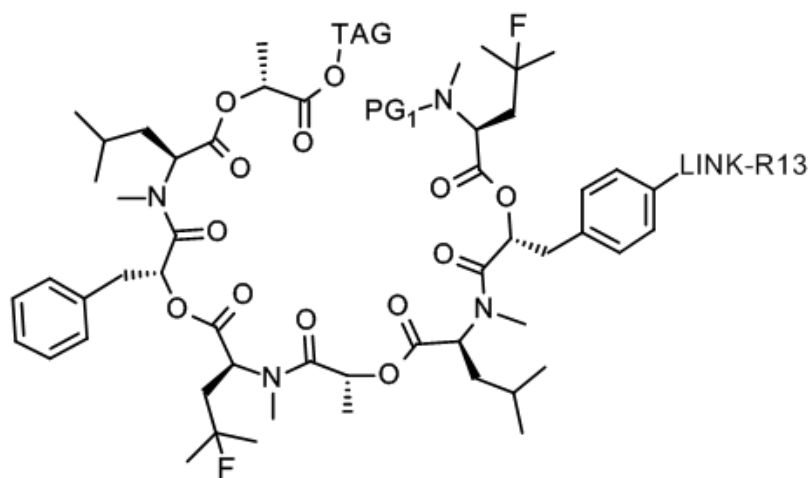
(II-13)



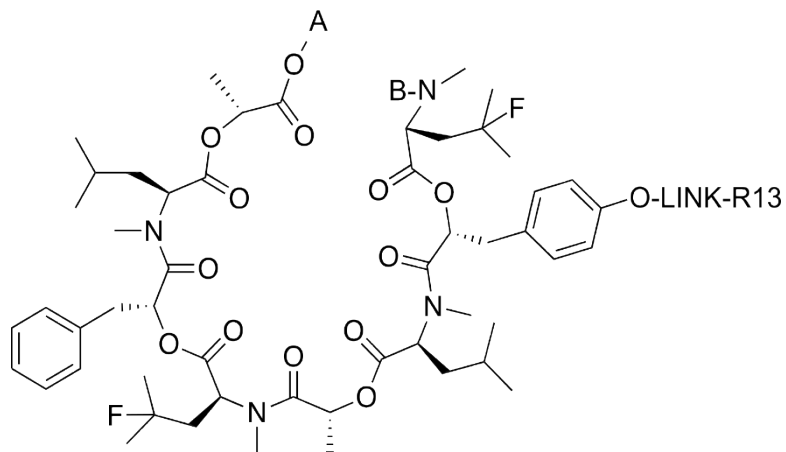
(II-13a)



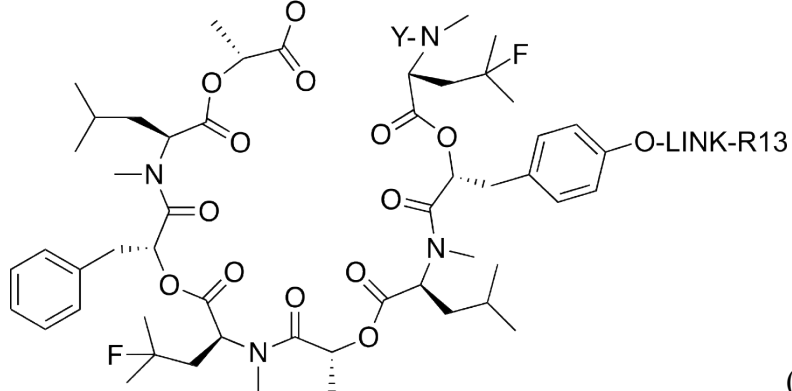
(II-13b)



(II-14)

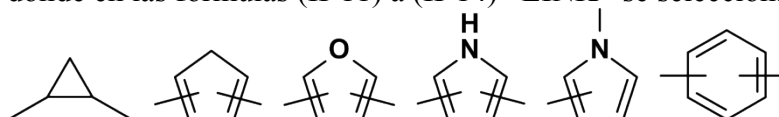


(II-14a)



(II-14b)

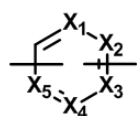
donde en las fórmulas (II-11) a (II-14) -LINK- se selecciona de:



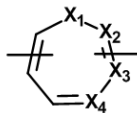
5



donde X1 puede ser C, N, S, O, X2 y X3 puede ser C o N;

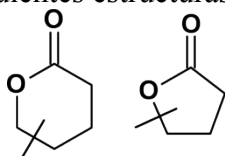


donde X1 puede ser C, N, S, O, X2, X3 y X4 puede ser C o N;



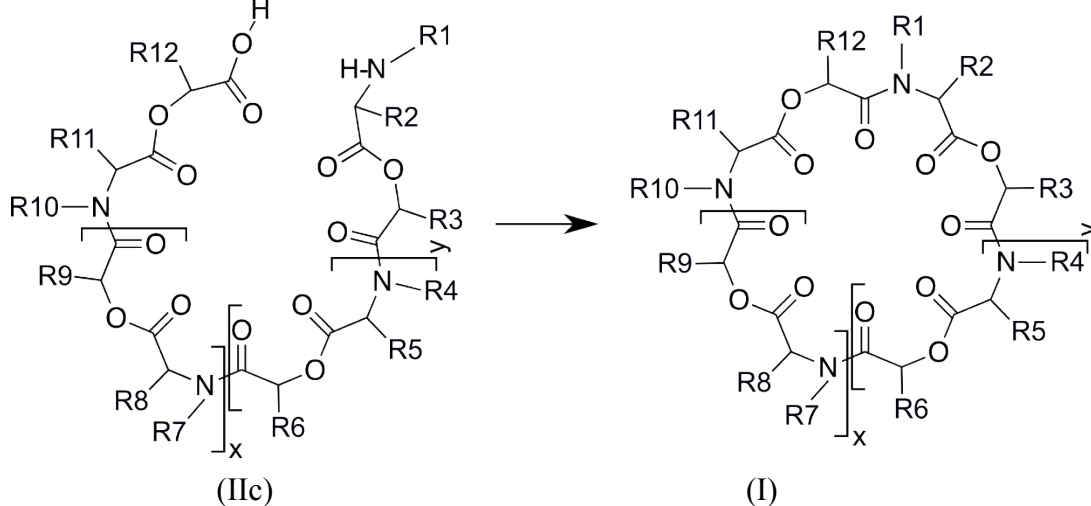
donde X1, X2, X3 y X4 pueden ser C o N;

y donde R13 se selecciona de  $\text{SO}_2\text{NH}(\text{CH}_3)$ ,  $\text{SO}_2\text{NH}_2$ ,  $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ ,  $\text{CF}_3$  o una de las siguientes estructuras de lactona:



5

27.- Un método para la síntesis de depsipéptidos cíclicos de acuerdo con la fórmula general (I) a partir de depsipéptidos de acuerdo con la fórmula general (IIc):



10

que comprende los pasos de

- proveer una mezcla de compuesto (IIc) y una base en un solvente que tiene un valor  $E_T(30)$  de  $\geq 30$  y  $\leq 43$

- lento, preferentemente adición gota a gota de una solución de un agente de acoplamiento en el solvente para formar el depsipéptido cíclico (I)

15

por lo que x e y son, independientemente uno del otro, 0, 1 o 2 con la condición de que  $x+y \geq 1$  (preferentemente, x e y son 1) y R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R10, R11 y R12 cada uno, independientemente uno del otro, representan hidrógeno, alquilo-C1-C8 de cadena recta o ramificada, en particular, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, isopentilo, sec-pentilo, hexilo, isohexilo, sec-hexilo, heptilo, isoheptilo, sec-heptilo, terc-heptilo, octilo, isoctilo, sec-octilo, alquilo C1-C8 halogenado de cadena recta o ramificada, en

20

particular, sec-butilo fluorinado, hidroxil-alquilo-C1-C6, en particular, hidroximetilo, 1-hidroxietilo, alcanoiloxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, acetoximetilo, 1-acetoxietilo, alcoxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metoximetilo, 1-metoxietilo, aril-alquiloxi-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, benciloximetilo, 1-benciloxietilo, 5 mercapto-alquilo-C1-C6, en particular, mercaptometilo, alquiltio-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metiltioetilo, alquilsulfinilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metilsulfiniletilo, alquilsulfonilo-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metilsulfoniletilo, carboxi-alquilo-C1-C6, en particular, carboximetilo, carboxietilo, alcoxicarbonil-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metoxicarbonilmetilo, etoxicarboniletilo, 10 arilalcoxicarbonil-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, benciloxicarbonilmetilo, carbamoil-alquilo-C1-C6, en particular, carbamoilmetilo, carbamoiletilo, amino-alquilo-C1-C6, en particular, aminopropilo, aminobutilo, alquilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, metilaminopropilo, metilaminobutilo, dialquilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, dimetilaminopropilo, dimetilaminobutilo, guanidino-alquilo-C1-C6, en particular, guanidinopropilo, alcoxicarbonilamino-C1-C4-alquilo-C1-C6, en particular, 15 terc-butoxicarbonilaminopropilo, terc-butoxicarbonilaminobutilo, 9-fluorenilmetoxicarbonil(Fmoc)amino-alquilo-C1-C6, en particular, 9-fluorenilmetoxicarbonil(Fmoc)aminopropilo, 9-fluorenilmetoxicarbonil(Fmoc)aminobutilo, alquenilo-C2-C8, en particular, vinilo, alilo, 20 butenilo, cicloalquilo-C3-C7, en particular, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, cicloalquilo-C3-C7-alquilo-C1-C4, en particular, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, cicloheptilmetilo, bencilo, bencilo sustituido, fenilo, fenil-alquilo-C1-C4, en particular, fenilmetilo que puede estar opcionalmente sustituido por radicales del grupo que consiste en halógeno, en particular, flúor, cloro, bromo o yodo.

25

28.- El método de acuerdo con la Reivindicación 27, por lo que el valor  $E_T(30)$  del solvente es  $\geq 34$  y  $\leq 39$ .

29.- El método de acuerdo con la Reivindicación 27 o 28 por lo que la adición de 30 la solución del agente de acoplamiento es a una tasa de  $\leq 2$  (mol)-% por minuto

30.- El método de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 27 a 29, por lo que el agente de acoplamiento se selecciona de PyBOP (benzotriazol-1-il-oxitripirrolidinofosfonio hexafluorofosfato), BOP ((Benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio hexafluorofosfato), DEPBT (3-(dietoxifosforiloxi)- 35

1,2,3-benzotriazin-4(3H)-ona), HATU (1-[Bis(dimetilamino)metileno]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridinio 3-óxido hexafluorofosfato), HBTU (2-(1H-benzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio hexafluorofosfato) y T3P® (Anhídrido propilfosfónico, 2,4,6-Tripropil-1,3,5,2,4,6-trioxatrilfosforinano-2,4,6-trióxido, PPACA).

5

31.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 27 a 30, por lo que la relación de base a compuesto (IIb) antes de la reacción (en mol:mol) es  $\geq 2:1$  a  $\leq 10:1$ .

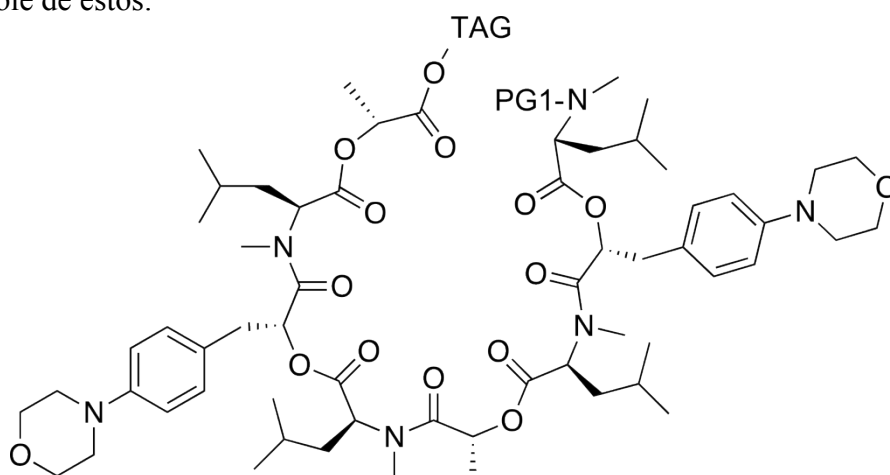
10

32.- El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 27 a 31, por lo que la relación de agente de acoplamiento (IIb) antes de la reacción (en mol:mol) es  $\geq 1:1$  a  $\leq 5:1$ .

15

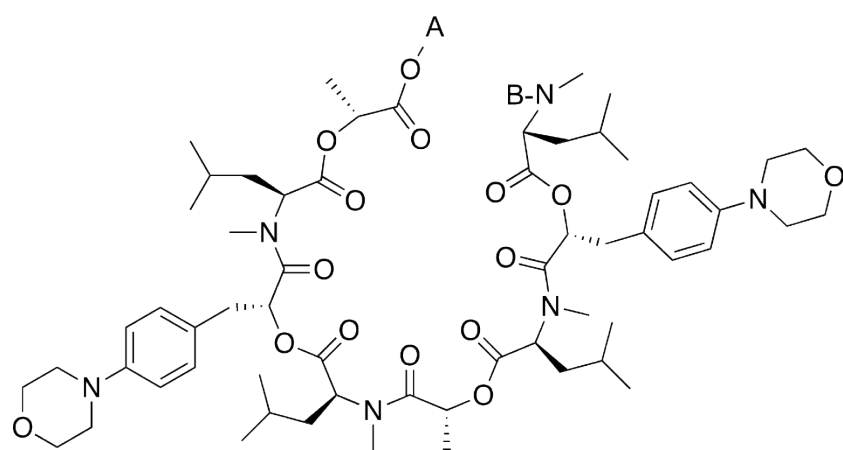
33.- El método de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 27 a 32, por lo que durante la adición del agente de acoplamiento la temperatura se mantiene  $\leq 25$  °C.

34.- Un depsipéptido cíclico o lineal que se selecciona de una de las fórmulas generales (II-1) a (II-14b) o (I-1) a (I-9) o una sal farmacéuticamente o veterinariamente aceptable de estos:

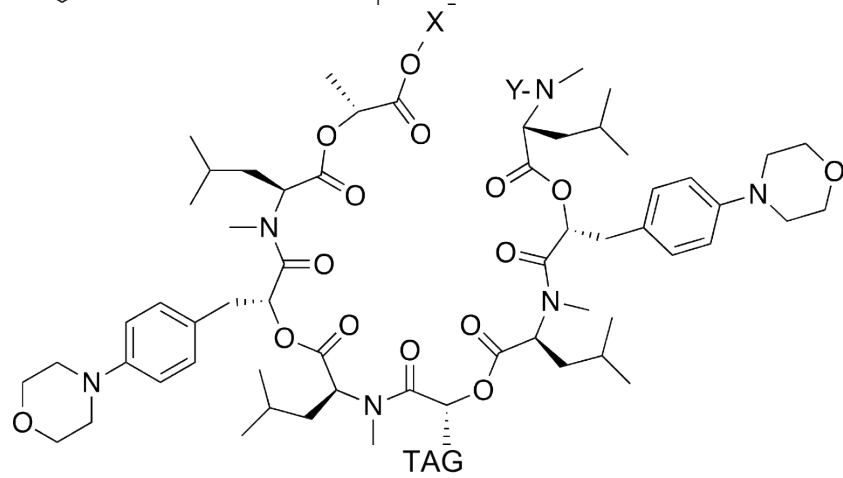


20

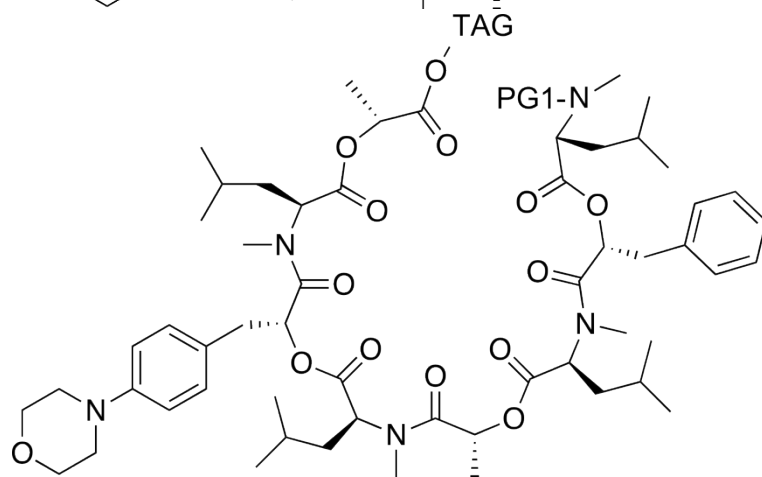
(II-1)



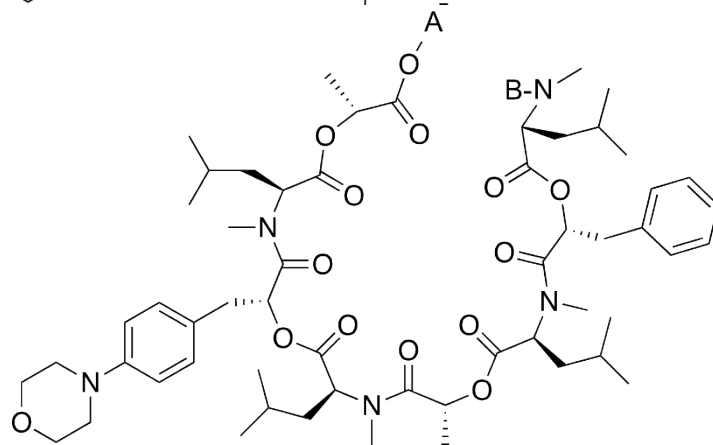
(II- 1a)



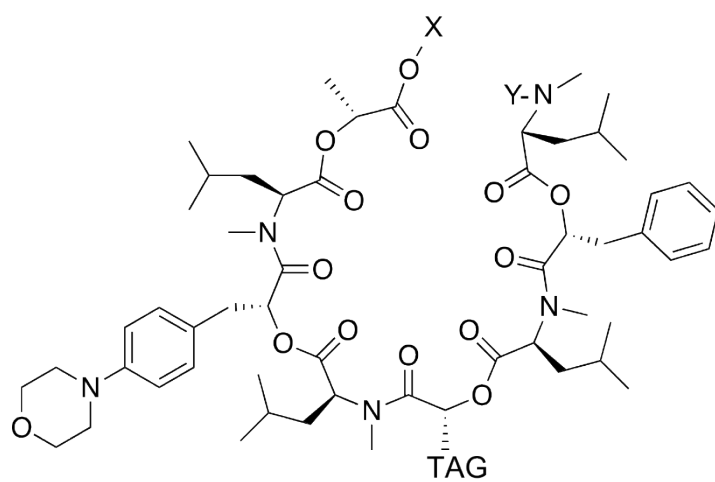
(II- 1b)



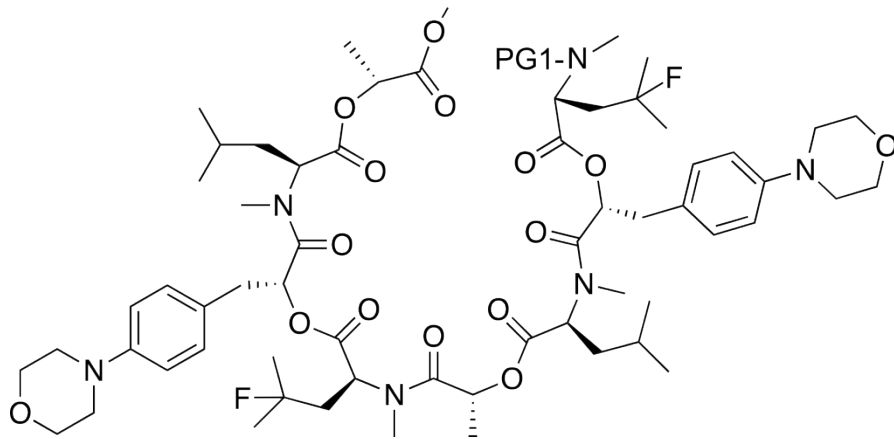
(II-2)



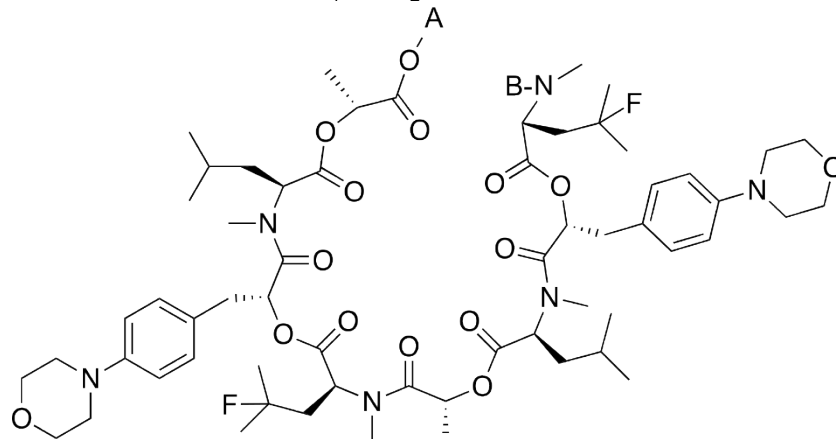
(II-2a)



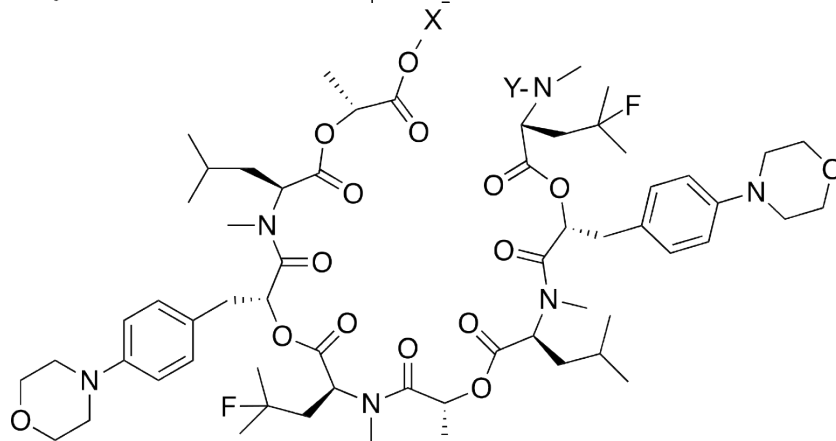
(II-2b)



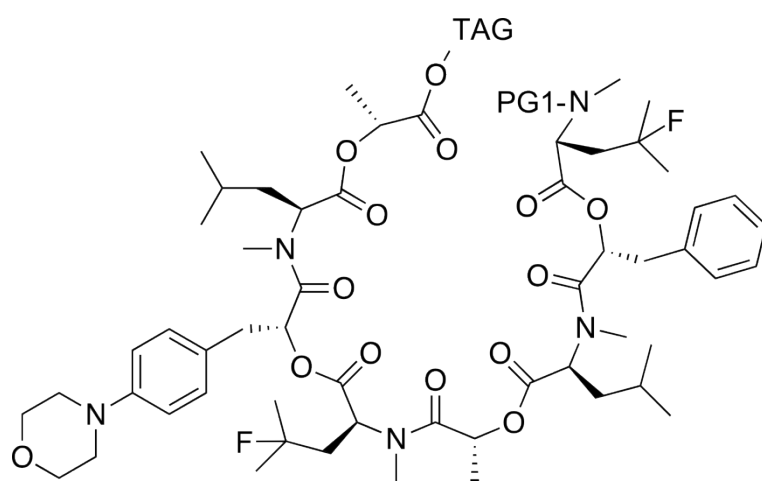
(II-3)



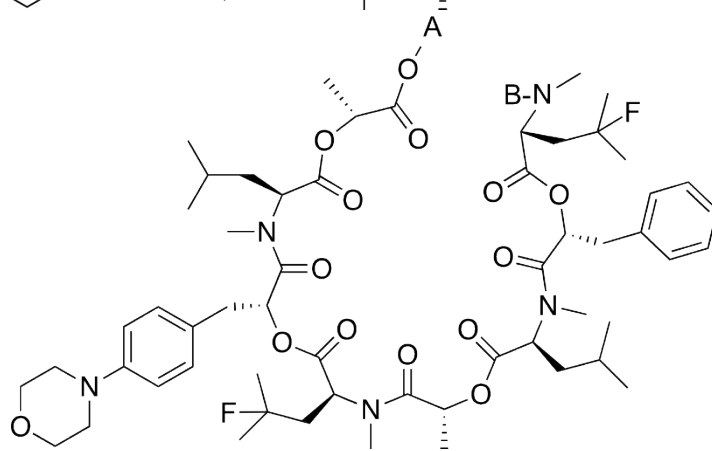
(II-3a)



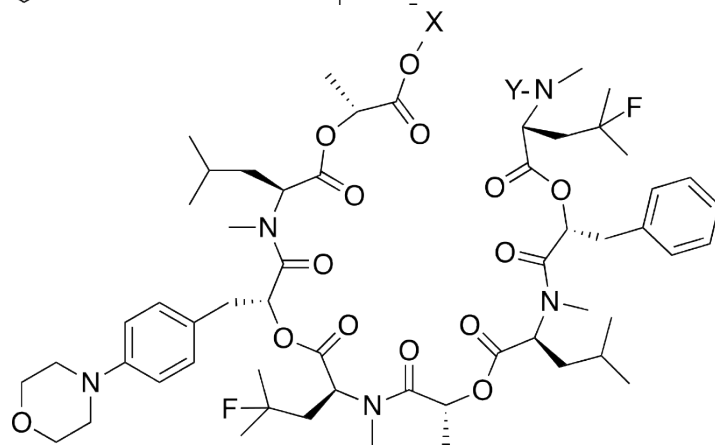
(II-3b)



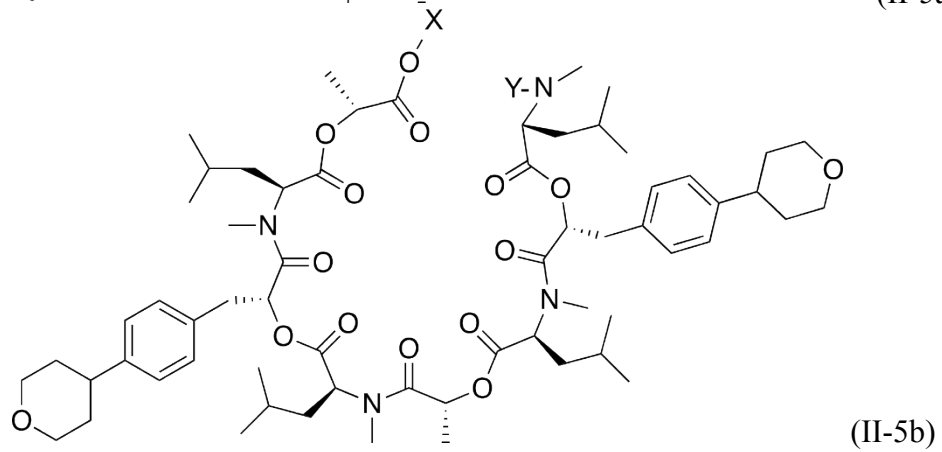
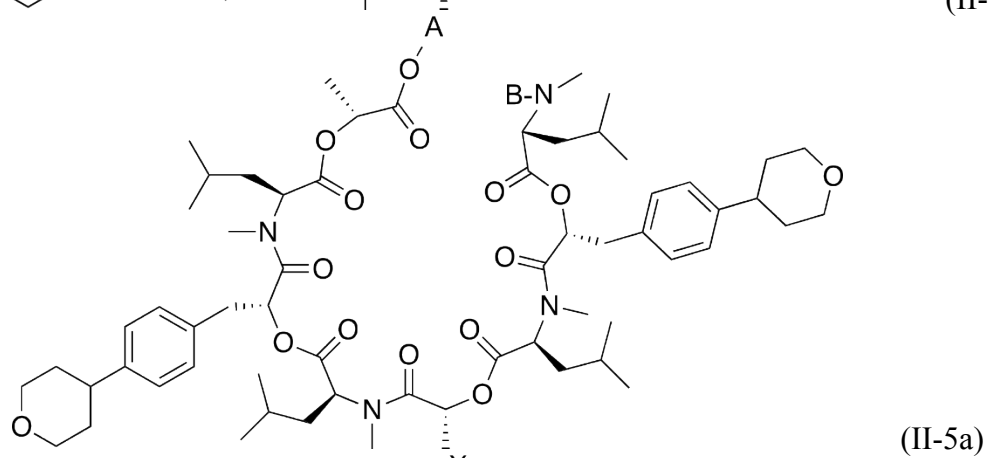
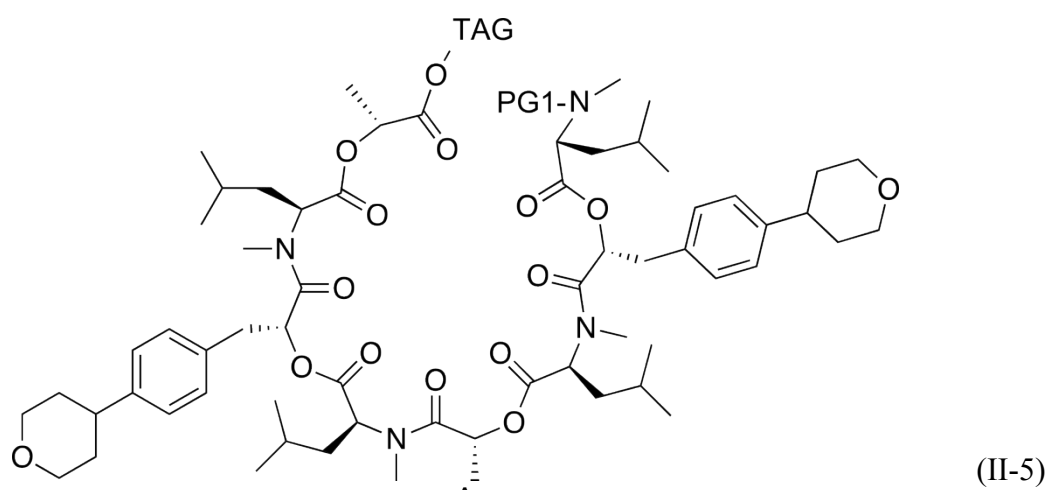
(II-4)

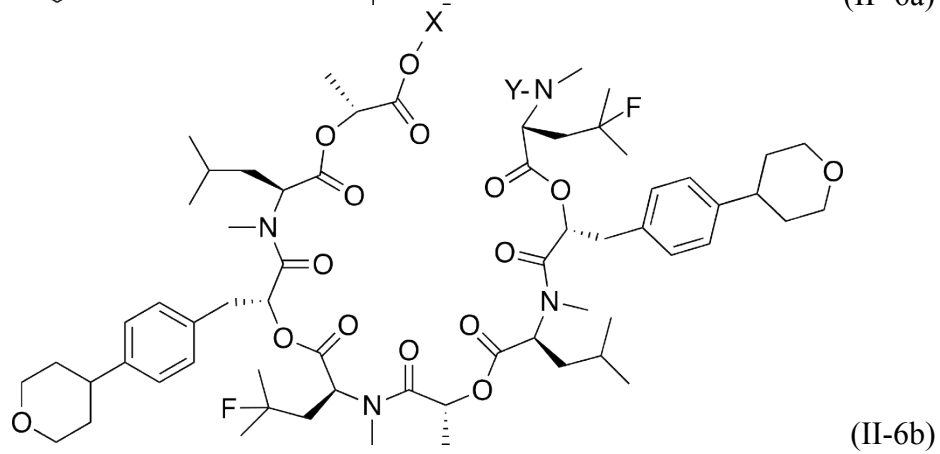
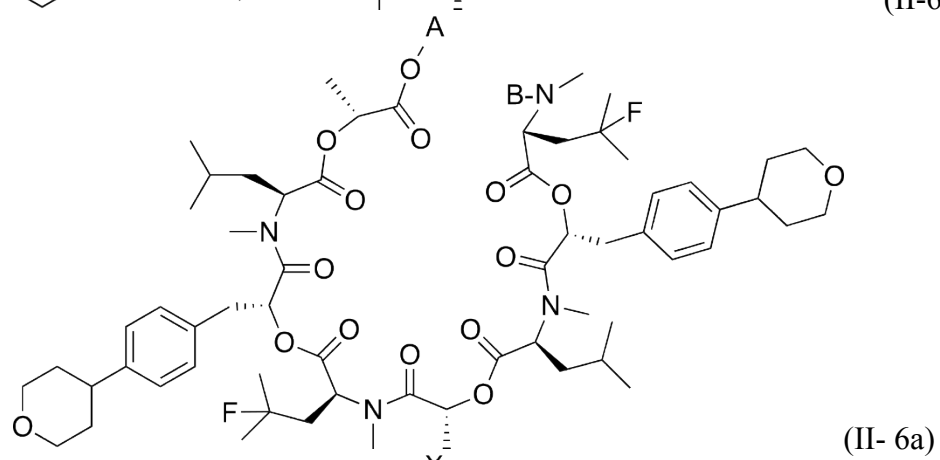
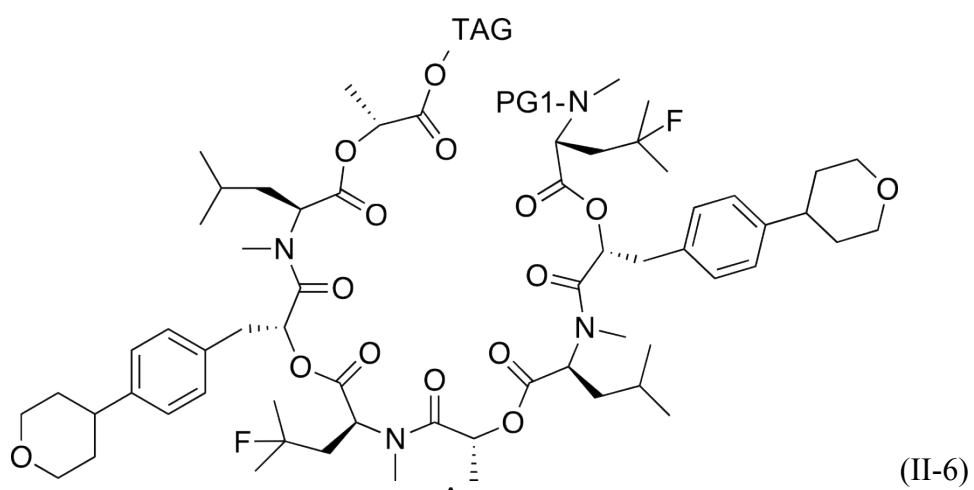


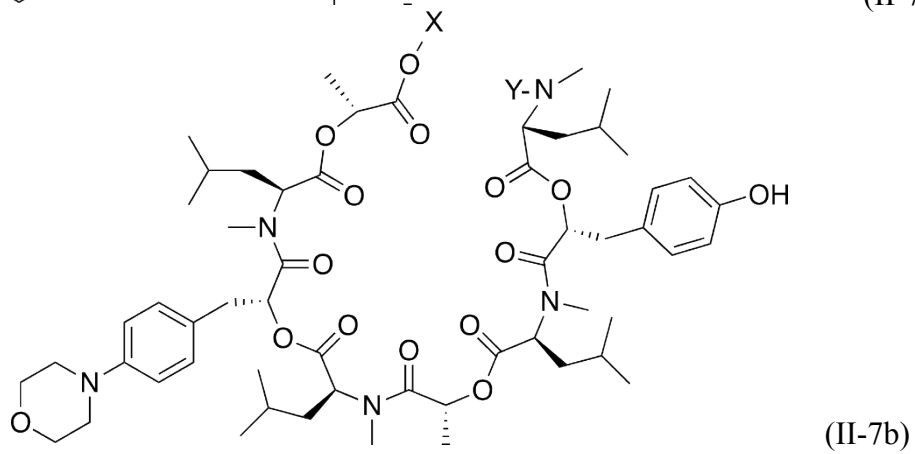
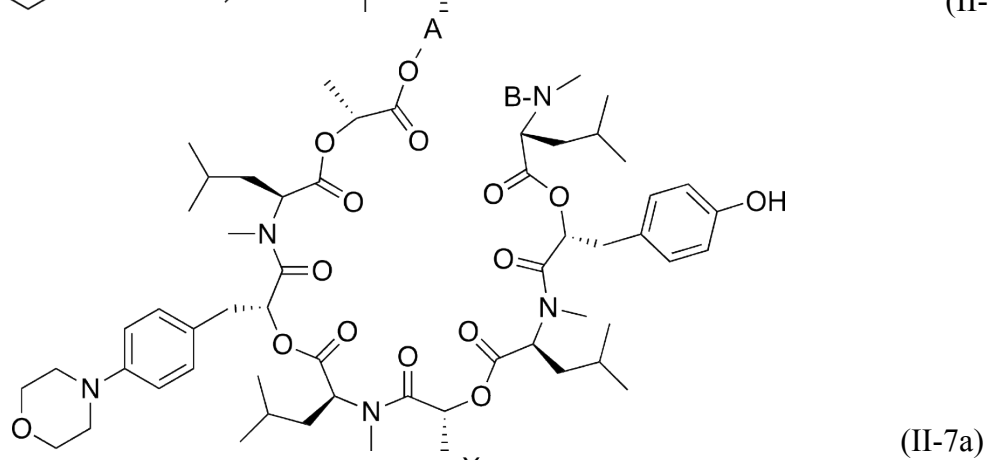
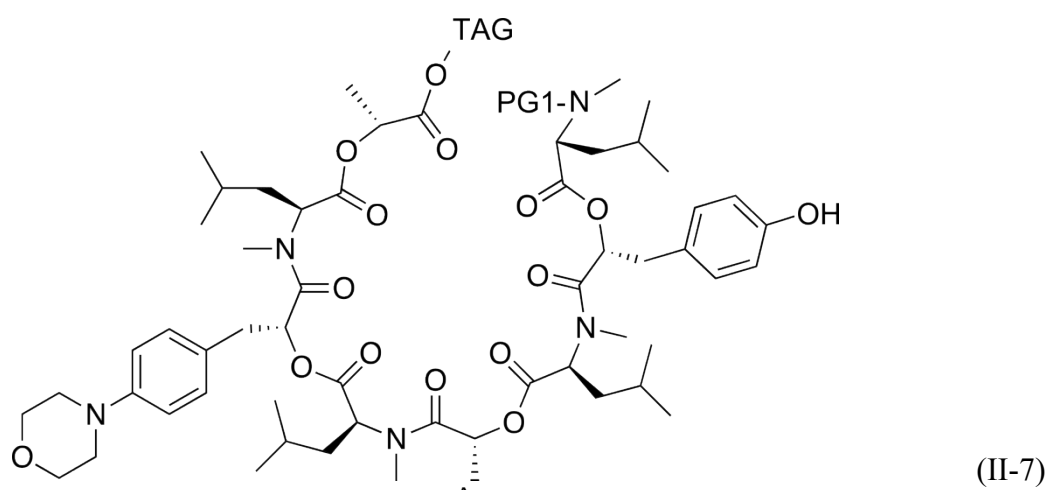
(II-4a)

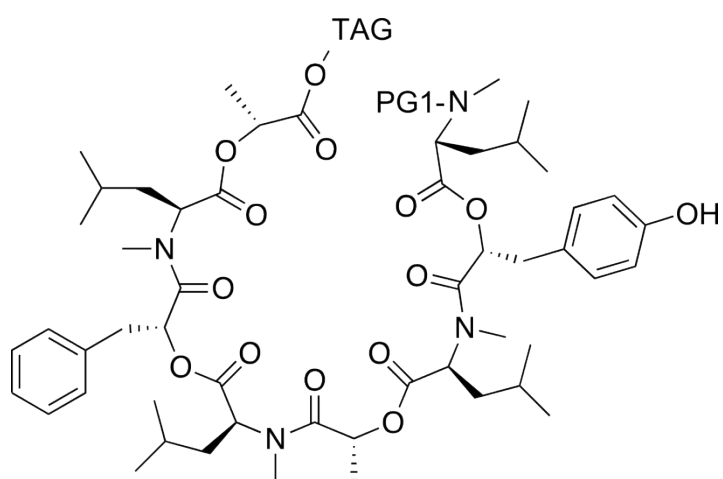


(II-4b)

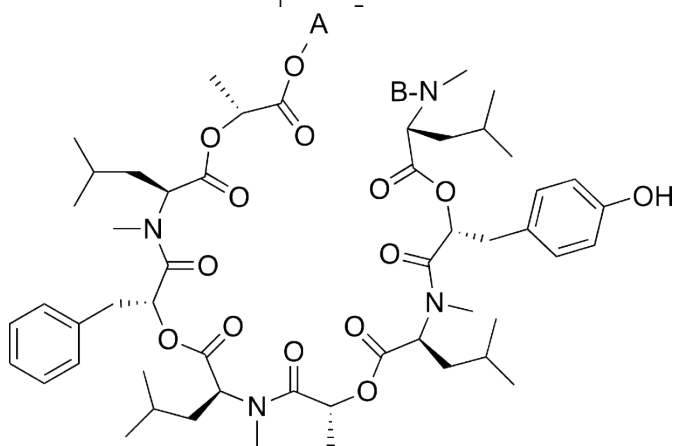




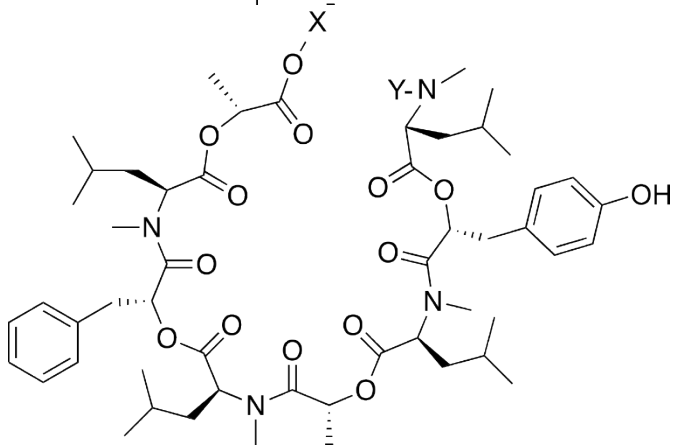




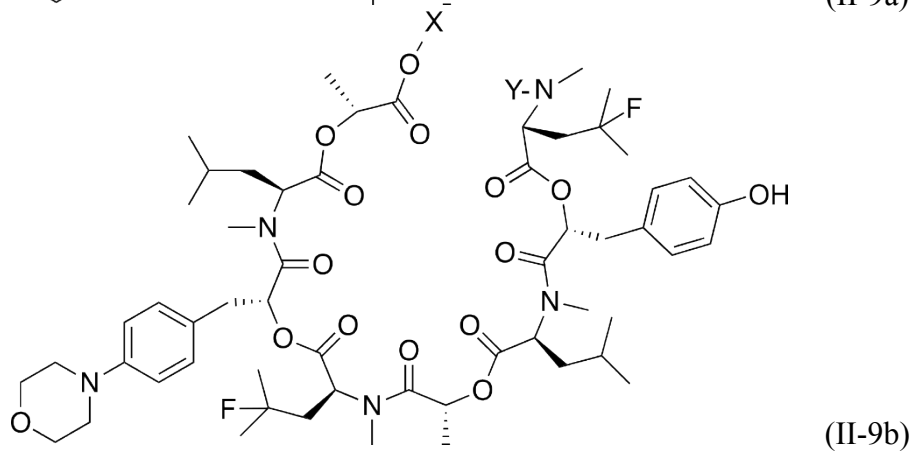
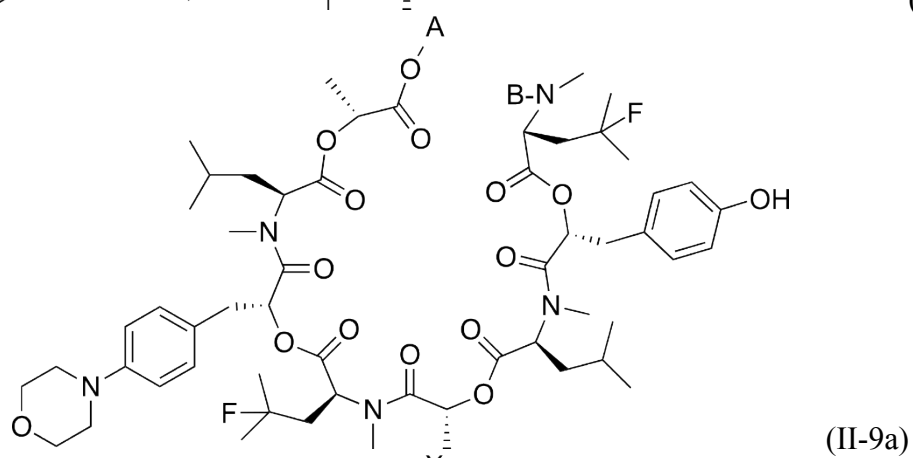
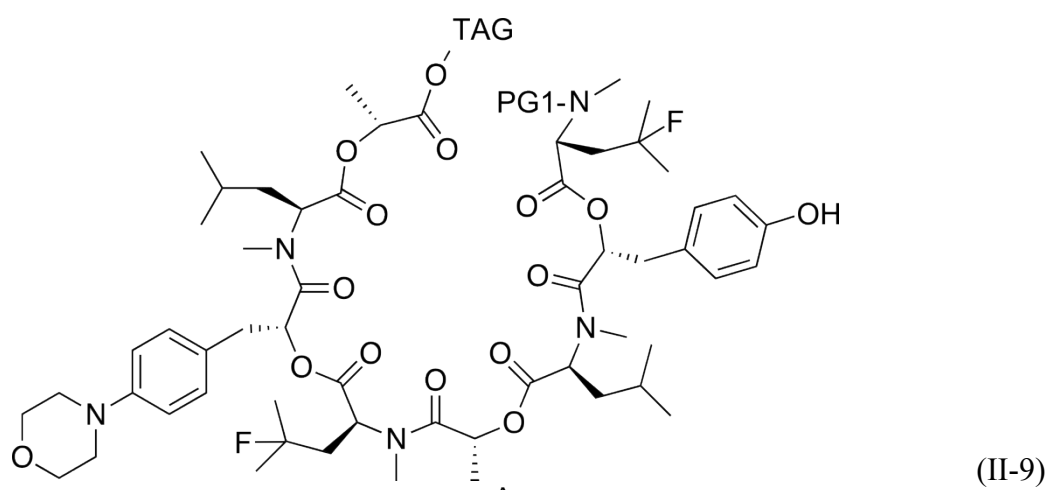
(II-8)

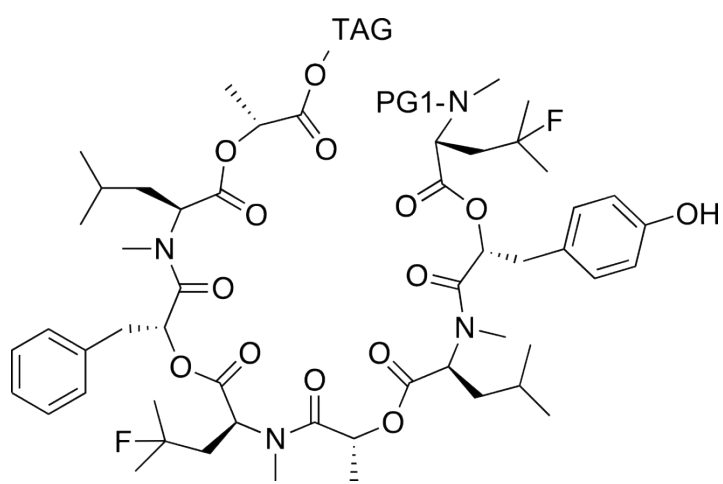


(II-8a)

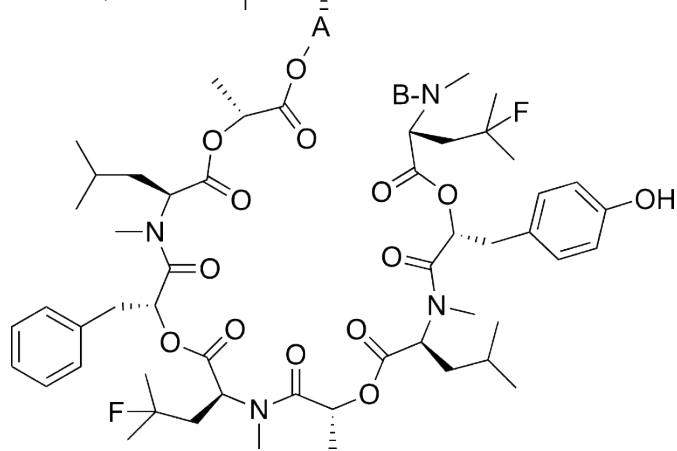


(II-8b)

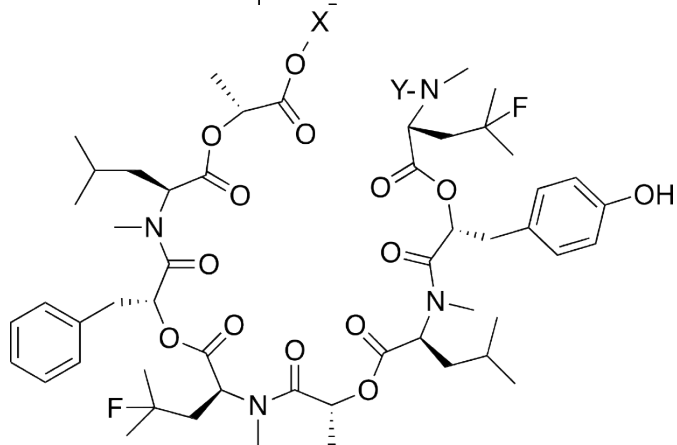




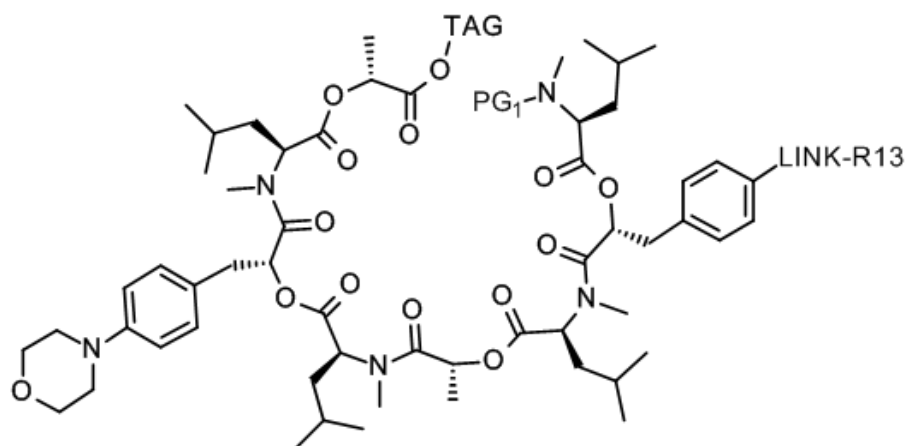
(II-10)



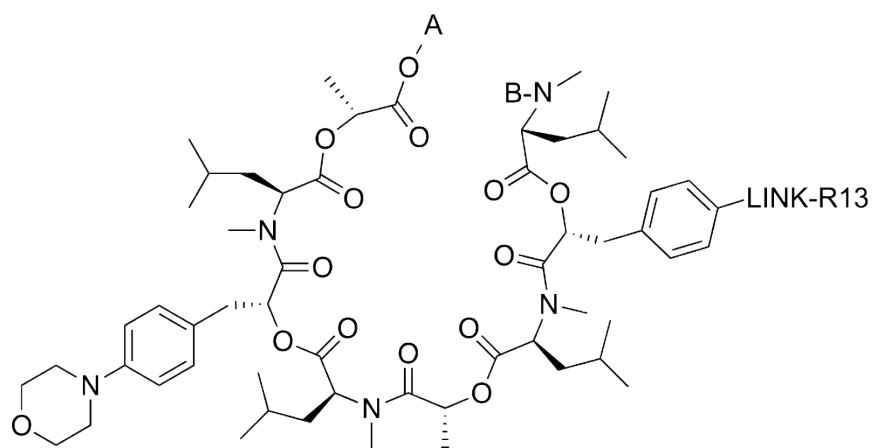
(II-10a)



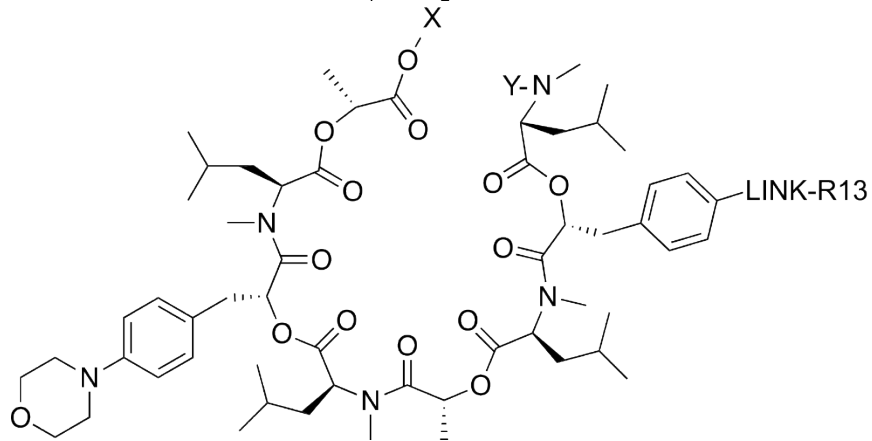
(II-10b)



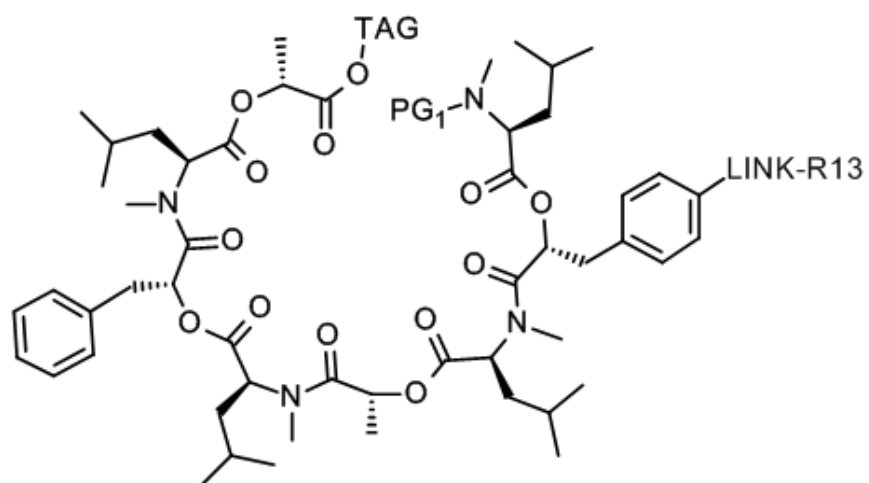
(II-11)



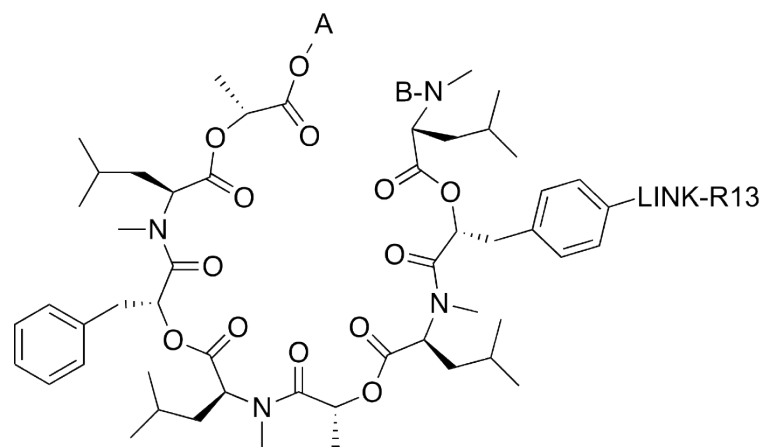
(II-11a)



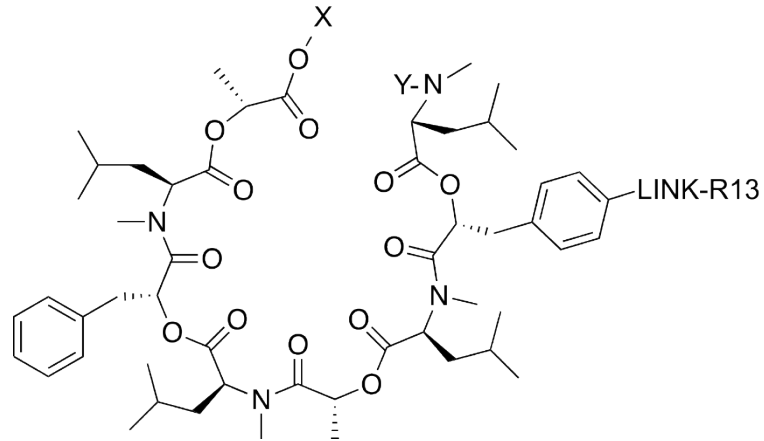
(II-11b)



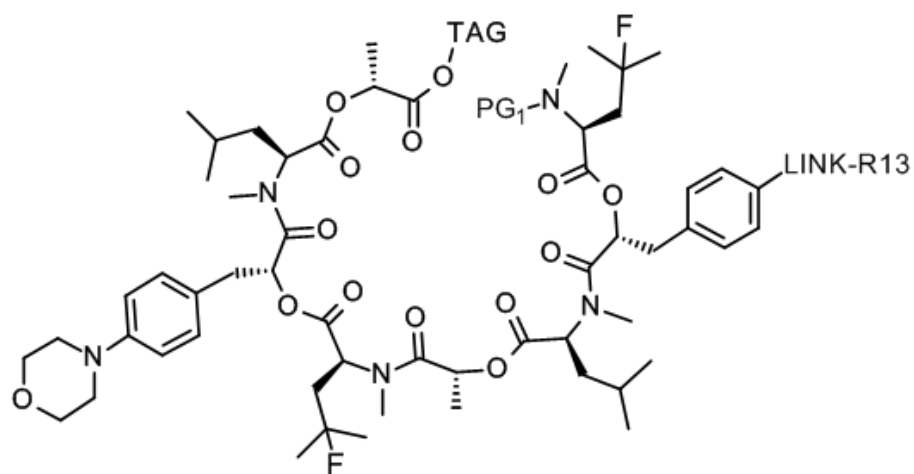
(II-12)



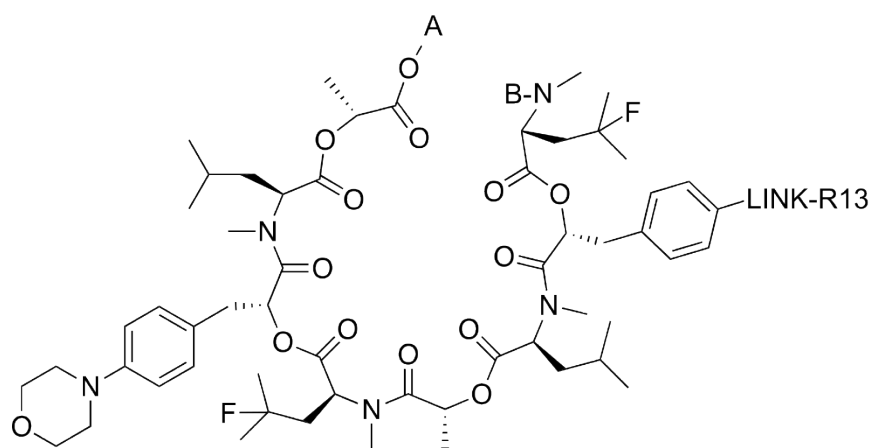
(II-12a)



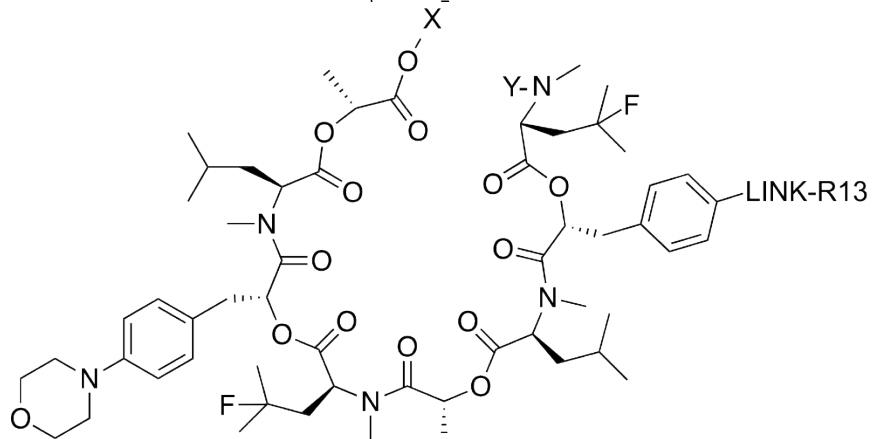
(II-12b)



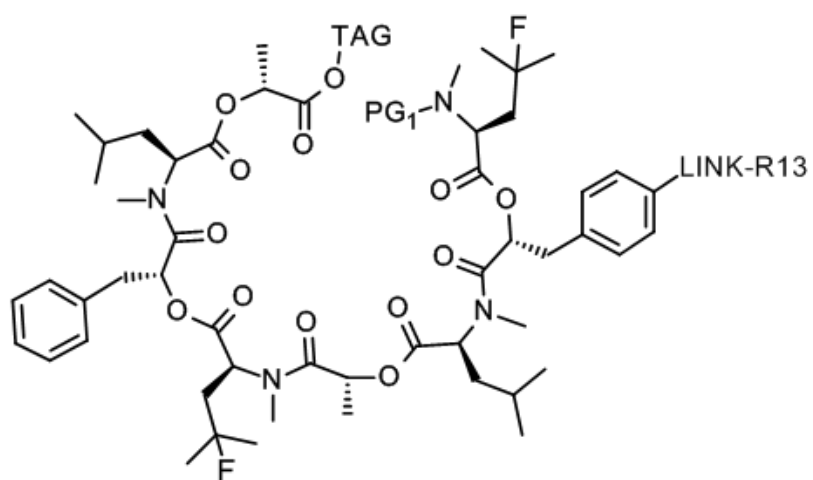
(II-13)



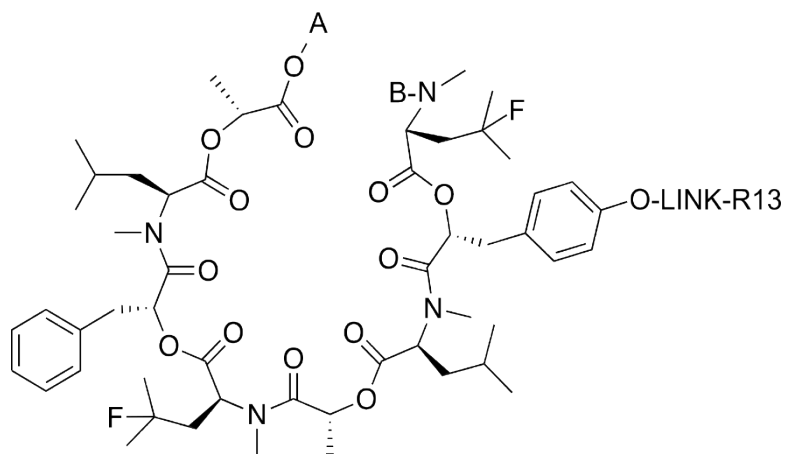
(II-13a)



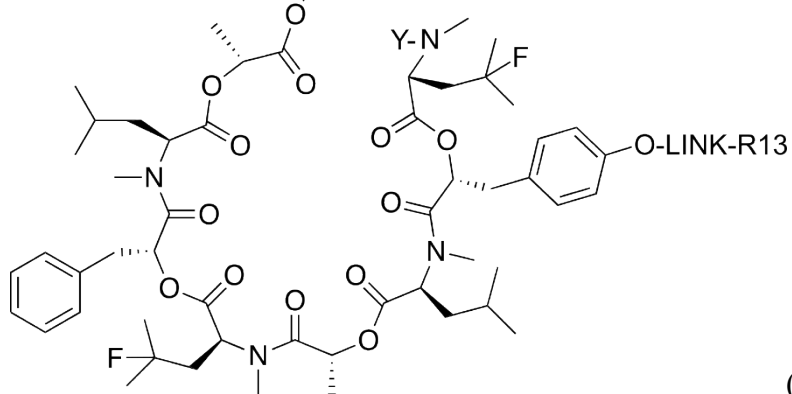
(II-13b)



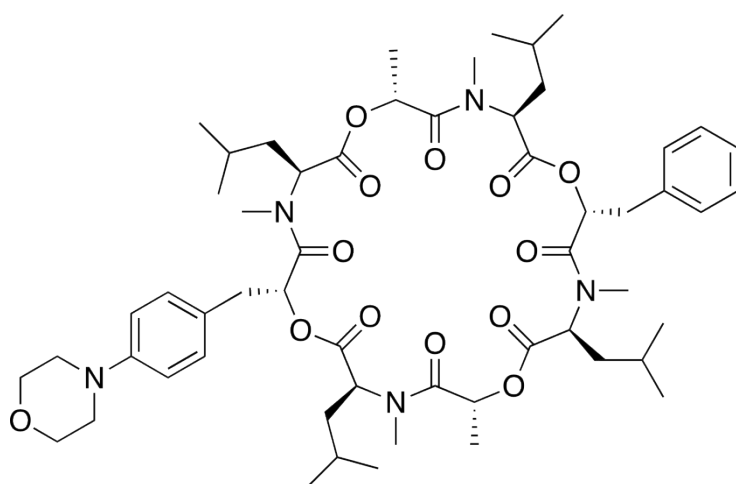
(II-14)



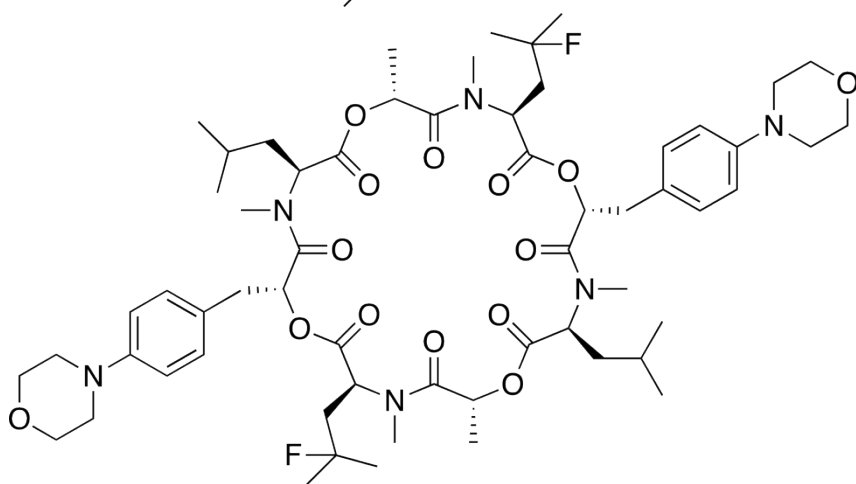
(II-14a)



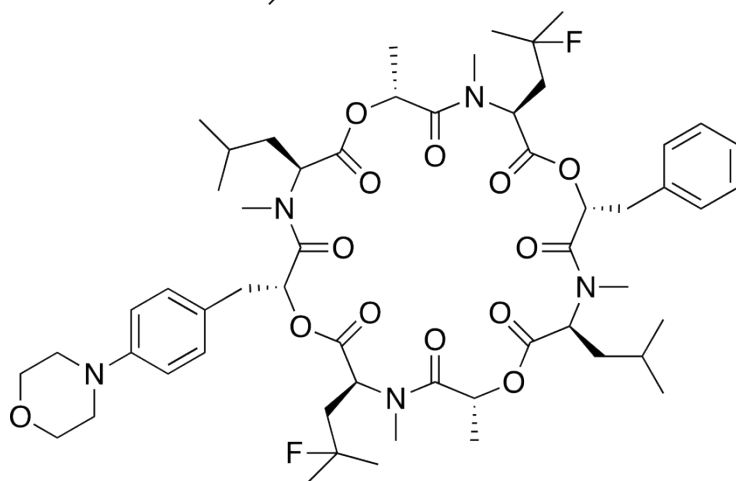
(II-14b)



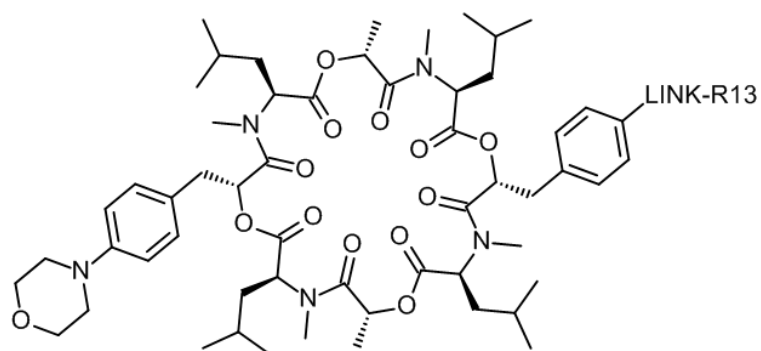
(I-1)



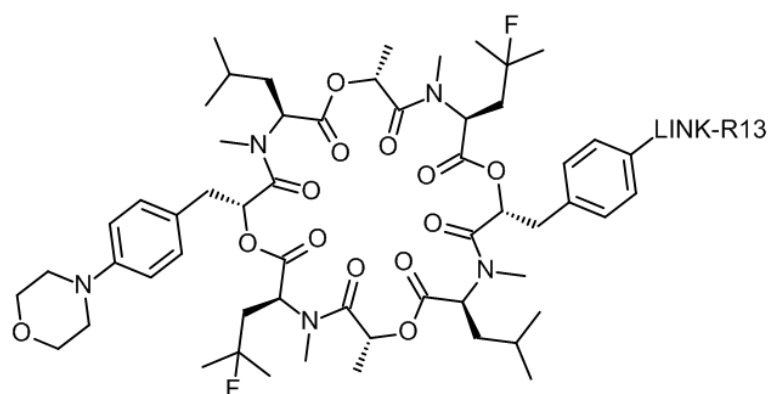
(I-2)



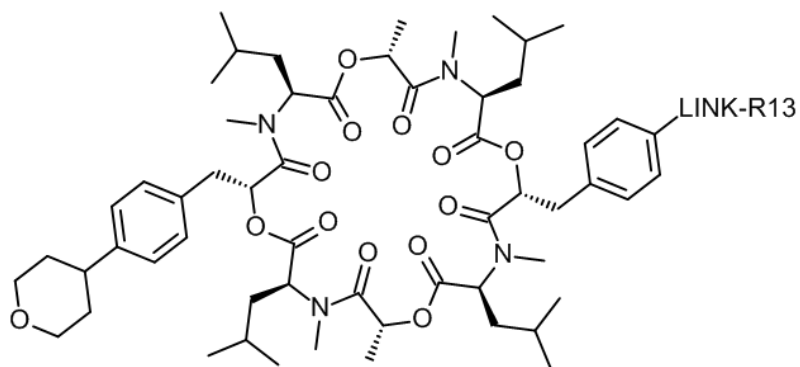
(I-3)



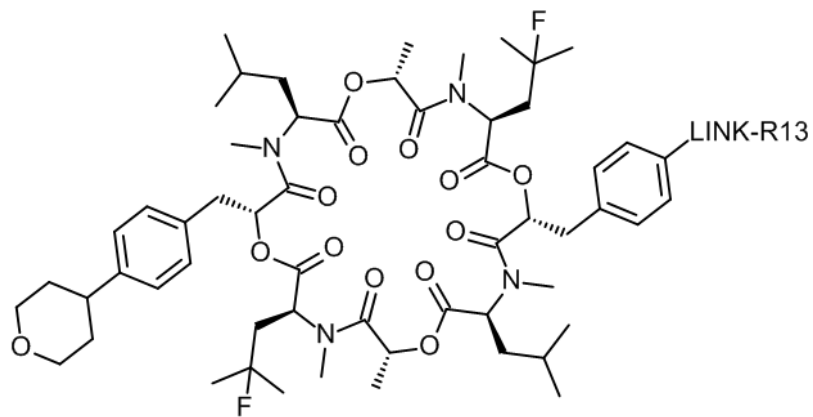
(I-4)



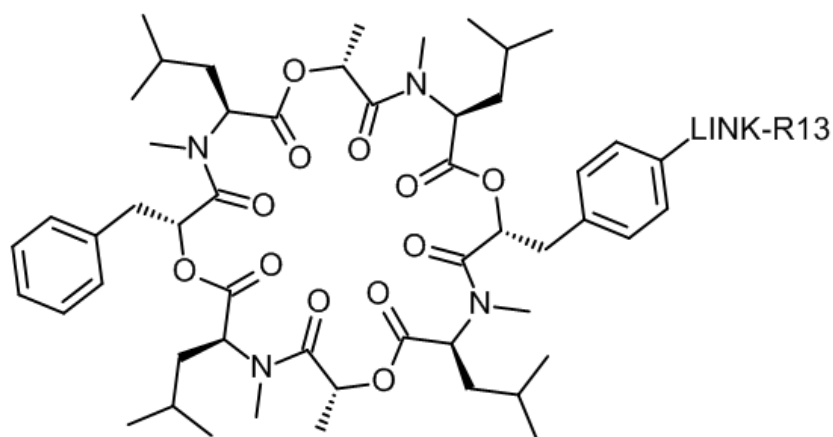
(I-5)



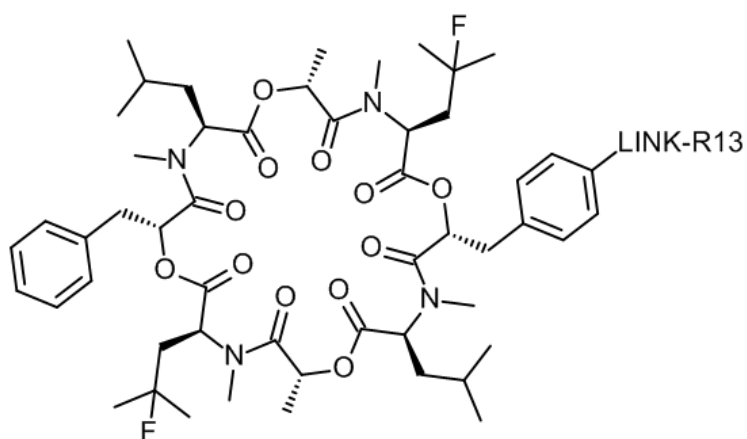
(I-6)



(I-7)



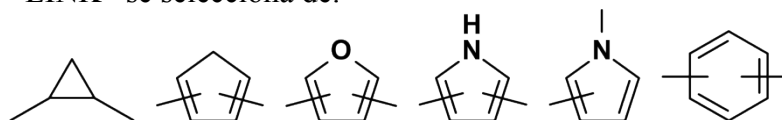
(I-8)



(I-9)

donde en las fórmulas (II-11a) a (II-14b) y (I-1) a (I-9), respectivamente:

–LINK– se selecciona de:



5

y R13 se selecciona de  $\text{SO}_2\text{NH}(\text{CH}_3)$ ,  $\text{SO}_2\text{NH}_2$ ,  $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ ,  $\text{CF}_3$  o una de las siguientes estructuras:

