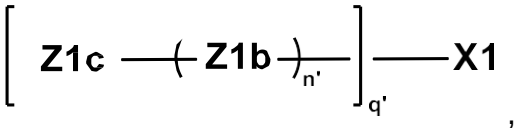
SE REIVINDICA:

1. Un compuesto que comprende uno o más diboronatos de la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:



,

en donde:

cada Z1b es independientemente una porción enlazadora, y cada n' es 0, 1, 2, 3, 4, o 5, en donde al menos un n' es 1, 2, 3, 4, o 5;

X1 comprende una sustancia farmacológica o un polipéptido;

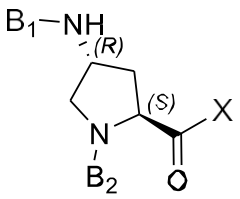
cada Z1c se conjuga covalentemente directamente o mediante uno o más Z1b con una amina en X1; en donde

c) al menos un Z1c se selecciona independientemente de un diboronato, en donde el diboronato se selecciona independientemente de las Fórmulas FF12A, FF12B, FF12C, FF12D, FF116A, FF116B, FF116C, FF116D, FF225, y FF227; y

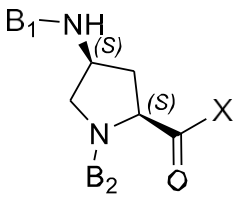
d) cada Z1c adicional opcionalmente se selecciona independientemente de un diboronato, una porción de azúcar, una porción que contiene diol, y una porción que contiene poliol, en donde el diboronato se selecciona independientemente de las Fórmulas FF12A, FF12B, FF12C, FF12D, FF116A, FF116B, FF116C, FF116D, FF225, y FF227; y

cada q’ es 1, 2, 3, 4, o 5, en donde cuando q’ es 2 o más, cada Z1c y Z1b correspondiente se selecciona independientemente y pueden ser iguales o diferentes; y

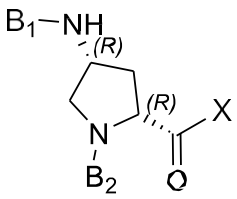
en donde las Fórmulas FF12A, FF12B, FF12C, FF12D, FF116A, FF116B, FF116C, FF116D, FF225, y FF227 son:



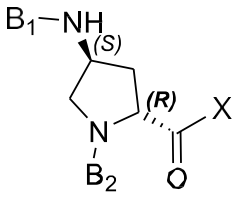
FF12A



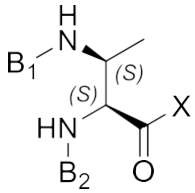
FF12B



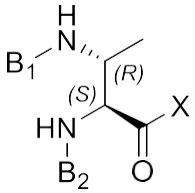
FF12C



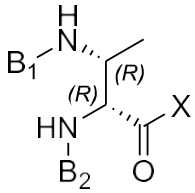
FF12D



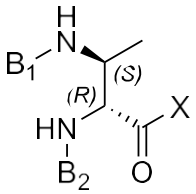
FF116A



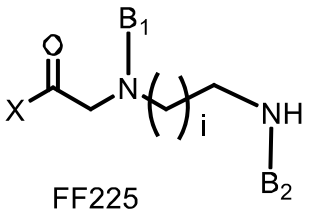
FF116B



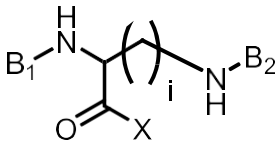
FF116C



FF116D



FF225



FF227

,

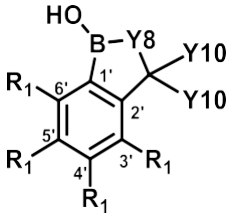
en donde X representa un punto de unión covalente a una amina de Z1b o a una amina de X1 cuando n’ es 0;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

en donde B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

en donde cuando cada Z1c se selecciona de las Fórmulas FF225 y FF227, al menos uno de los B_1 y B_2 es la Fórmula F7,

en donde la Fórmula F7 es:



(F7)

en donde:

un R_1 representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c;

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

Y8 es O o NR, en donde R es un grupo alquilo C_1-C_6 o H; y

cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, y CF_3, en donde para al menos un F7 al menos un Y10 no es H.

2. El compuesto de la reivindicación 1, o estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o

una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde:

cada n’ es 0, 1, 2, o 3, en donde al menos un n’ es 1, 2, o 3;

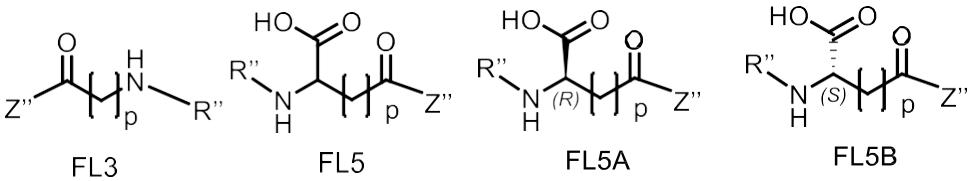
cada q’ es 1, 2, 3, o 4;

cada Z1b es independientemente una porción enlazadora, en donde cada Z1c se conjuga covalentemente directamente o mediante uno o más de Z1b con una amina de X1, con la condición de que Z1b no sea una porción que contiene diol, y

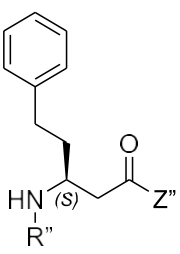
en donde una o más posiciones del compuesto pueden comprender un isótopo.

3. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, o estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde cada Z1c se conjuga covalentemente a través de uno o más de Z1b con una amina de X1, en donde cada Z1b se selecciona independientemente de las Fórmulas FL3, FL5, FL5A, FL5B, FL65A, FL65B, FL69, FL69A, FL69B, FL70, FL70A, y FL70B;

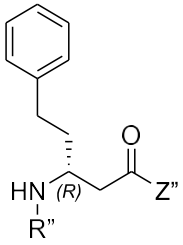
en donde FL3, FL5, FL5A, FL5B, FL65A, FL65B, FL69, FL69A, FL69B, FL70, FL70A, y FL70B son:



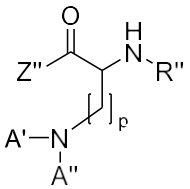
FL3 FL5 FL5A FL5B



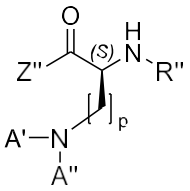
FL65A



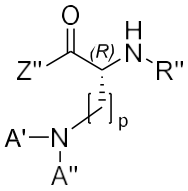
FL65B



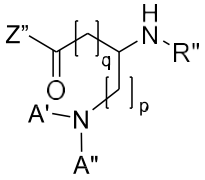
FL69



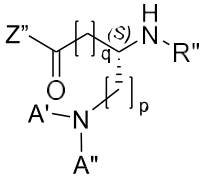
FL69A



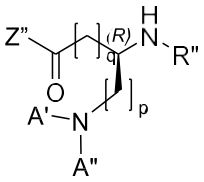
FL69B



FL70



FL70A



FL70B ;

en donde:

R'' representa un enlace covalente, directo o indirecto, a Z1c;

Z'' representa un enlace covalente, directa o indirectamente, a X1;

A’ se selecciona de H y un alquilo C_1 a C_{20}; y

A’’ es un grupo acilo C_2-C_{20} termina opcionalmente en un grupo ácido, en donde uno o más átomos de carbono del grupo acilo C_2-C_{20} se reemplazan opcional e independientemente con un grupo seleccionado de C(=O), O, NH, NH_2, S, S(O), SO_2, fenilo, heterociclilo de 5 miembros, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, y en donde el grupo acilo C_2-C_{20}, NH, NH_2, SO_2, fenilo, heterociclilo de 5 miembros, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, y heteroarilo de 6 miembros se sustituye cada uno independientemente con 0, 1, 2, 3, o 4 R_x,

en donde R_x se selecciona de alquilo C_1-C_5, halógeno, haloalquilo C_1-C_5, ácido carboxílico, hidroxilo, -O-alquilo C_1-C_5, -$S(=O)_2NH_2$, NH_2, heterociclilo de 5 miembros,

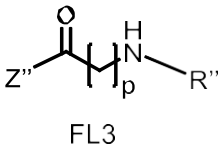
heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, fenilo, y heteroarilo de 6 miembros;

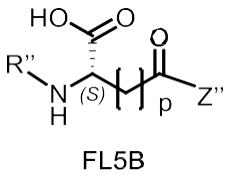
p es 1, 2, 3, 4, o 5,

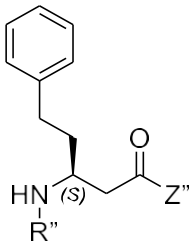
q es 1, 2, 3, 4, o 5, y

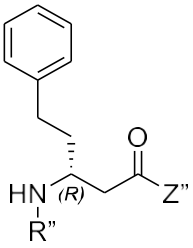
cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada.

4. El compuesto de la reivindicación 3, en donde cada Z1b se selecciona independientemente de:

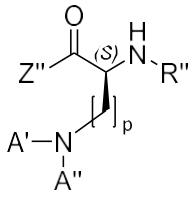

FL3


FL5B


FL65A


FL65B

, y

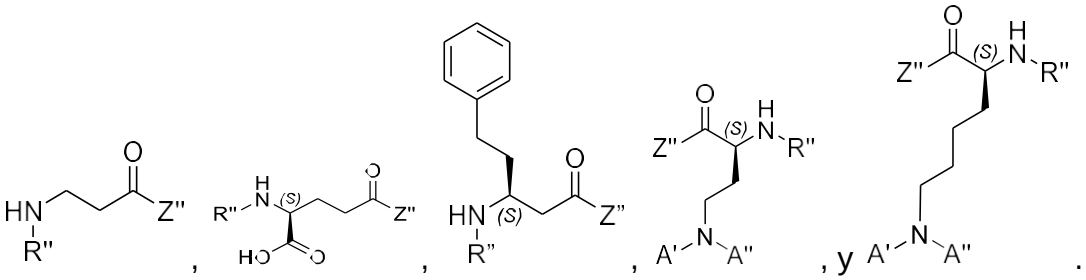

FL69A

;

en donde:

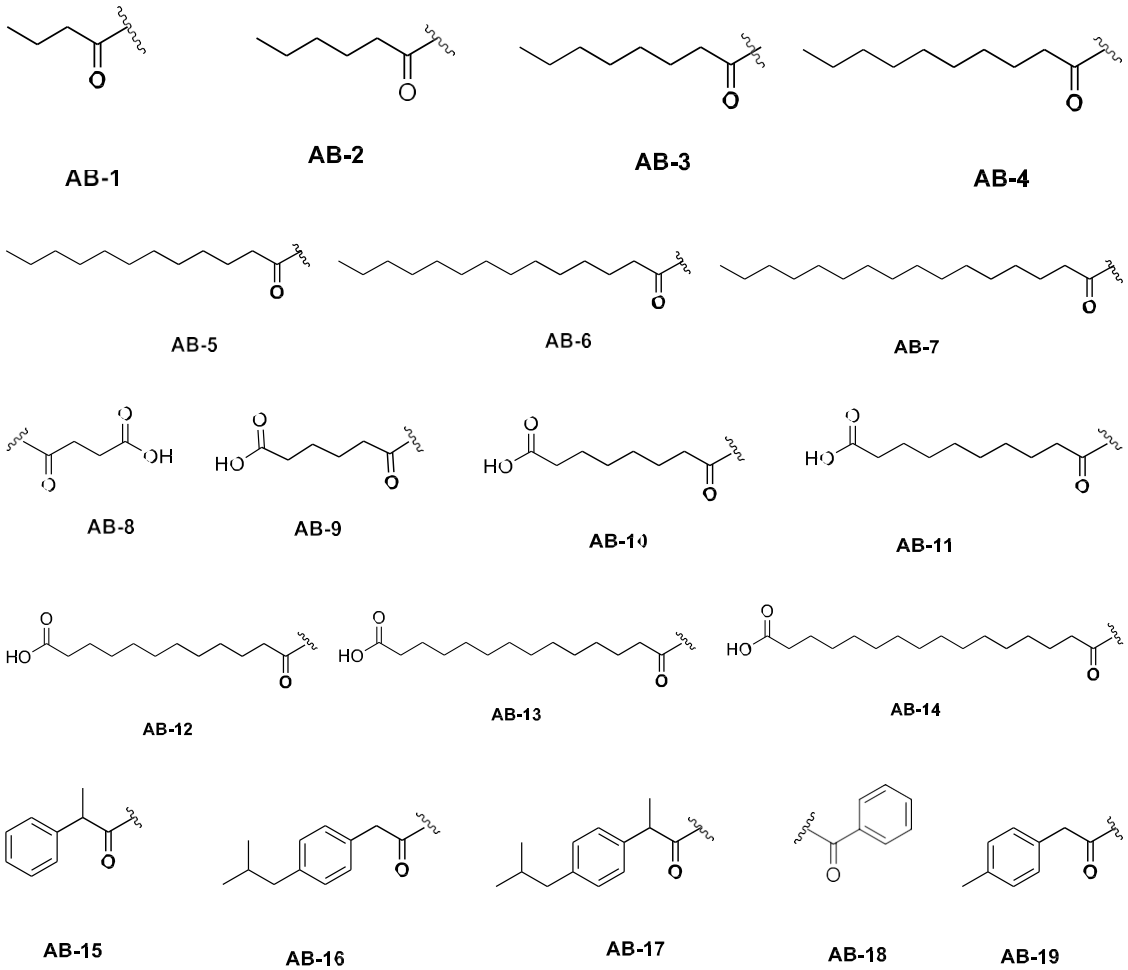
p es 1, 2, 3, 4, o 5.

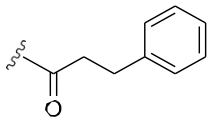
5. El compuesto de la reivindicación 3 o 4, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde cada Z1b se selecciona independientemente de:



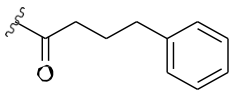
6. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 3-5, o una sal farmacéuticamente aceptable de este,

en donde cada A” se selecciona independientemente de:

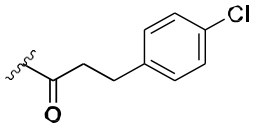




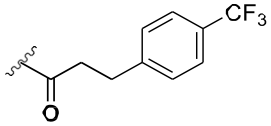
AB-20



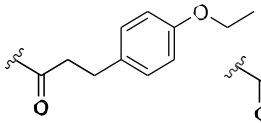
AB-21



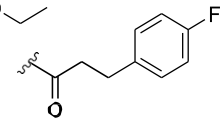
AB-22



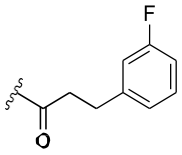
AB-23



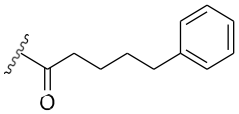
AB-24



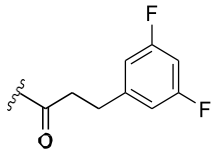
AB-25



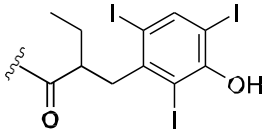
AB-26



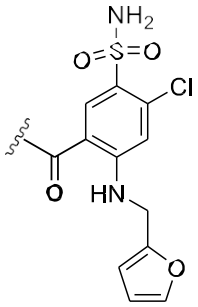
AB-27



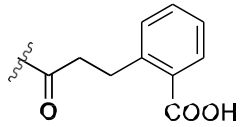
AB-28



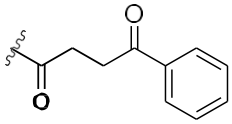
AB-29



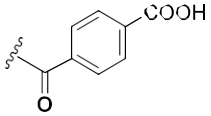
AB-30



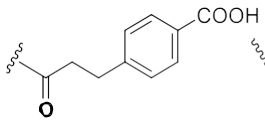
AB-31



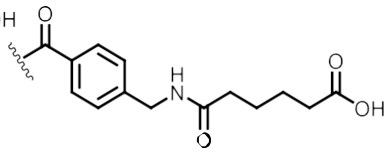
AB-32



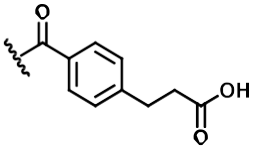
AB-33



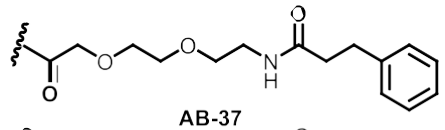
AB-34



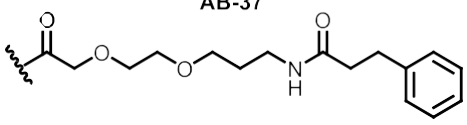
AB-35



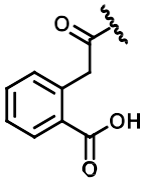
AB-36



AB-37

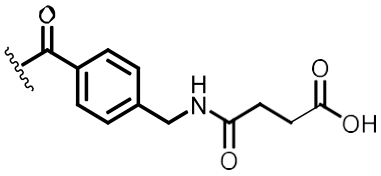


AB-37A



AB-38

, y

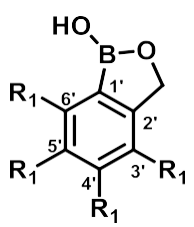


AB-39

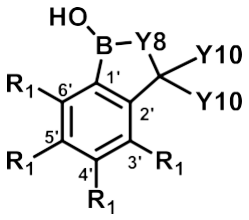
.

7. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-5, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el B_1 y B_2 se seleccionan independientemente de las Fórmulas F2 y F7,

en donde las Fórmulas F2 y F7 son:



(F2)



(F7) ;

en donde:

un R_1 representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c;

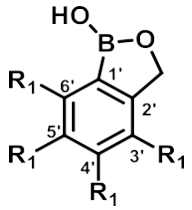
cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

Y8 es O, o Y8 es NR, en donde R es un grupo alquilo C_1-C_6 o H; y

cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, y CF_3, en donde para al menos un F7 al menos un Y10 no es H.

8. El compuesto de la reivindicación 7, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde R_1 en la posición 5’ representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c.

9. El compuesto de la reivindicación 7, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el B_1 y el B_2 se representan independientemente por la Fórmula F2, en donde la Fórmula F2 es:



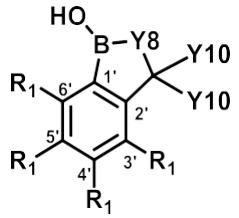
(F2) ;

en donde:

R_1 en la posición 5’ representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, y OCF_3.

10. El compuesto de la reivindicación 7, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde los B_1 y B_2 son independientemente la Fórmula F7,



(F7) ;

en donde:

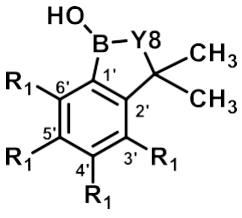
R_1 en la posición 5' representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c;

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, y OCF_3;

Y8 es O o NR, en donde R es un grupo alquilo C_1-C_6 o H; y

cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, y CF_3, en donde para al menos un F7 al menos un Y10 no es H.

11. El compuesto de la reivindicación 7 o 10, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el B_1 y B_2 son independientemente la Fórmula F7A,



(F7A) ;

en donde:

R_1 en la posición 5’ representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, y OCF_3.

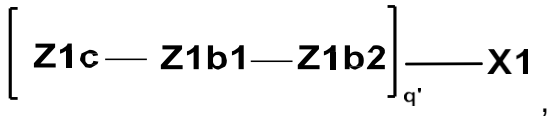
12. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-8, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde al menos un B_1 o B_2 es F7, y en donde Y8 es O y cada Y10 es CH3.

13. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 7-11, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, CF_3, y F, opcionalmente dos R_1 restantes son H y un R_1 restante es CF_3 o F.

14. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 7-11, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde al menos un R_1 en el B_1 o el B_2 es F o CF_3.

15. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 7-11, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde R_1 restante es H.

16. El compuesto de la reivindicación 3 que tiene la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:



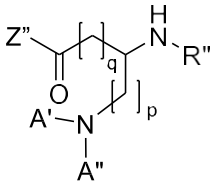
,

en donde:

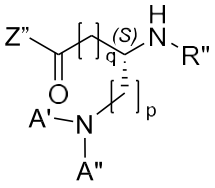
q’ es 2, 3, o 4;

cada Z1c y Z1b1 correspondiente se selecciona independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

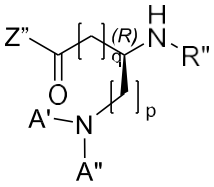
cada Z1b1 es un enlace o se selecciona de FL70, FL70A, y FL70B, en donde FL70, FL70A, y FL70B son:



FL70

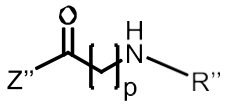


FL70A



FL70B ; y

en donde R’’, Z’’, A’, A’’, p y q son como se definen en la reivindicación 3;

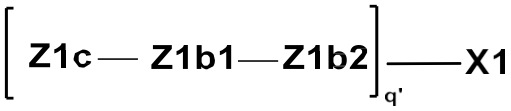


cada Z1b2 es FL3, en donde FL3 es FL3 , y en donde R'', Z'', y p son como se definen en la reivindicación 3;

cada Z1c se conjuga covalentemente con Z1b1 a través de una amina en la posición beta o gamma de una cadena principal de Z1b1, y

en donde al menos un Z1c se conjuga covalentemente con al menos un Z1b1 seleccionado de FL70, FL70A, y FL70B.

17. El compuesto de la reivindicación 3 que tiene la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:

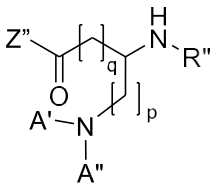


en donde:

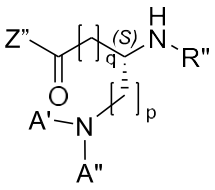
q' es 2, 3, o 4;

cada Z1c y Z1b1 correspondiente se selecciona independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

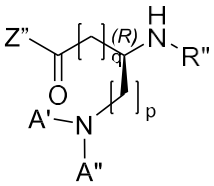
cada Z1b1 es un enlace o se selecciona de FL70, FL70A, y FL70B, en donde FL70, FL70A, y FL70B son:



FL70



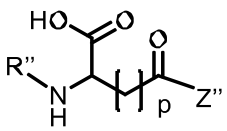
FL70A



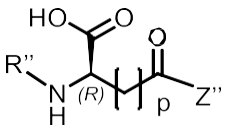
FL70B ; y

en donde R’’, Z’’, A’, A’’, p y q son como se definen en la reivindicación 3;

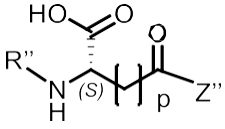
cada Z1b2 se selecciona de FL5, FL5A, y FL5B, en donde FL5, FL5A, y FL5B son:



FL5



FL5A



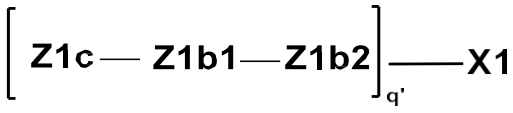
FL5B ; en donde R’’, Z’’, y p son como se definen en la reivindicación 3;

cada Z1c se conjuga covalentemente con Z1b1 a través de una amina en una posición beta o gamma de una cadena principal de Z1b1, y

en donde al menos un Z1c se conjuga covalentemente con al menos un Z1b1 seleccionado de FL70, FL70A, y FL70B.

18. El compuesto de la reivindicación 16 o 17, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde al menos un Z1c se conjuga con una amina en la posición beta de la cadena principal de Z1b1 o Z1b2.

19. El compuesto de la reivindicación 3 que tiene la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:

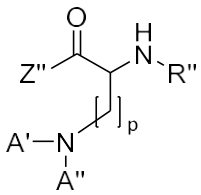


en donde:

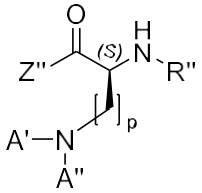
q' es 2, 3, o 4;

cada Z1c y Z1b1 correspondiente se selecciona independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

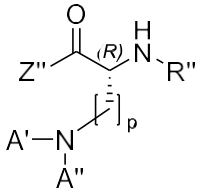
cada Z1b1 es un enlace o se selecciona de FL69, FL69A, y FL69B, en donde FL69, FL69A, y FL69B son:



FL69



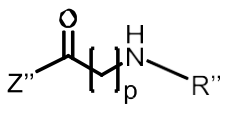
FL69A



FL69B

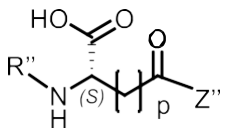
, y en donde R'', Z'', A', A'', y p son como se definen en la reivindicación 3;

cada Z1b2 es FL3 o FL5B, en donde FL3 y FL5B son:



FL3

y



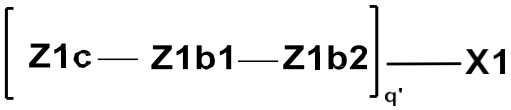
FL5B

, en donde R'', Z'', y p son como se definen en la reivindicación 3;

cada Z1c se conjuga covalentemente con Z1b1 a través de una amina en una posición alfa de una cadena principal del Z1b1, y

en donde al menos un Z1c se conjuga covalentemente con al menos un Z1b1 seleccionado de FL69, FL69A, y FL69B.

20. El compuesto de la reivindicación 3 que tiene la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:

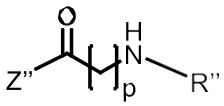


en donde:

q' es 2, 3, o 4;

cada Z1c correspondiente se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

cada Z1b1 es un enlace;



cada Z1b2 es FL3, en donde FL3 es FL3 , y en donde R'', Z'', y p son como se definen en la reivindicación 3;

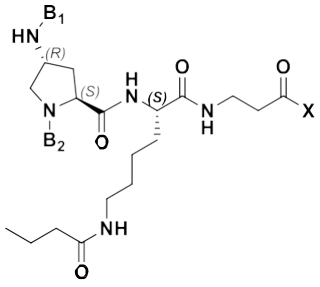
y

cada Z1c se conjuga covalentemente con Z1b2 a través de una amina en una posición beta de una cadena principal del Z1b2.

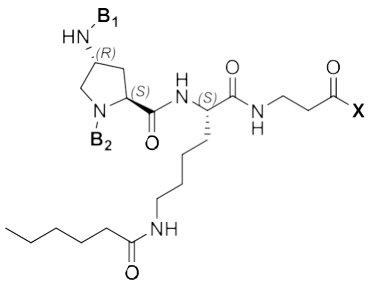
21. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde X1 es un polipéptido y el polipéptido comprende un agonista del receptor de insulina que tiene una cadena A y una cadena B.

22. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde cada Z1c se selecciona de las Fórmulas FFL-1 a FFL-68,

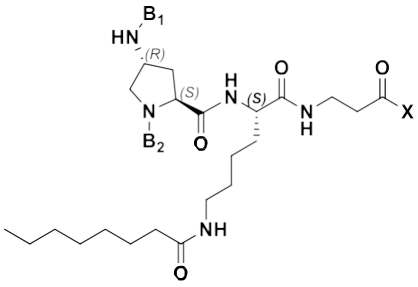
en donde las Fórmulas FFL-1 a FFL-68 son:



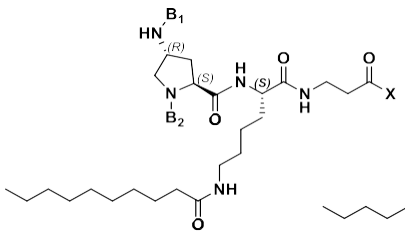
FFL-1



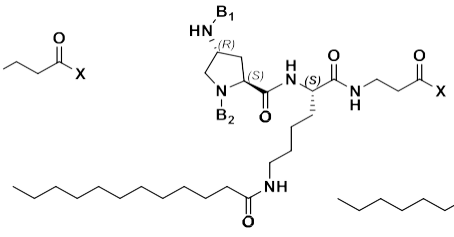
FFL-2



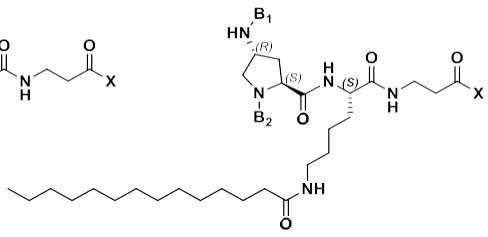
FFL-3



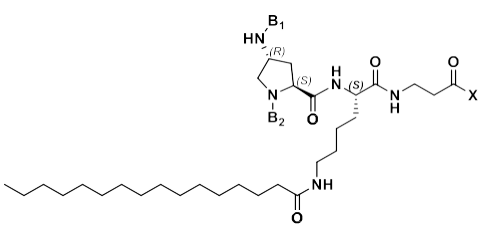
FFL-4



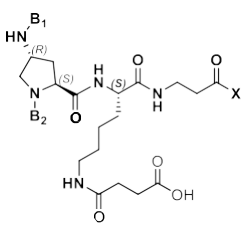
FFL-5



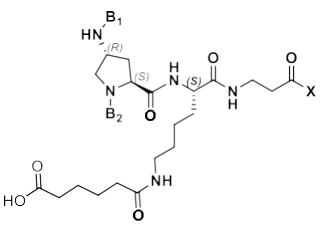
FFL-6



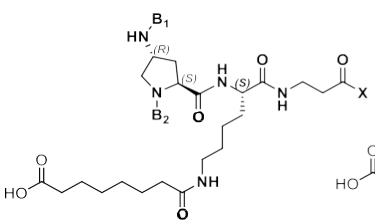
FFL-7



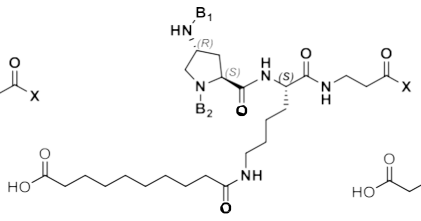
FFL-8



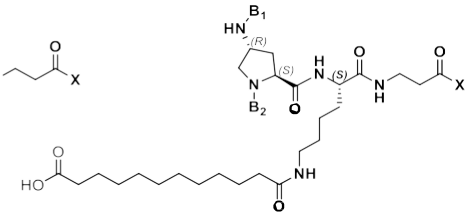
FFL-9



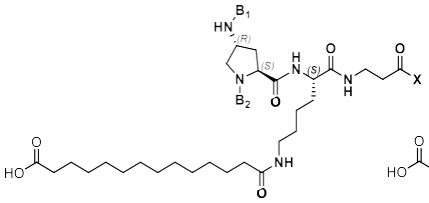
FFL-10



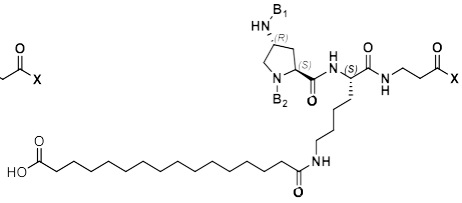
FFL-11



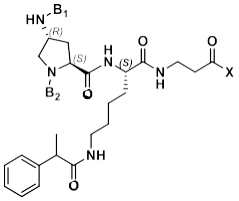
FFL-12



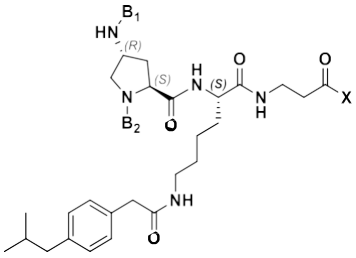
FFL-13



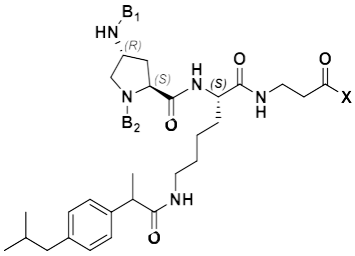
FFL-14



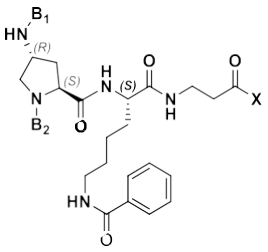
FFL-15



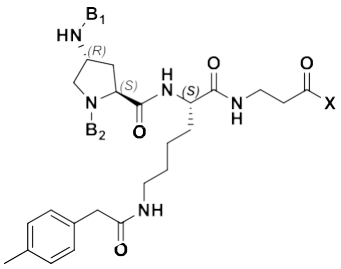
FFL-16



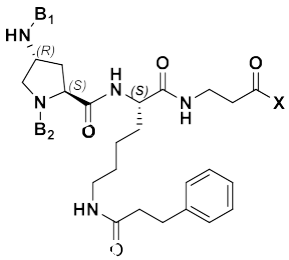
FFL-17



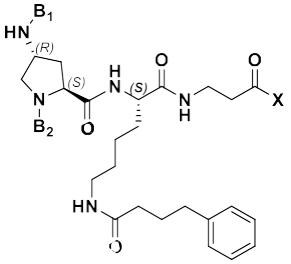
FFL-18



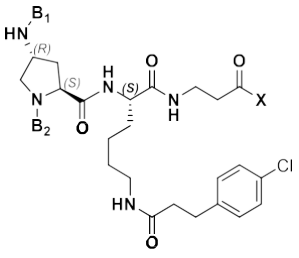
FFL-19



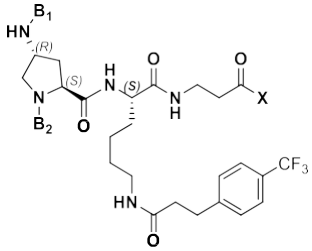
FFL-20



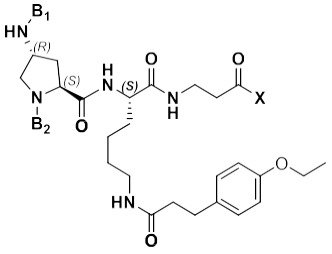
FFL-21



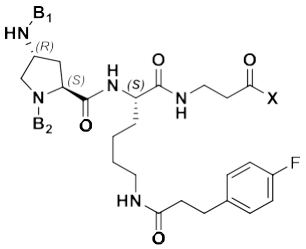
FFL-22



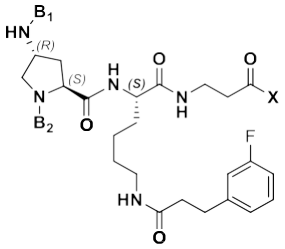
FFL-23



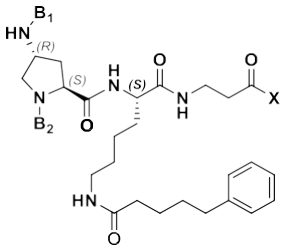
FFL-24



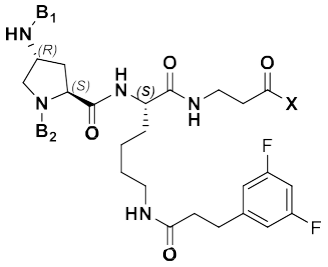
FFL-25



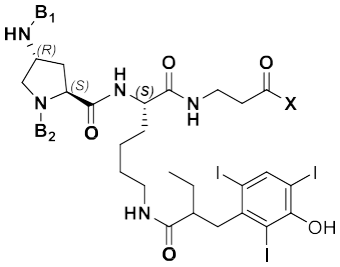
FFL-26



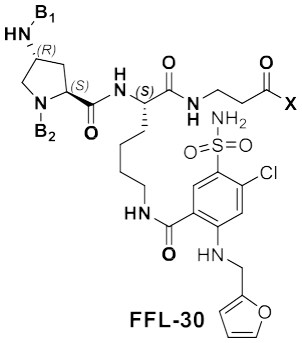
FFL-27



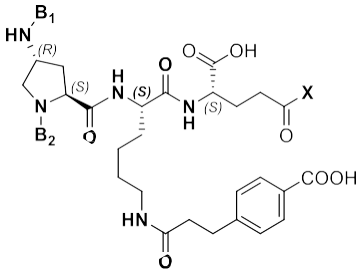
FFL-28



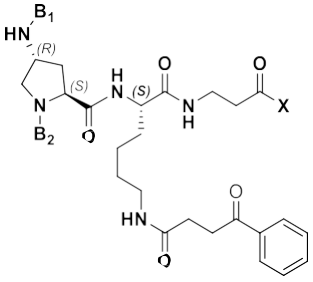
FFL-29



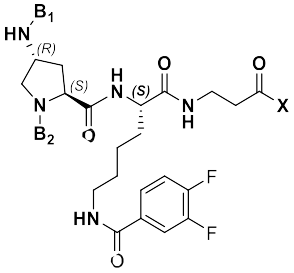
FFL-30



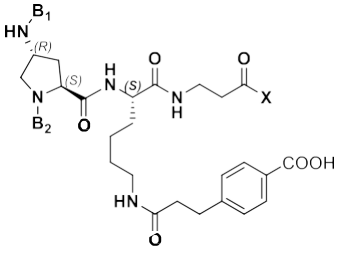
FFL-31



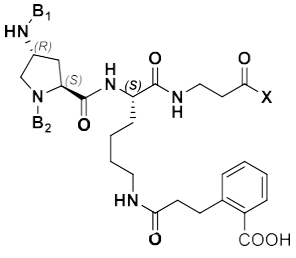
FFL-32



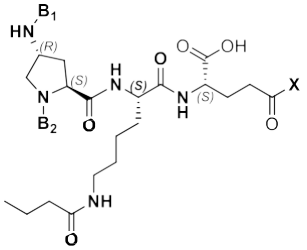
FFL-33



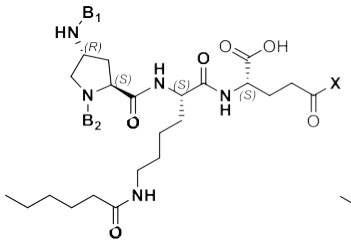
FFL-34



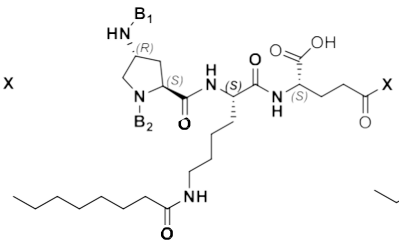
FFL-35



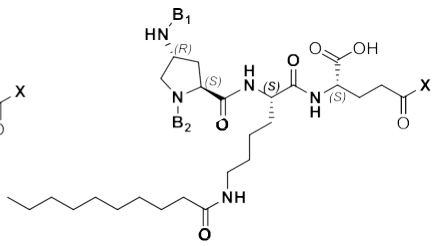
FFL-36



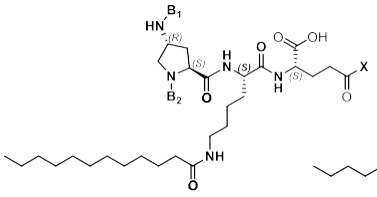
FFL-37



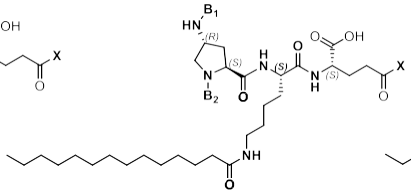
FFL-38



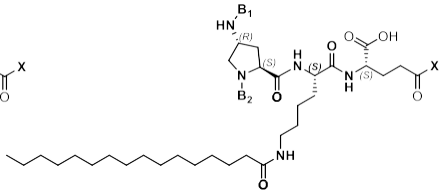
FFL-39



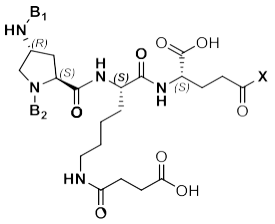
FFL-40



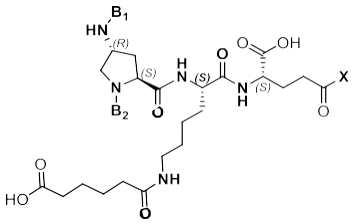
FFL-41



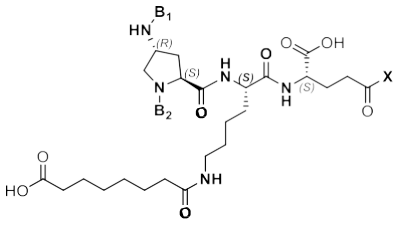
FFL-42



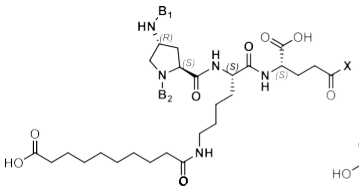
FFL-43



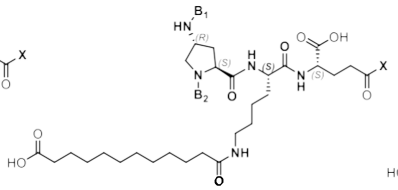
FFL-44



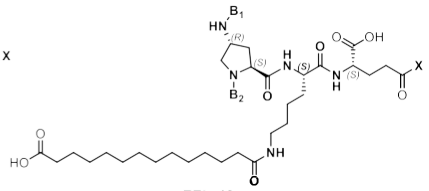
FFL-45



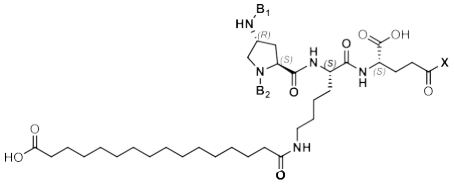
FFL-46



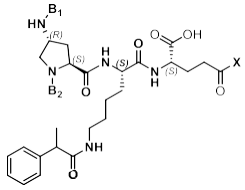
FFL-47



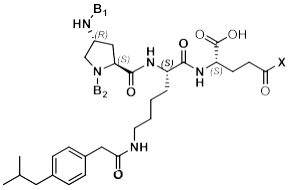
FFL-48



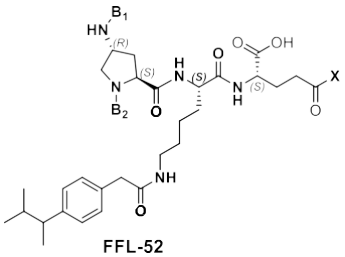
FFL-49



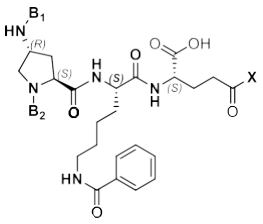
FFL-50



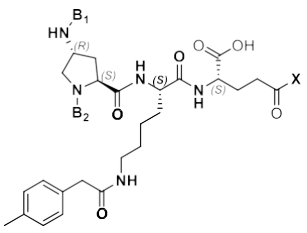
FFL-51



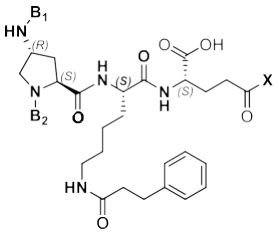
FFL-52



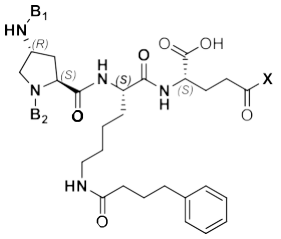
FFL-53



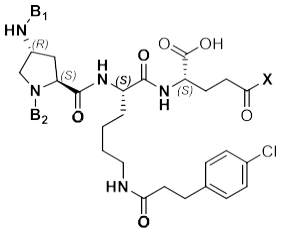
FFL-54



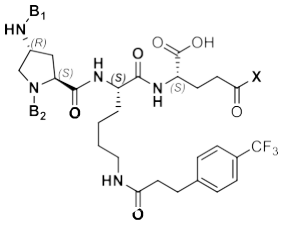
FFL-55



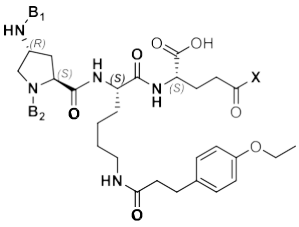
FFL-56



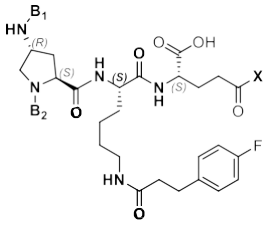
FFL-57



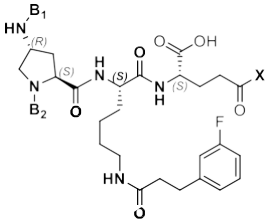
FFL-58



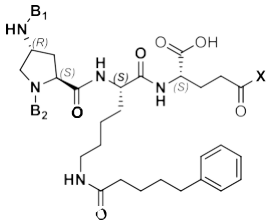
FFL-59



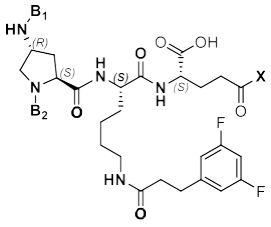
FFL-60



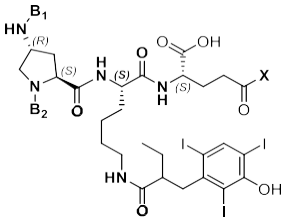
FFL-61



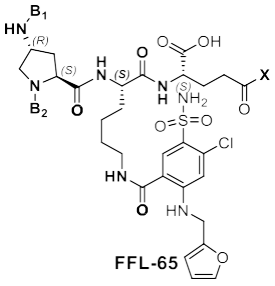
FFL-62



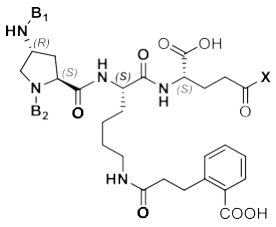
FFL-63



FFL-64

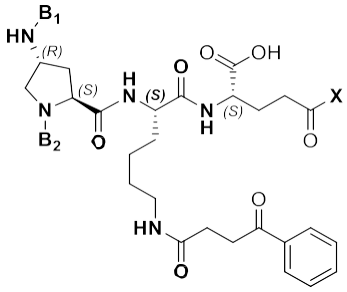


FFL-65



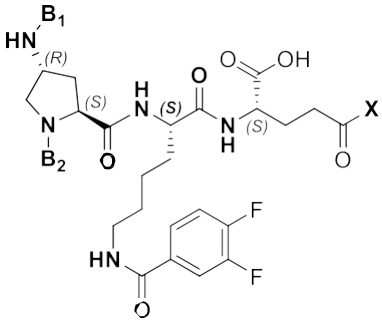
FFL-66

5



FFL-67

, y

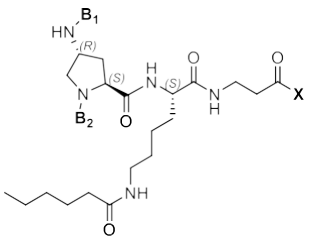


FFL-68

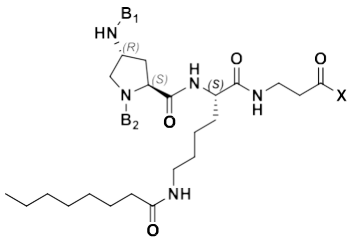
, o estereoisómeros de estos;

en donde X representa un punto de unión covalente a la amina en X1.

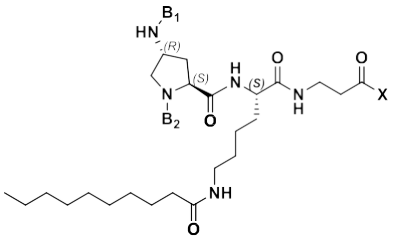
23. El compuesto de la reivindicación 7, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el B_1 y el B_2 se seleccionan independientemente de las Fórmulas F2 y F7; en donde cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, CF_3, y F, en donde cada Z1c se conjuga covalentemente a través de uno o más de Z1b con una amina de X1 y cada uno de los Z1c y el uno o más Z1b en combinación se seleccionan de las Fórmulas FFL 2-5, 9-12, 16, 20, 21, 27, 32, 34, 35, 37-40, 44-47, 51, 55, 56, 62, 66, y 67:



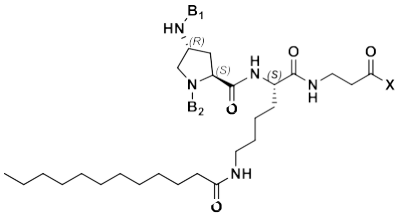
FFL-2



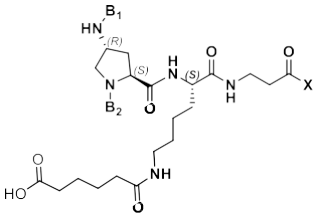
FFL-3



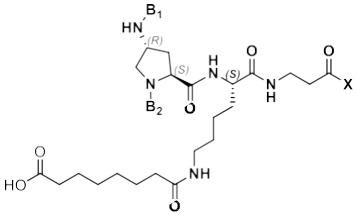
FFL-4



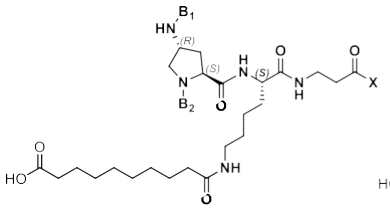
FFL-5



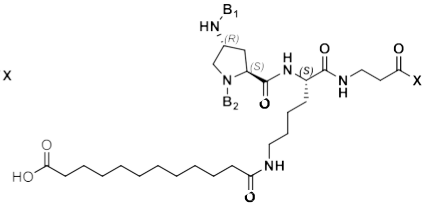
FFL-9



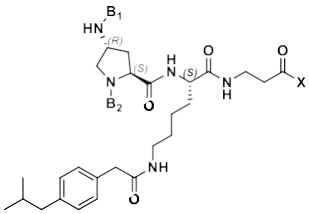
FFL-10



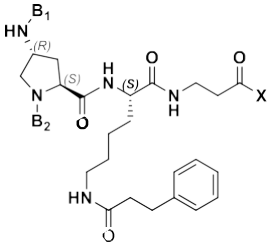
FFL-11



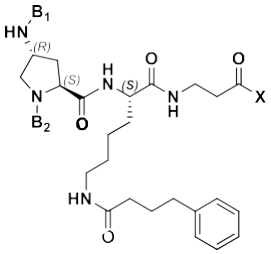
FFL-12



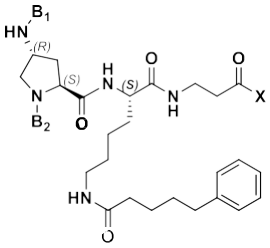
FFL-16



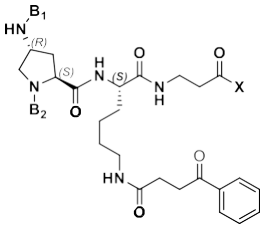
FFL-20



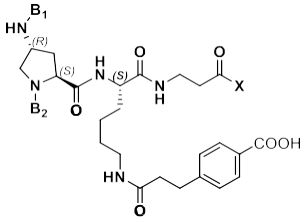
FFL-21



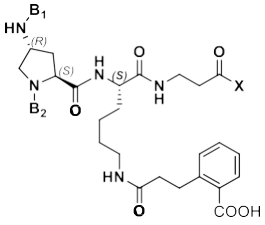
FFL-27



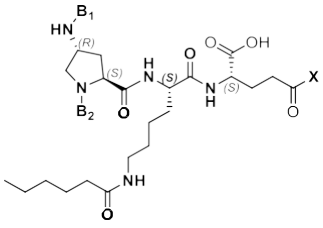
FFL-32



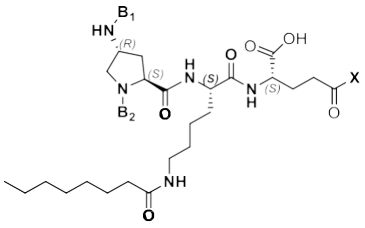
FFL-34



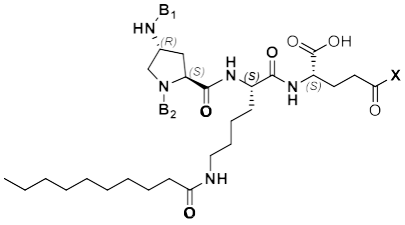
FFL-35



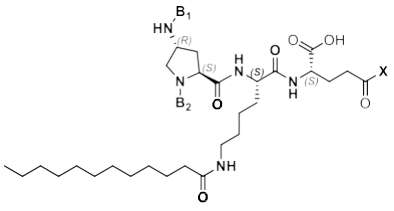
FFL-37



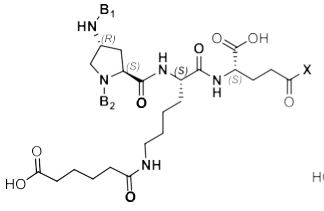
FFL-38



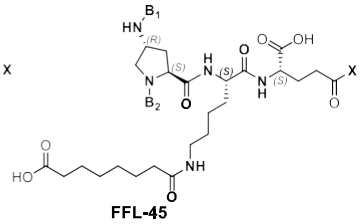
FFL-39



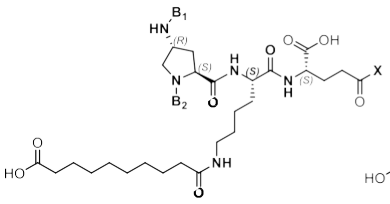
FFL-43



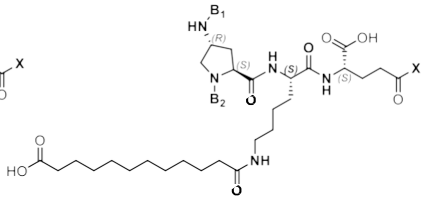
FFL-44



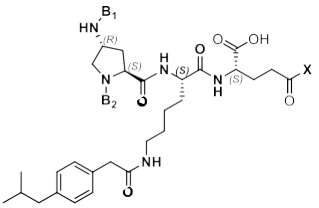
FFL-45



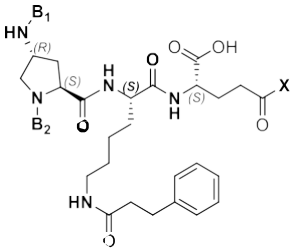
FFL-46



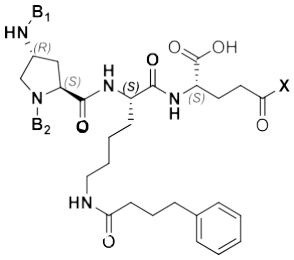
FFL-47



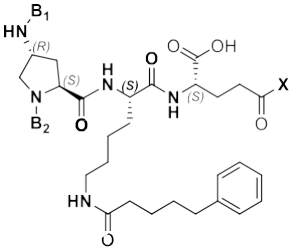
FFL-51



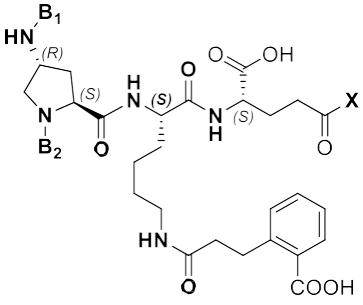
FFL-55



FFL-56

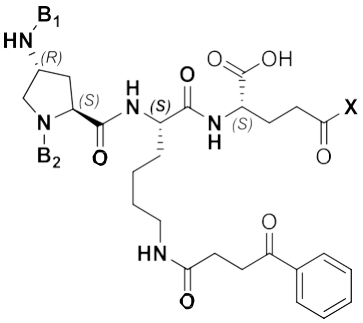


FFL-62



FFL-66

, y

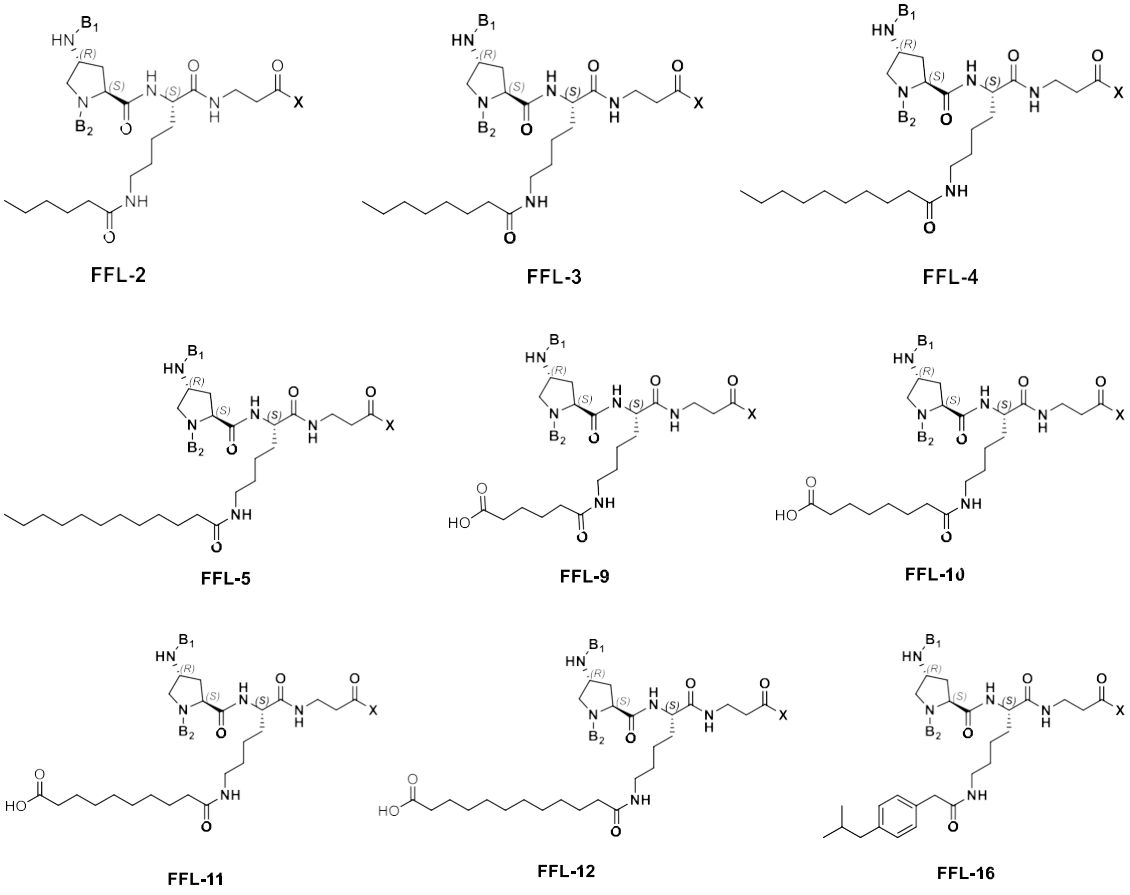


FFL-67

, o estereoisómeros de estos;

en donde X representa un punto de unión covalente a la amina en X1.

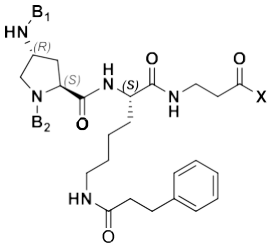
24. El compuesto de la reivindicación 7, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el B_1 y el B_2 son cada uno independientemente la Fórmula F2, en donde cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, CF_3, y F; en donde cada Z1c se conjuga covalentemente a través de uno o más de Z1b con una amina de X1 y cada uno de los Z1c y el uno o más Z1b en combinación se seleccionan de las Fórmulas FFL 2-5, 9-12, 16, 20, 21, 27, 32, 34, 35, 37-40, 44-47, 51, 55, 56, 62, 66, y 67:



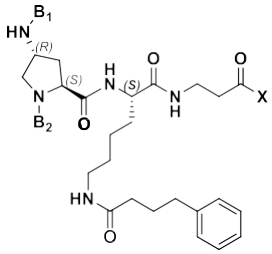
FFL-2 FFL-3 FFL-4

FFL-5 FFL-9 FFL-10

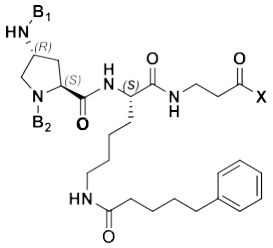
FFL-11 FFL-12 FFL-16



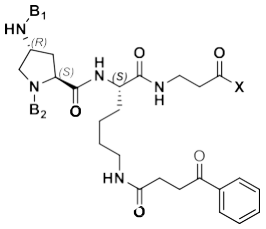
FFL-20



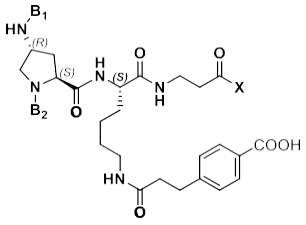
FFL-21



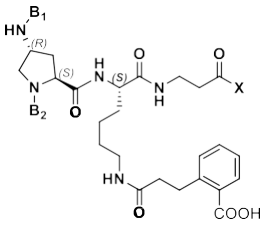
FFL-27



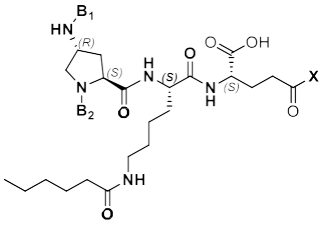
FFL-32



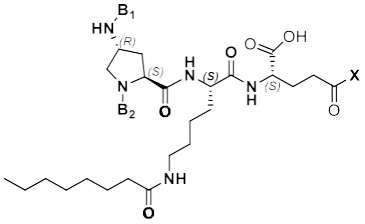
FFL-34



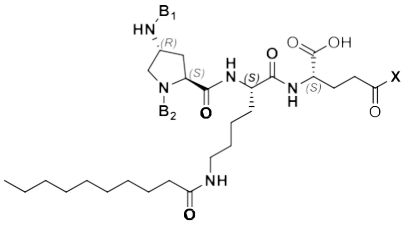
FFL-35



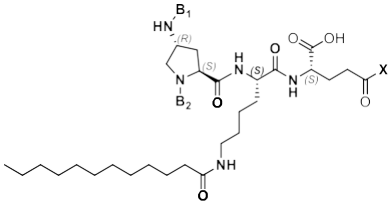
FFL-37



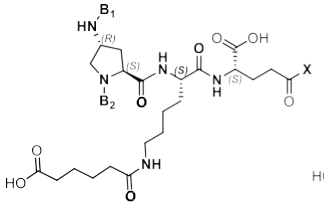
FFL-38



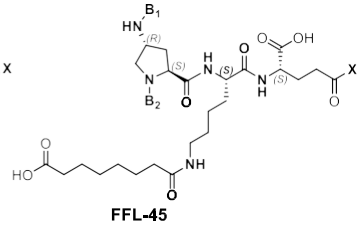
FFL-39



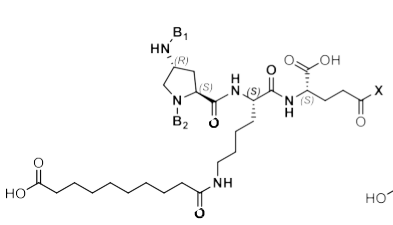
FFL-40



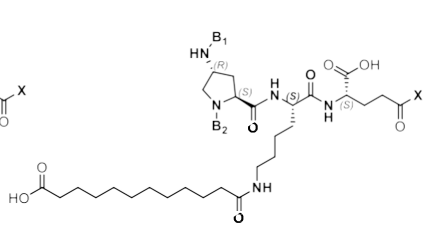
FFL-44



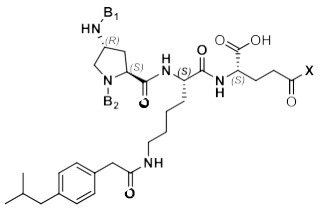
FFL-45



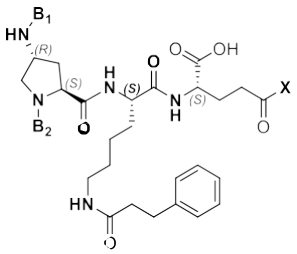
FFL-46



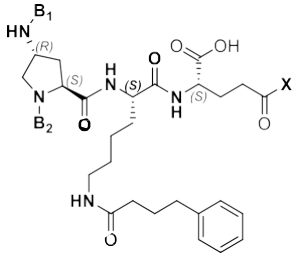
FFL-47



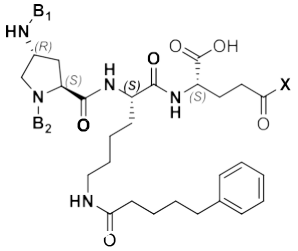
FFL-51



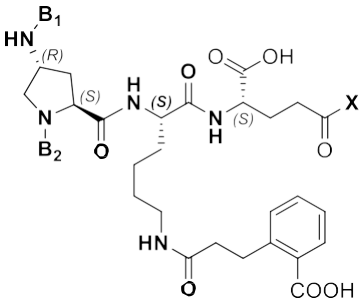
FFL-55



FFL-56

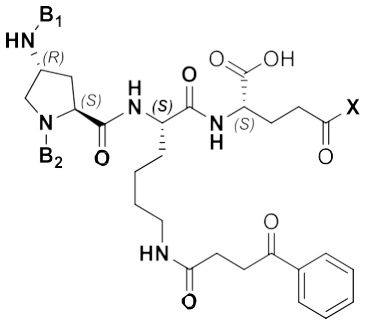


FFL-62



FFL-66

, y



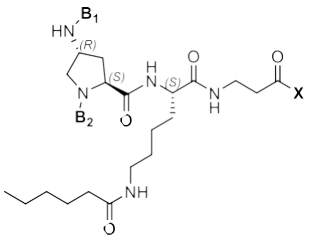
FFL-67

, o estereoisómeros de estos;

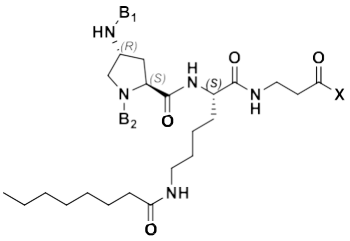
en donde X representa un punto de unión covalente a la amina en X1.

25. El compuesto de la reivindicación 11, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el B_1 y el B_2 son cada uno independientemente la Fórmula F7A, en donde cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, CF_3, y F; en donde cada Z1c se conjuga covalentemente a través de uno o más de Z1b con una amina de X1 y cada uno de los Z1c y el uno o más Z1b en combinación se seleccionan de las

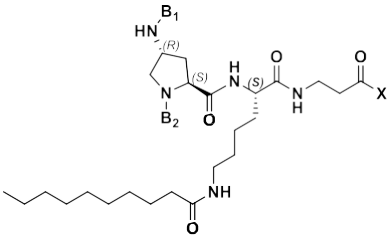
Fórmulas FFL 2-5, 9-12, 16, 20, 21, 27, 32, 34, 35, 37-40, 44-47, 51, 55, 56, 62, 66, y 67:



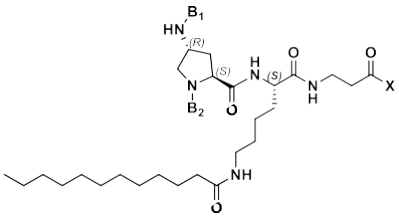
FFL-2



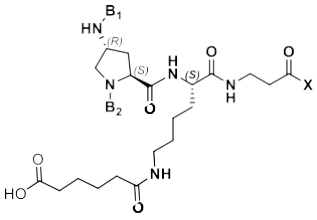
FFL-3



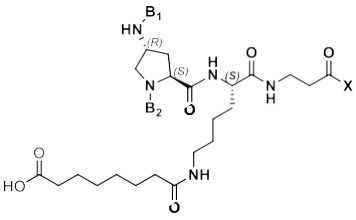
FFL-4



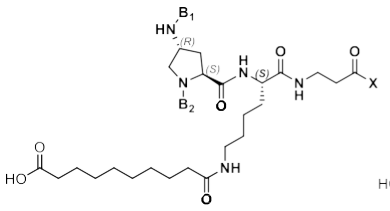
FFL-5



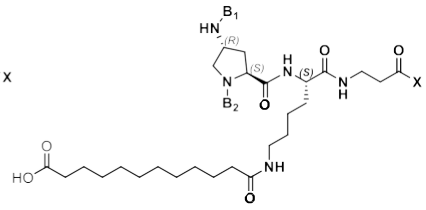
FFL-9



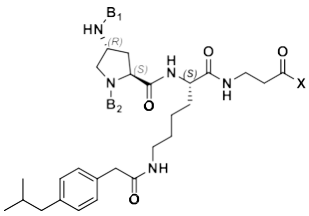
FFL-10



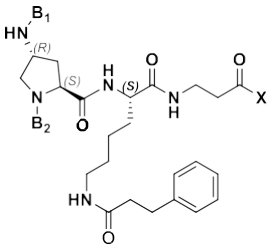
FFL-11



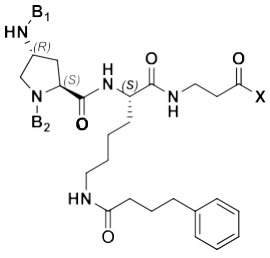
FFL-12



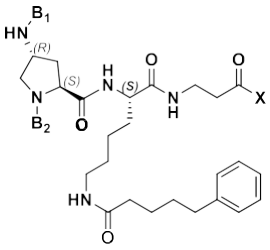
FFL-16



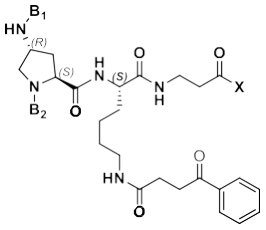
FFL-20



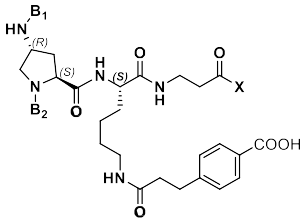
FFL-21



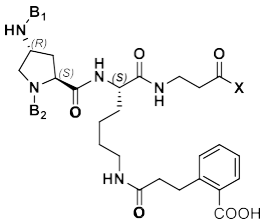
FFL-27



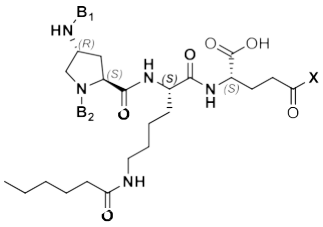
FFL-32



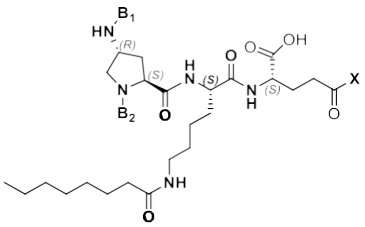
FFL-34



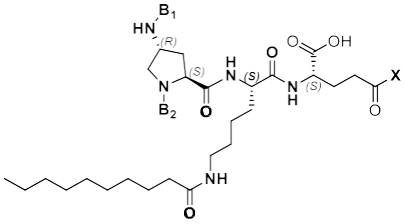
FFL-35



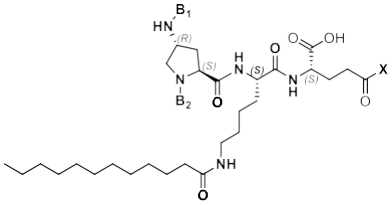
FFL-37



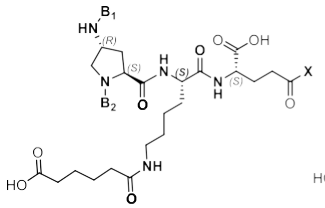
FFL-38



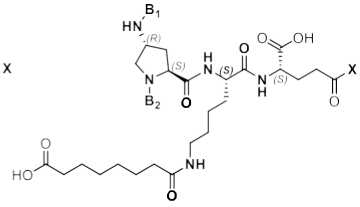
FFL-39



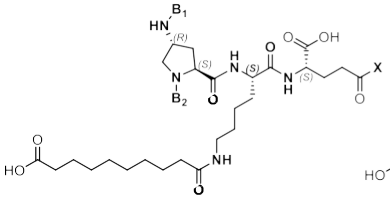
FFL-40



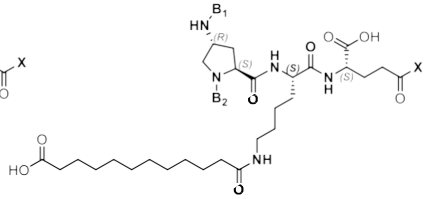
FFL-44



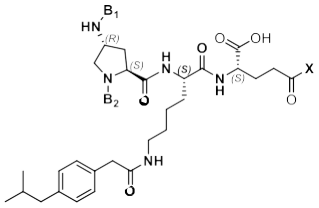
FFL-45



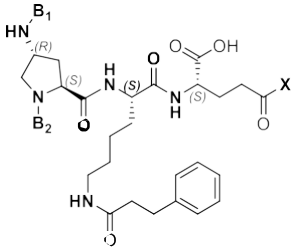
FFL-46



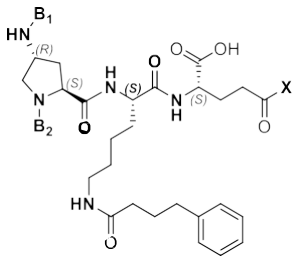
FFL-47



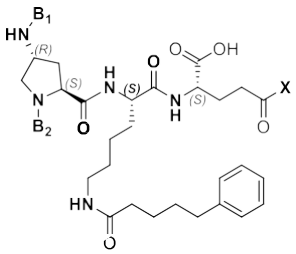
FFL-51



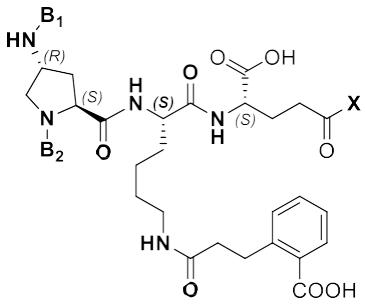
FFL-55



FFL-56

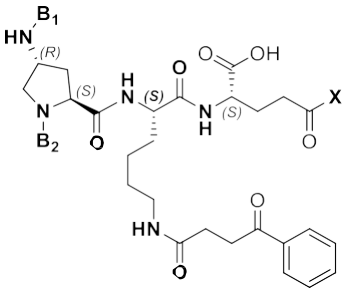


FFL-62



FFL-66

, y



FFL-67

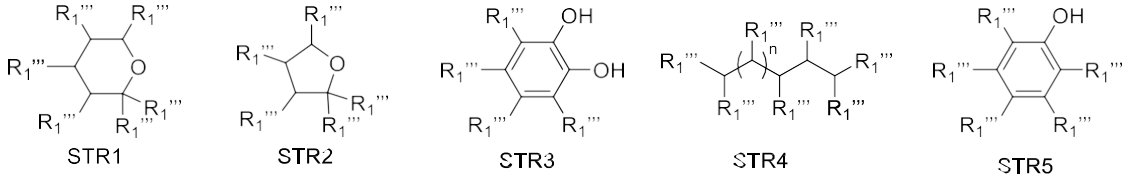
, o estereoisómeros de estos;

en donde X representa un punto de unión covalente a la amina en X1.

26. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el compuesto tiene afinidad para unirse a una o más proteínas glicadas o proteínas glicosiladas y/o porciones de azúcar o sacáridos o polisacáridos en la superficie de las células.

27. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde q' es al menos 2, y en donde al menos uno de los Z1c es una porción de azúcar, una porción que contiene diol, y una porción que contiene poliol.

28. El compuesto de la reivindicación 27, o sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el Z1c se selecciona de las Fórmulas STR1, STR2, STR3, STR4, y STR5:



en donde:

un R_1''' representa el punto de unión a un Z1b;

cada átomo de carbono unido a un R_1''' tiene independientemente estereoquímica (R) o (S);

cada R_1''' restante se selecciona independientemente de —H, —OR^3, —$N(R^3)_2$, —SR^3, —OH, —OCH_3, —OR^5, NHC(O)CH_3, —CH_2R^3, —C(O)NHOH, —NHC(O)CH_3, —CH_2OH, —CH_2OR^5, —NH_2, —CH_2R^4, —R^6, y —R^7, en donde en STR1, STR2, y STR4 al menos uno del R_1 restante es OH,

cada R^3 se selecciona independientemente de —H, acetilo, fosfato, —R^2, —SO_2R^2, —$S(O)R^2$, —$P(O)(OR^2)_2$, —$C(O)R^2$, —CO_2R^2, y —$C(O)N(R^2)_2$,

cada R^2 se selecciona independientemente de —H, un anillo alifático C_{1-6}, un anillo fenilo, un anillo heteroarilo monocíclico de 5-6 miembros que tiene 1-4 heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno, y azufre, un anillo heterocíclico de 4-7 miembros que tiene 1-2 heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, y un alquilo C_1-C_6,

cada R^4 se selecciona independientemente de —H, —OH, —OR^3, —$N(R^3)_2$, —OR^5 y —SR^3;

cada R^5 se selecciona independientemente de un monosacárido, un disacárido, un trisacárido, una pentosa y una hexosa,

cada R^6 se selecciona independientemente de —$NCOCH_2$—, —$(OCH_2CH_2)_n$—, un grupo —O—alquileno C_{1-9}, y un grupo alquileno C_{1-9} sustituido en el que uno o más grupos metileno son opcionalmente reemplazados por —O—, —$(CH_2)_n$—, —OCH_2—, —$N(R^2)C(O)$—, —$N(R^2)C(O)N(R^2)$—, —SO_2—, —$SO_2N(R^2)$—, —$N(R^2)SO_2$—, —S—, —$N(R^2)$—, —C(O)—, —OC(O)—, —C(O)O—, —$C(O)N(R^2)$—, o —$N(R^2)SO_2N(R^2)$—, en donde el índice n es 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, u 8,

cada R^7 se selecciona independientemente de —$N(R^2)_2$, —F, —Cl, —Br, —I, —SH, —OR^2, —SR^2, —NH_2, —N_3, —$C{\equiv}CR^2$, —$CH_2C{\equiv}CH$, —$C{\equiv}CH$, —CO_2R^2, —$C(O)R^2$,—OSO_2R^2 —$N(R^2)_2$, —OR^2, —SR^2, y —CH_3, —CH_2NH_2, y

las estructuras STR1, STR2, STR3, STR4, y STR5 incluyen opcionalmente uno o más grupos protectores acetilo, acetileno, acetónido, y/o pinacol.

29. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde X1 comprende una hormona humana polipeptídica, un agonista del receptor de insulina, una hormona endocrina, insulina, insulina humana, glucagón, amilina, relaxina, GLP-1, GIP, oxintomodulina, somatostatina, polipéptido inhibidor gástrico, polipéptido insulinotrópico dependiente de glucosa, un péptido híbrido que comprende secuencias de dos o más hormonas polipeptídicas humanas, o un análogo de cualquiera de estos.

30. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-2 y 19-29, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde:

X1 comprende una insulina que tiene una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 1, 25, 24051, y 24052, y opcionalmente la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 24060, 24061, 24062, 24063, 24064, y 25000–25397.

31. El compuesto de la reivindicación 30, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde:

X1 comprende una insulina que tiene una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 1, 24051, y 24052, y

en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 24063, 25095, 25228, 25229, 25232, 25236, 25305, 25308, 25312, y 25380-25397;

cada Z1b se selecciona independientemente de FL3, FL5, FL5A, FL5B, FL65A, FL65B, FL69A, y FL69B;

cada Z1c se selecciona independientemente de FF12A, FF12B, FF12C, FF12D, FF116A, FF116B, FF116C, FF116D, y FF227, en donde cada Z1c se conjuga covalentemente a través de uno o más de Z1b a un residuo de lisina en X1; y

B_1 y B_2 son cada uno independientemente de la Fórmula F2 o Fórmula F7.

32. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde:

cada B_1 y B_2 se selecciona independientemente de F2 y F7 y se conjuga covalentemente a Z1c usando un enlace amida,

cada Z1b se selecciona independientemente de (i) FL3, en donde p es 1, 2, o 3; (ii) FL5B, en donde p es 2, 3, o 4; (iii) FL65A; y (iv) FL69A, en donde p es 2, 3, o 4;

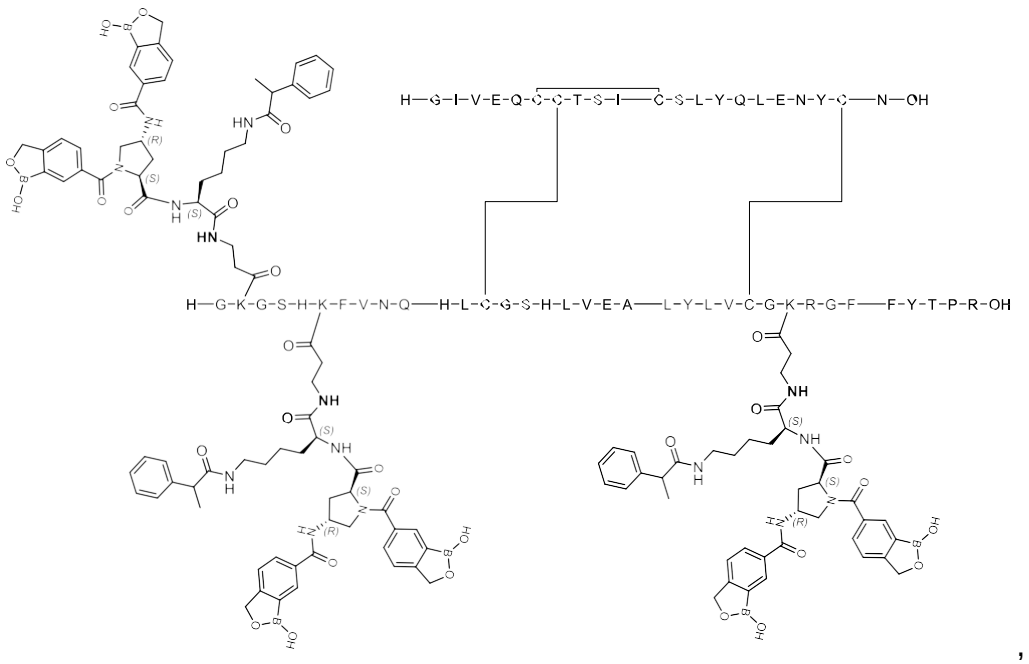
cada Z1c se selecciona independientemente de FF12A, FF116A, y FF227, en donde cada Z1c se conjuga covalentemente a través de uno o más del Z1b a un residuo de lisina en X1; y

X1 es un polipéptido que comprende un agonista del receptor de insulina que tiene una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 1, 24051, y 24052, y en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 24063, 25095, 25228, 25229, 25232, 25236, 25305, 25308, 25312, y 25380-25397, y en donde al menos dos lisinas en X1 se conjugan cada una independientemente con Z1b.

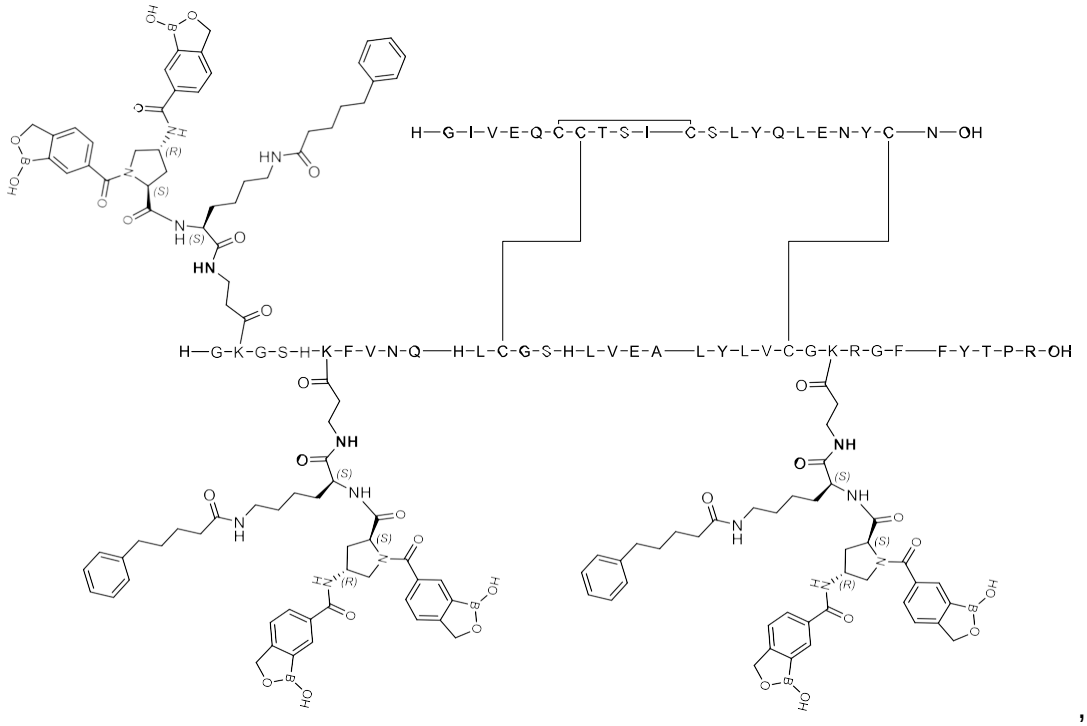
33. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde al menos un Z1c es FF227 e i es 1.

34. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, en donde el compuesto se selecciona de:

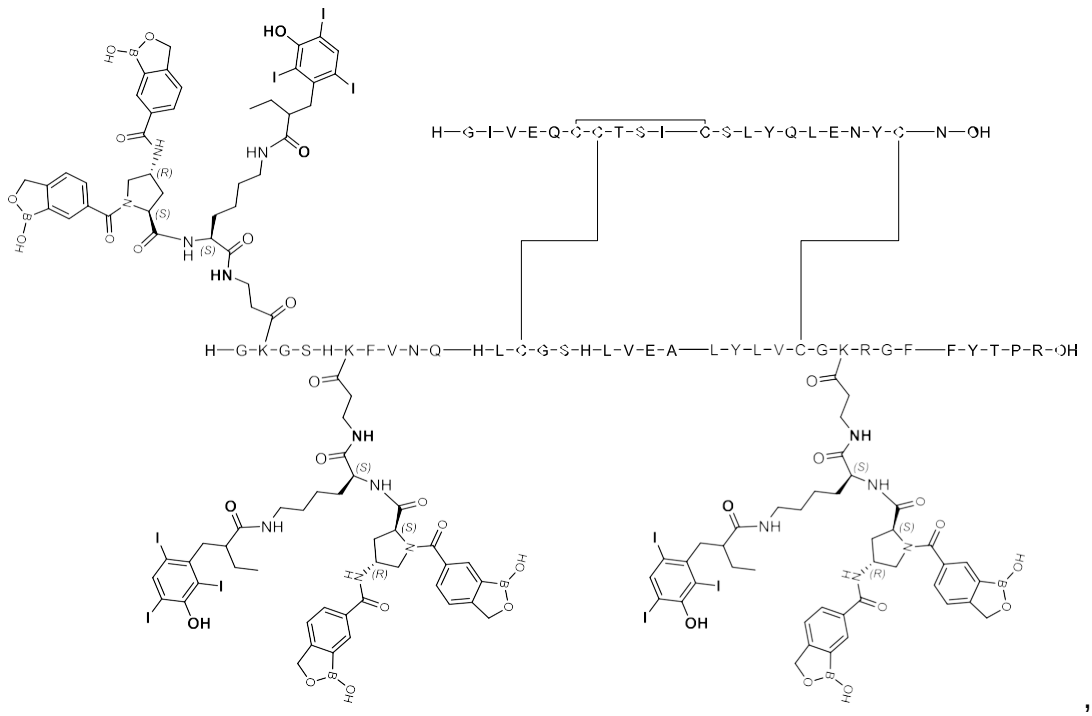
Ejemplo 1A:



Ejemplo 2A:

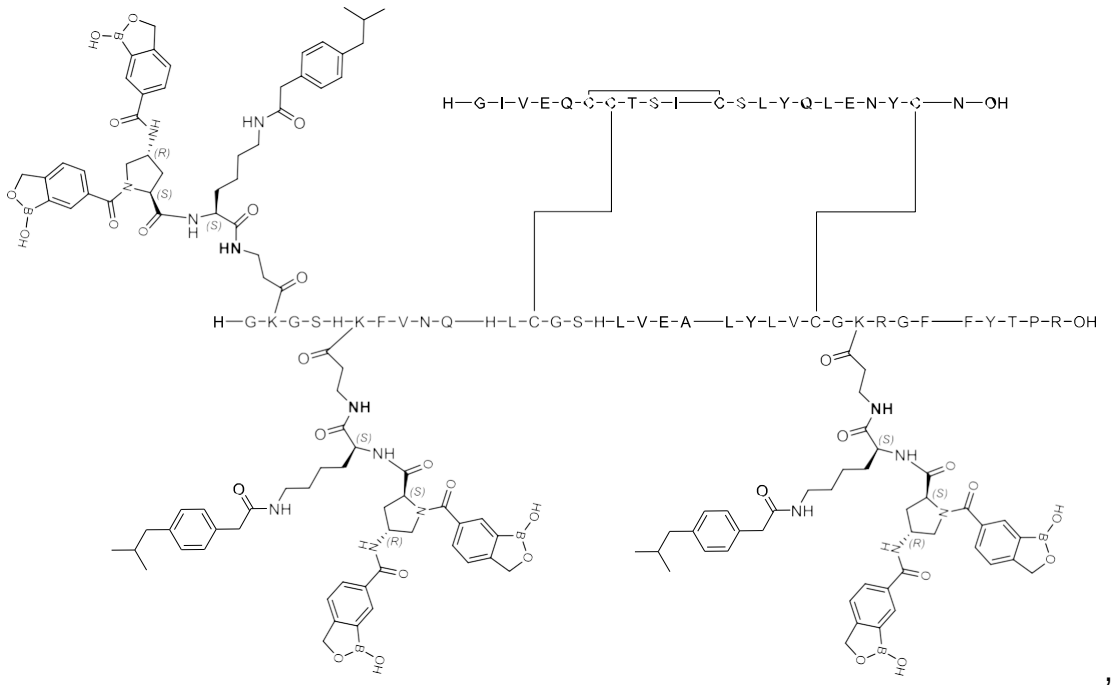


Ejemplo 3A:



,

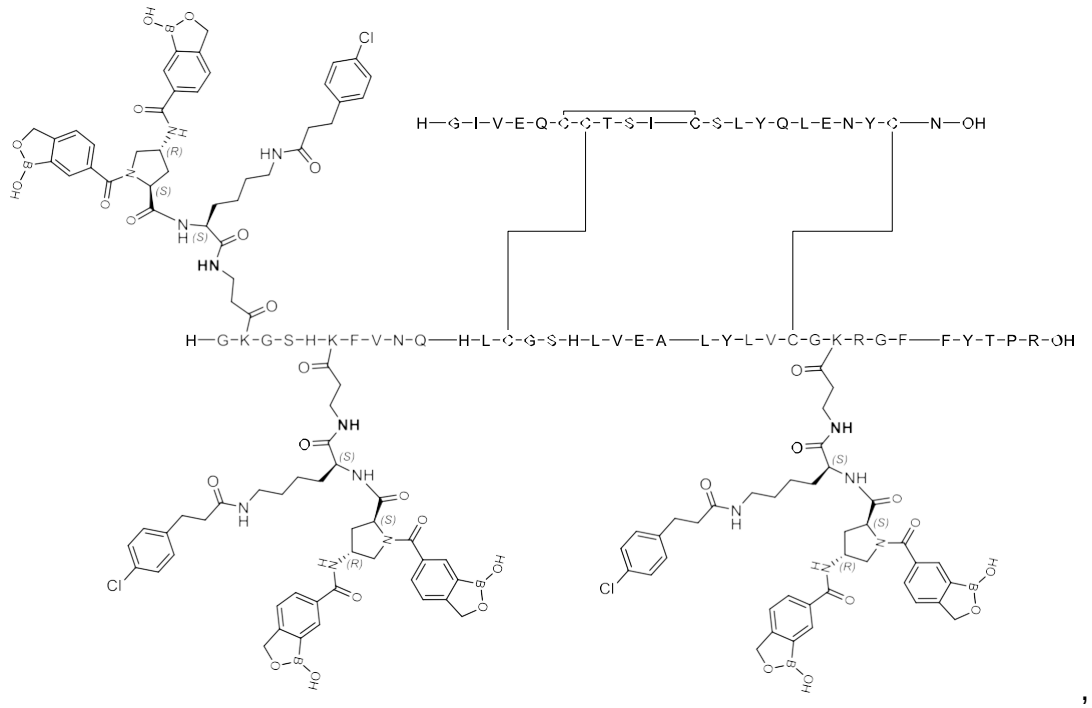
Ejemplo 4A:



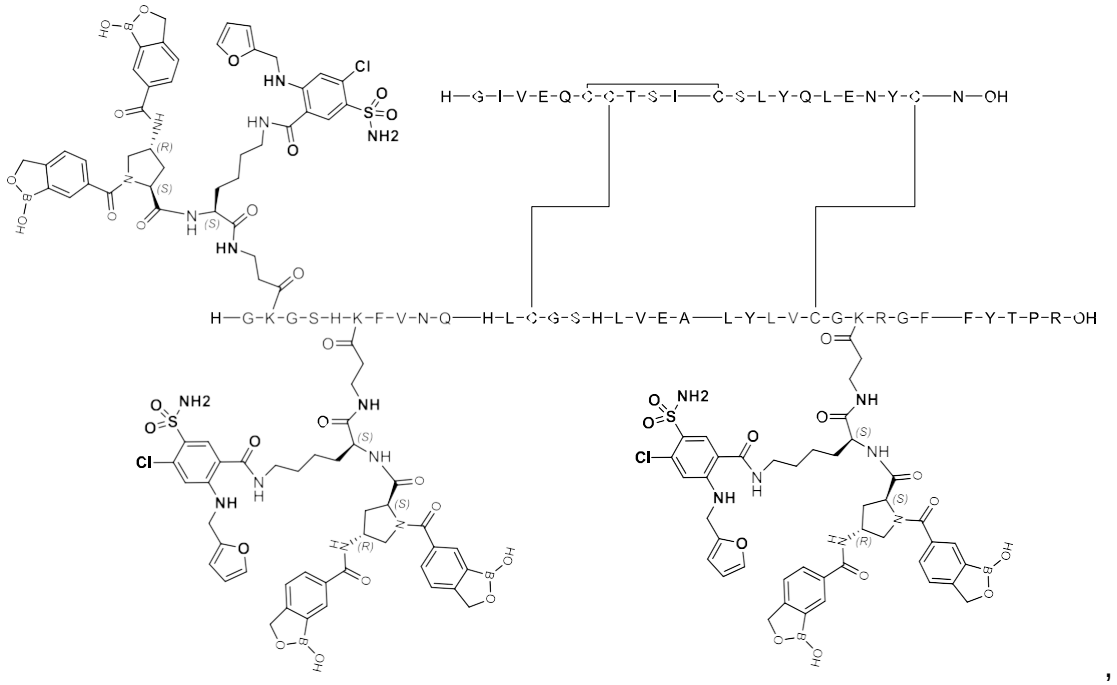
,

5

Ejemplo 5A:

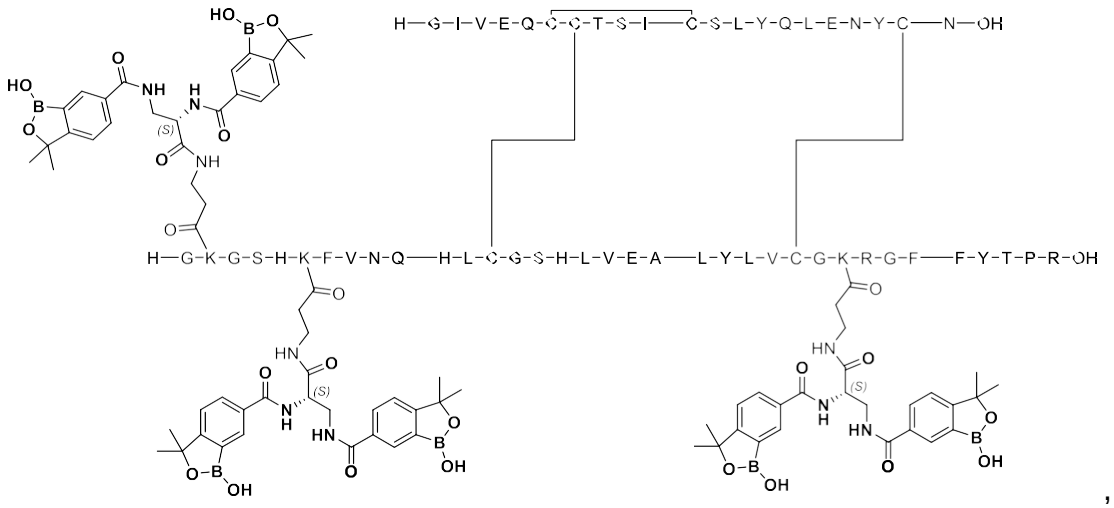


Ejemplo 6A:

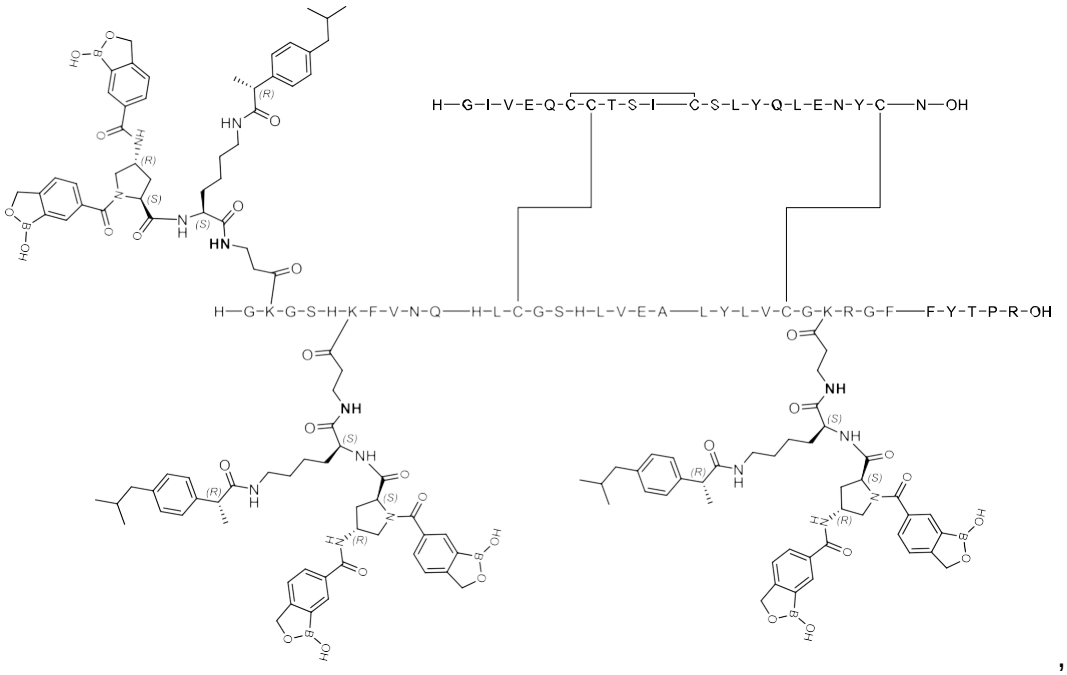


5

Ejemplo 7A:

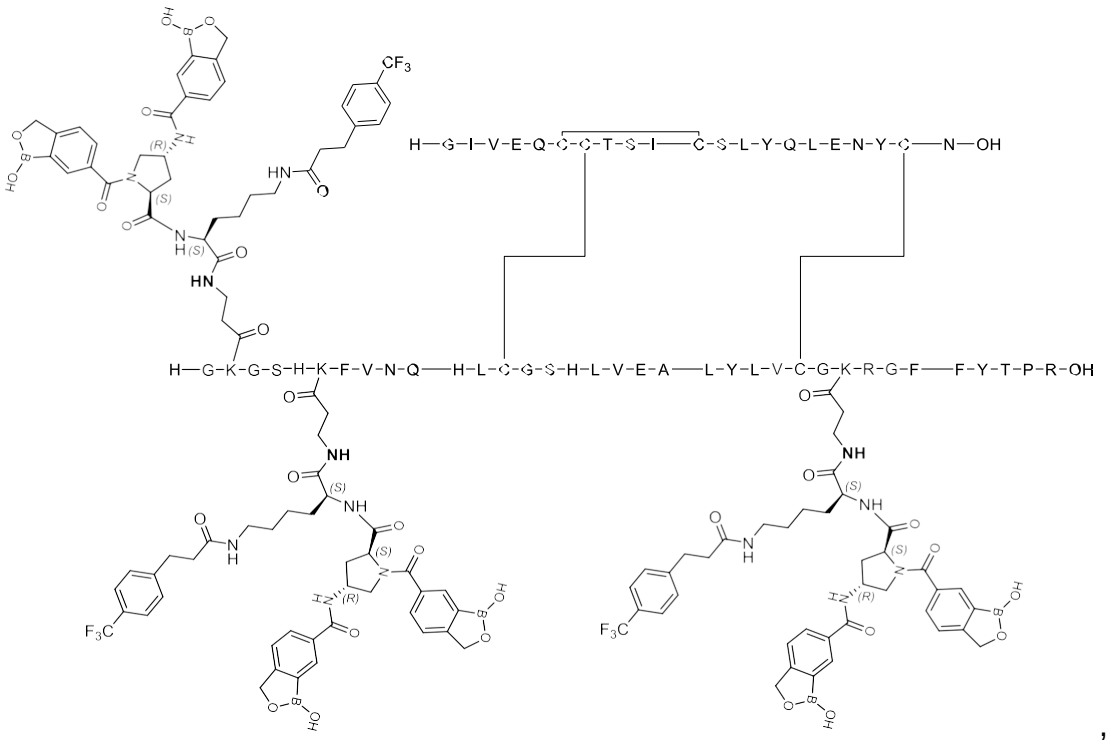


Ejemplo 8A:

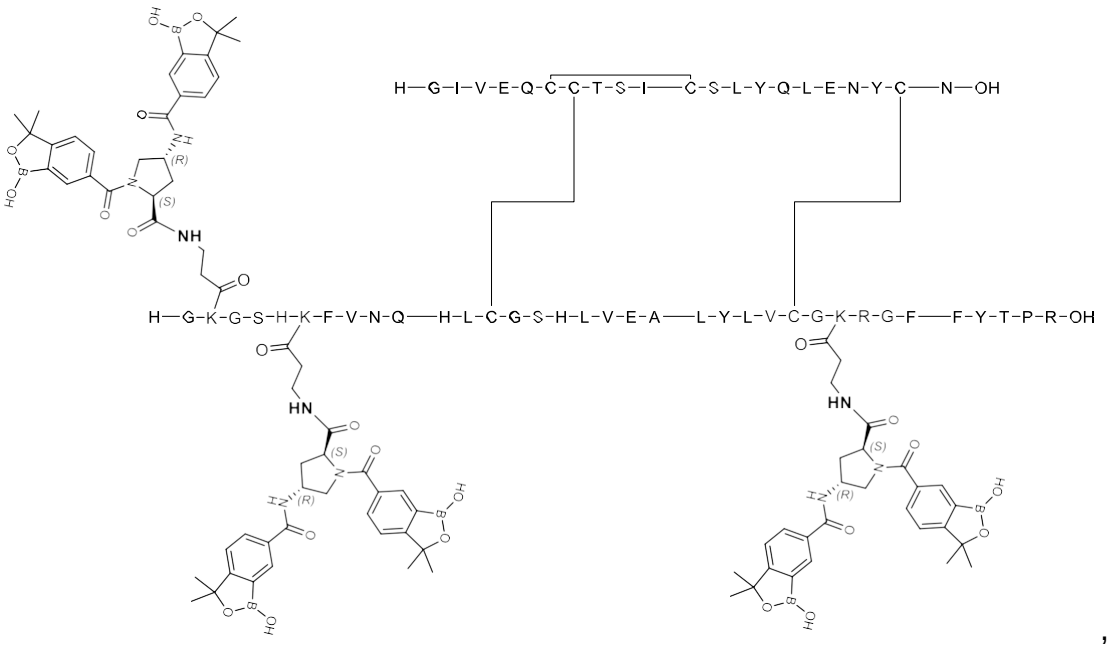


5

Ejemplo 9A:

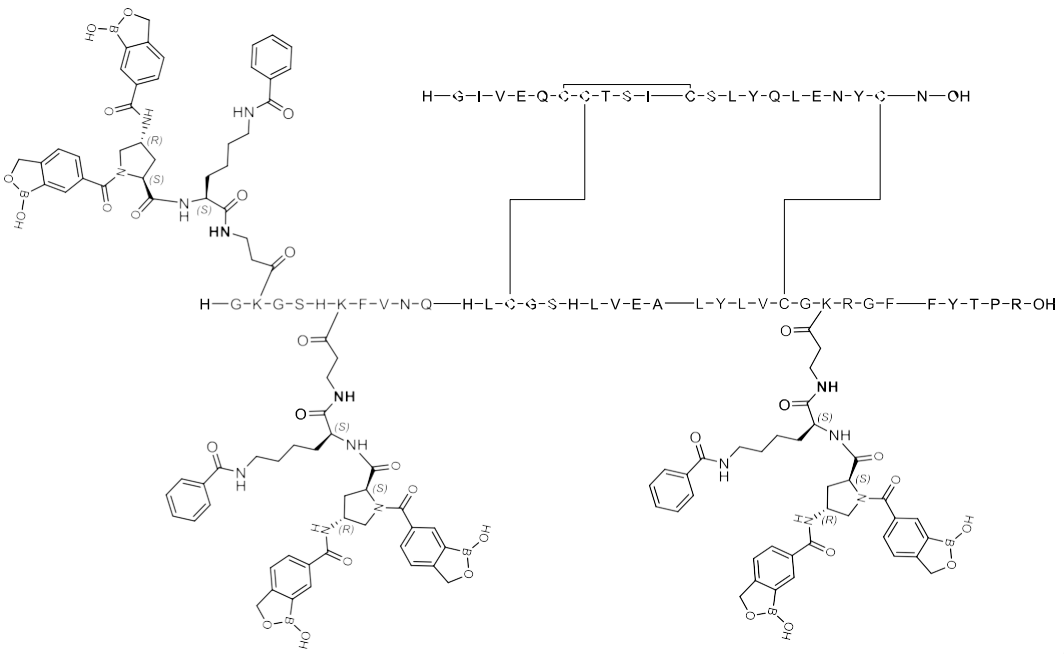


Ejemplo 10A:



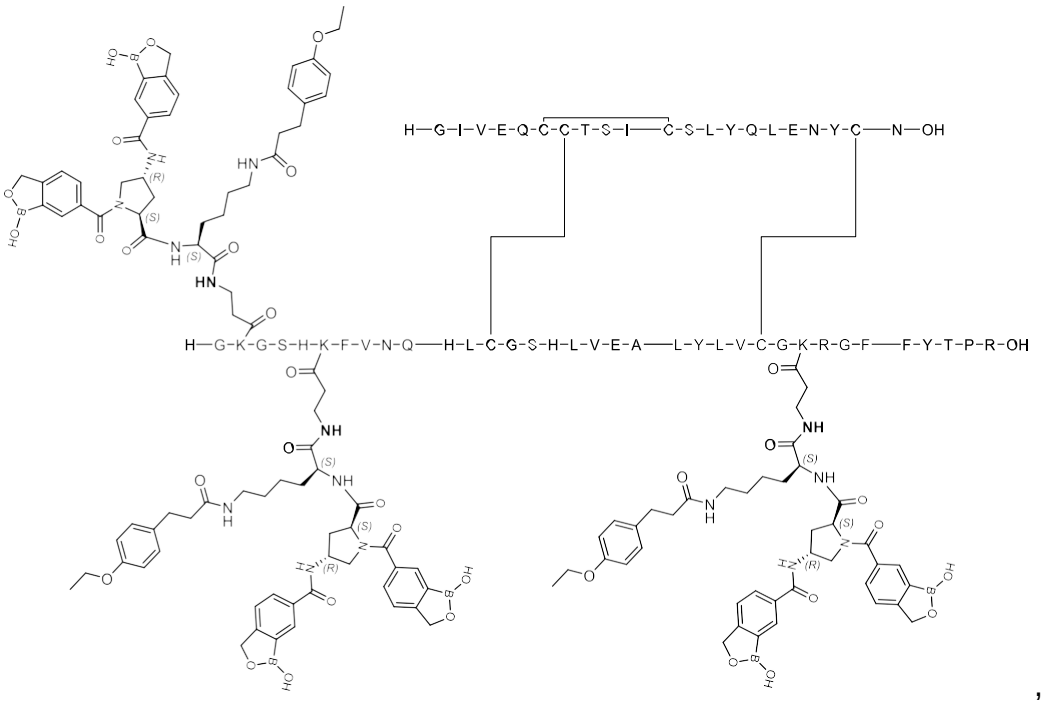
5

Ejemplo 11A:



,

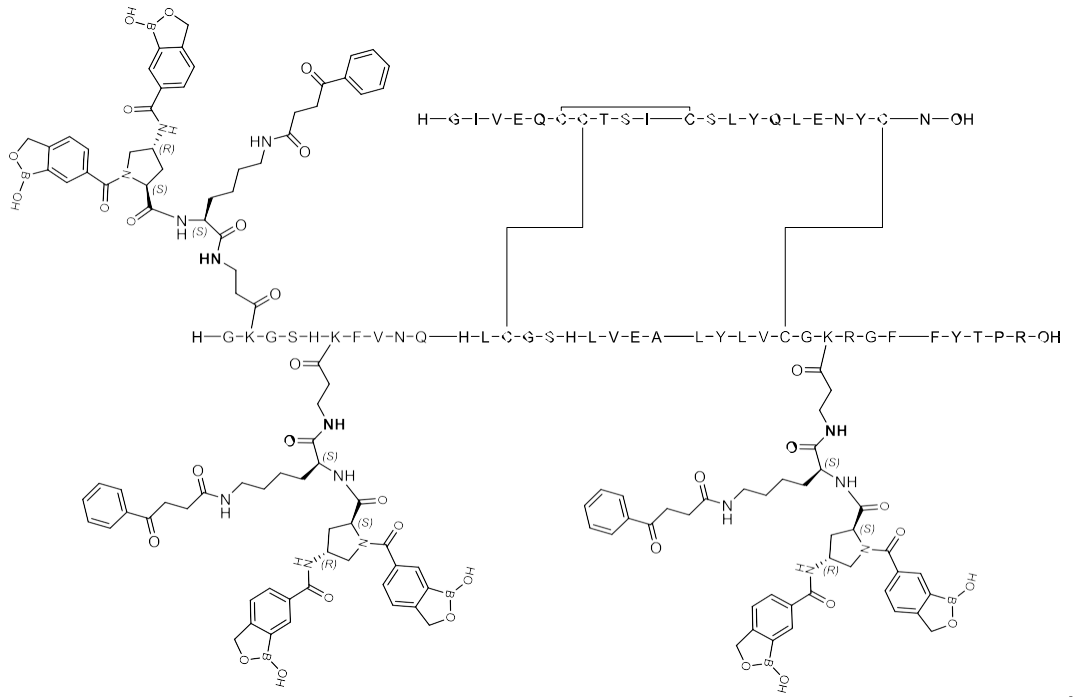
Ejemplo 12A:



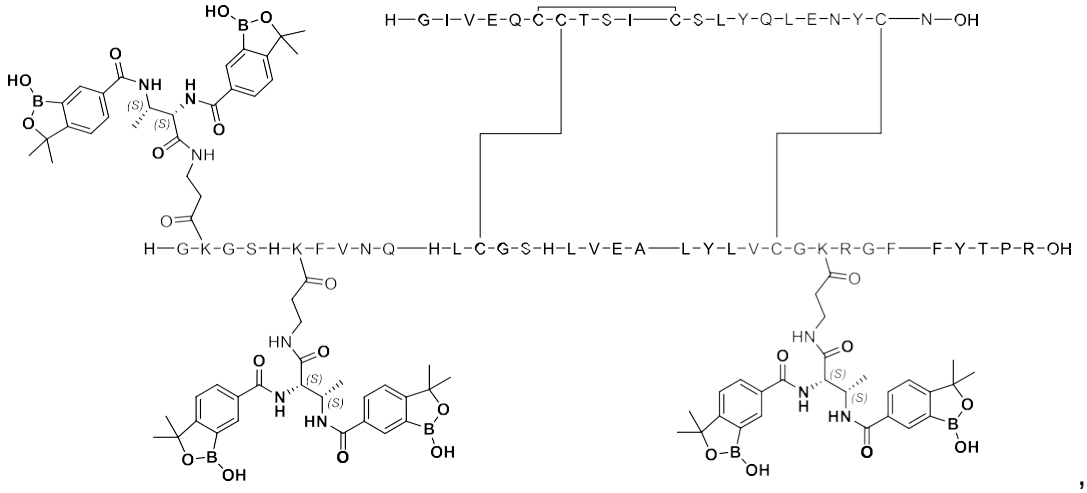
,

5

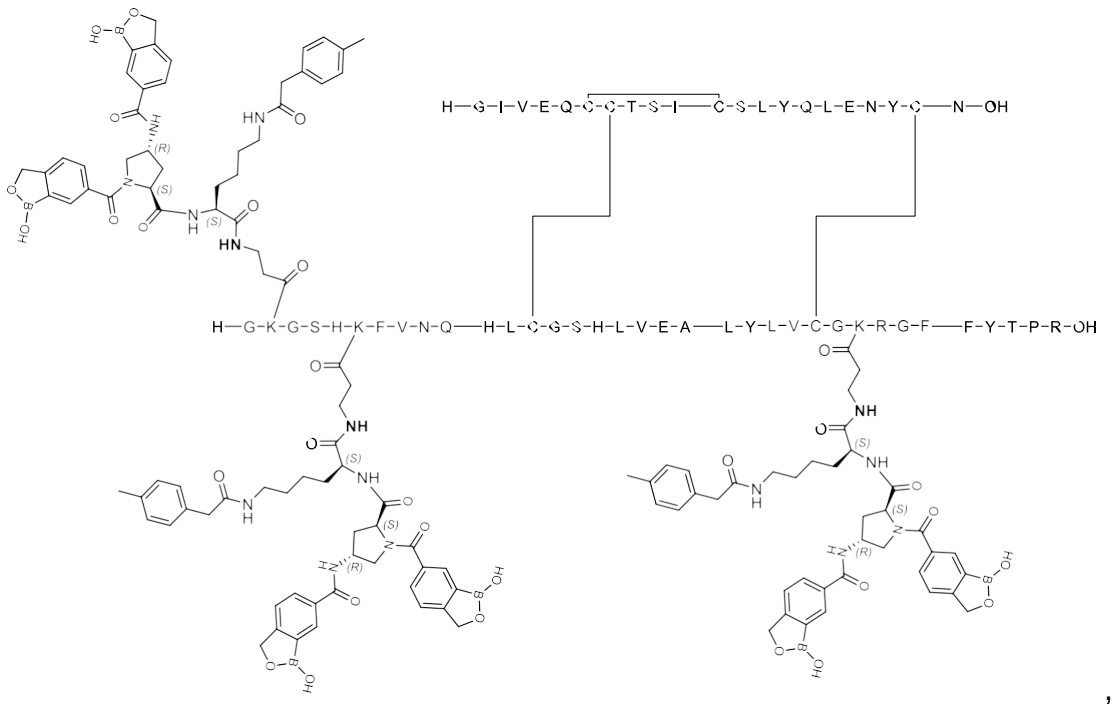
Ejemplo 13A:



Ejemplo 14A:

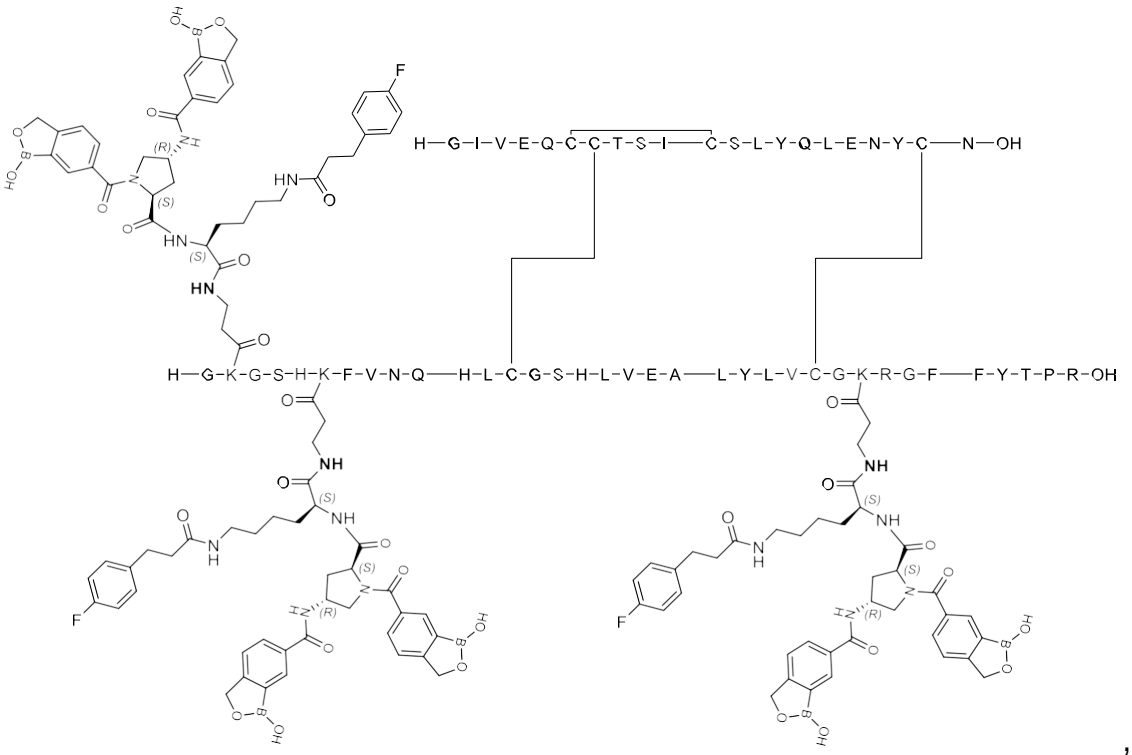


Ejemplo 15A:



,

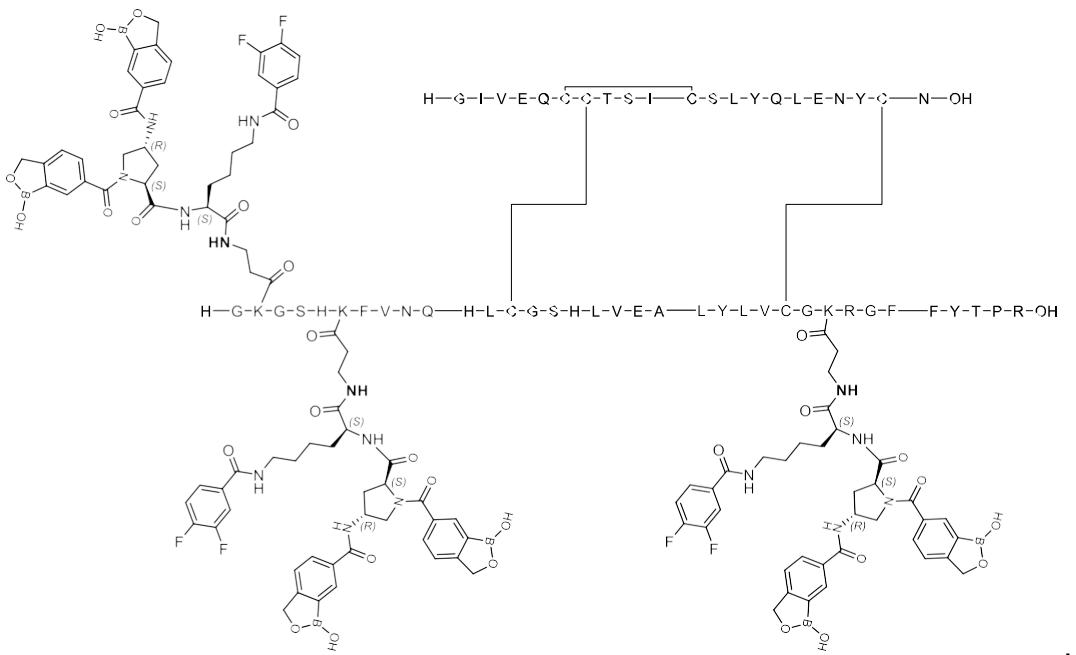
Ejemplo 16A:



,

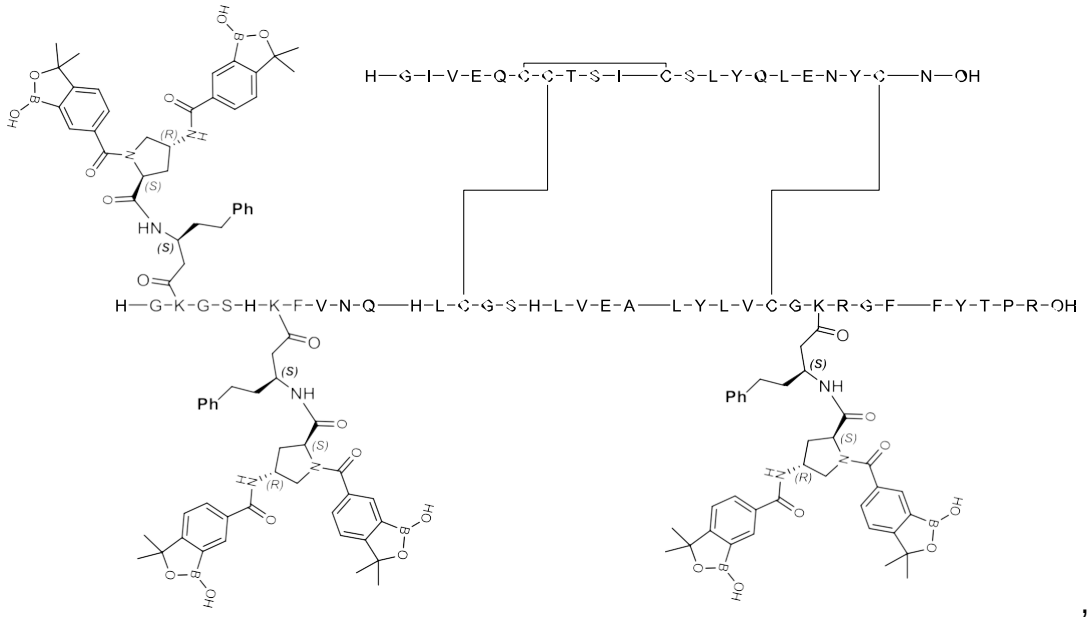
5

Ejemplo 17A:



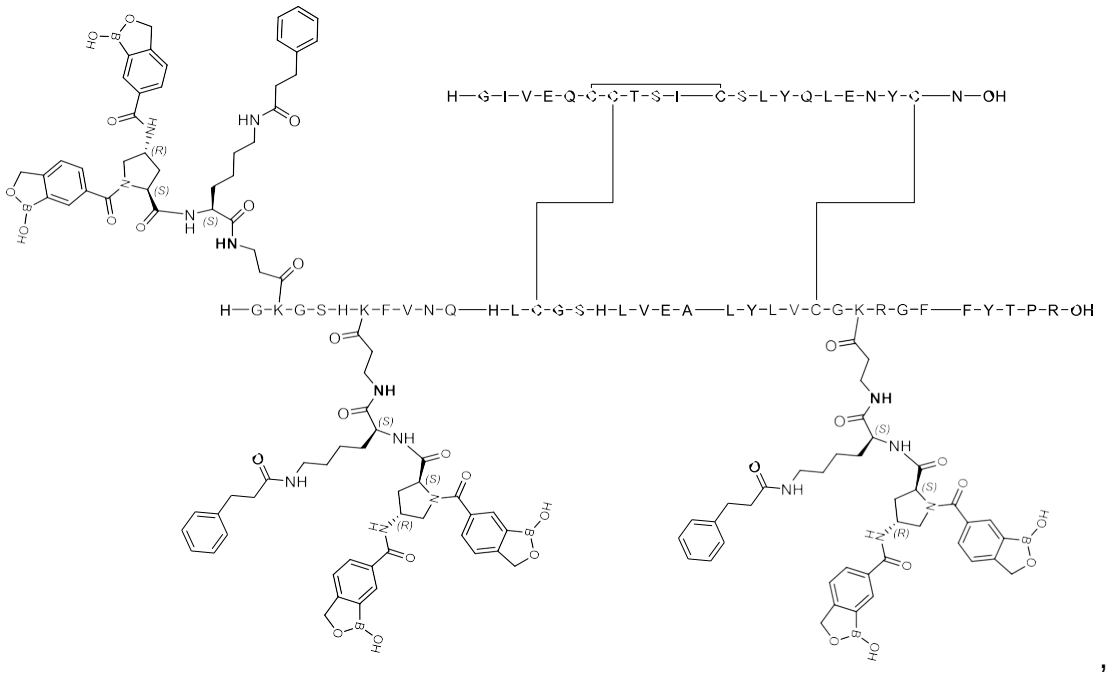
,

Ejemplo 18A:



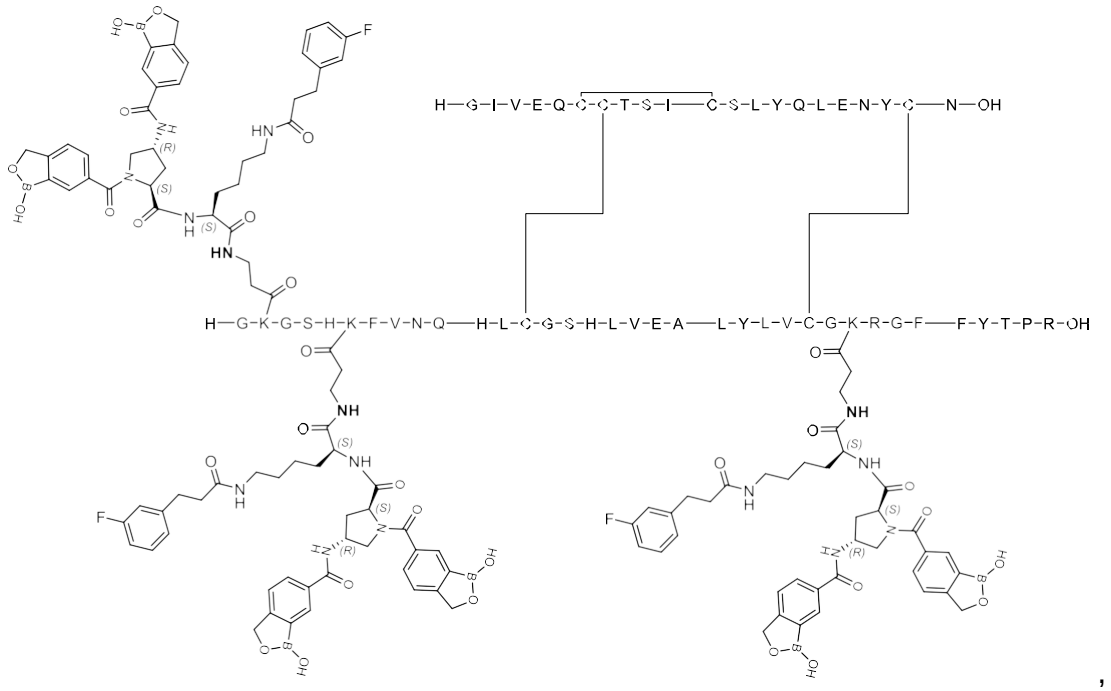
,

Ejemplo 19A:



,

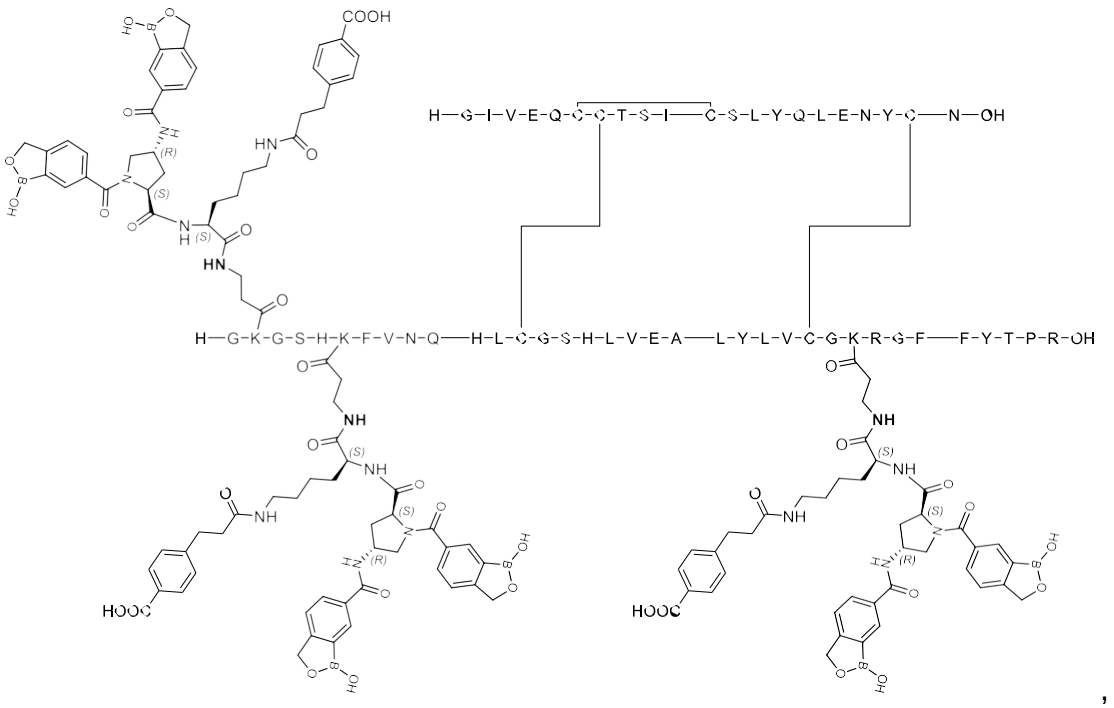
Ejemplo 20A:



,

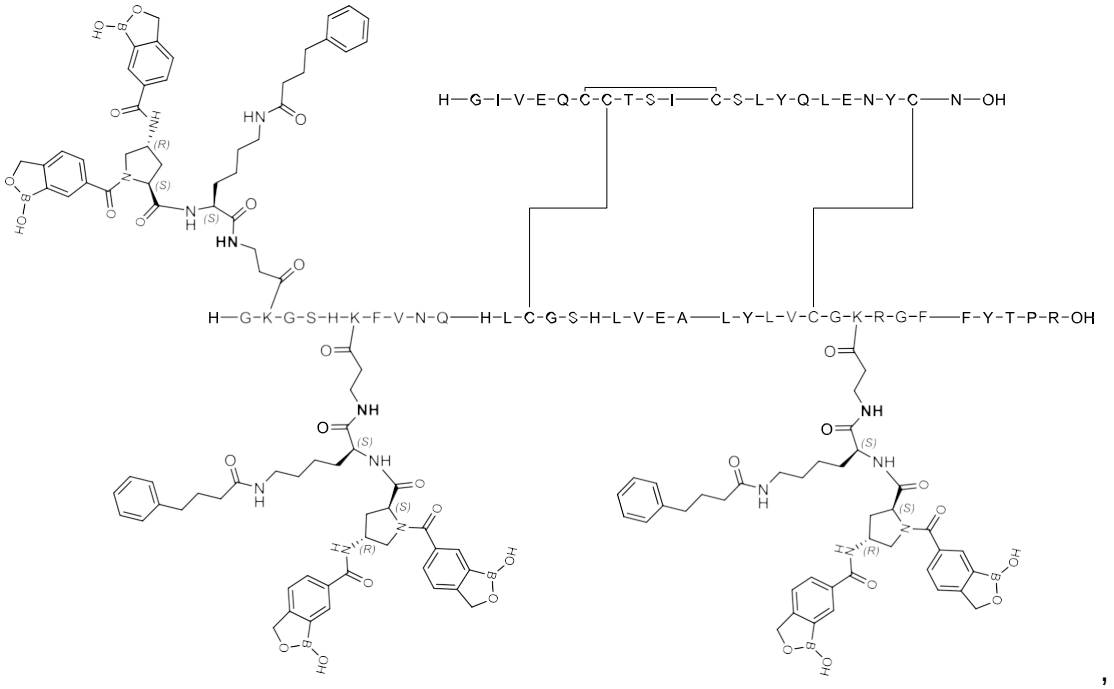
5

Ejemplo 21A:



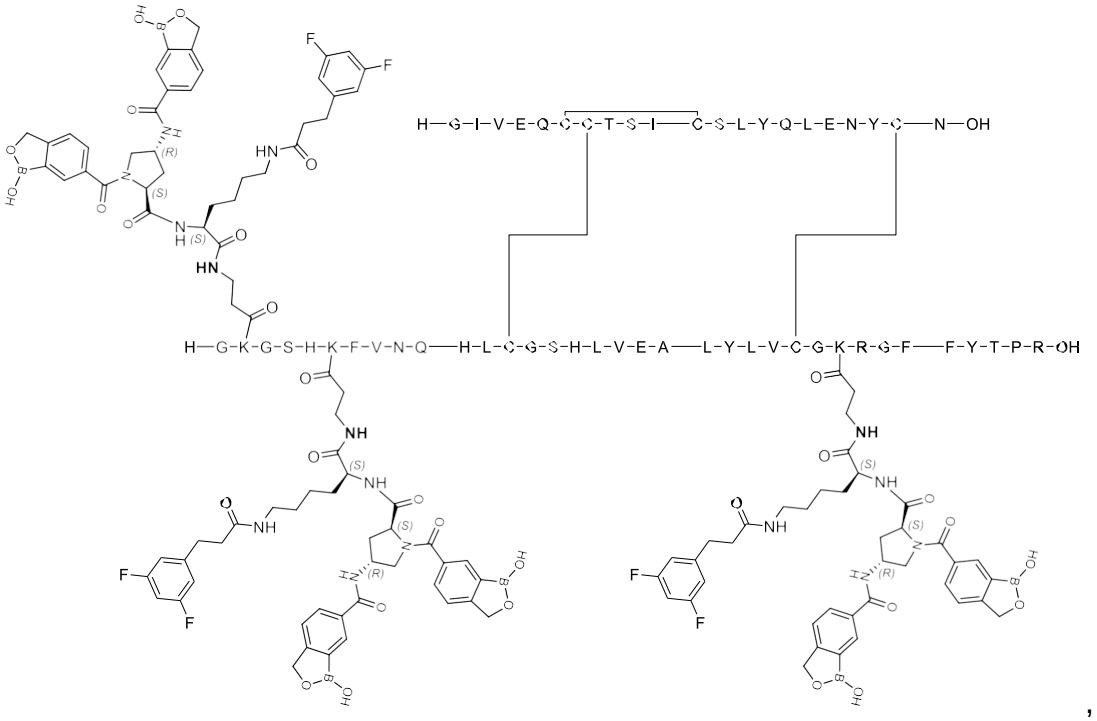
,

Ejemplo 22A:

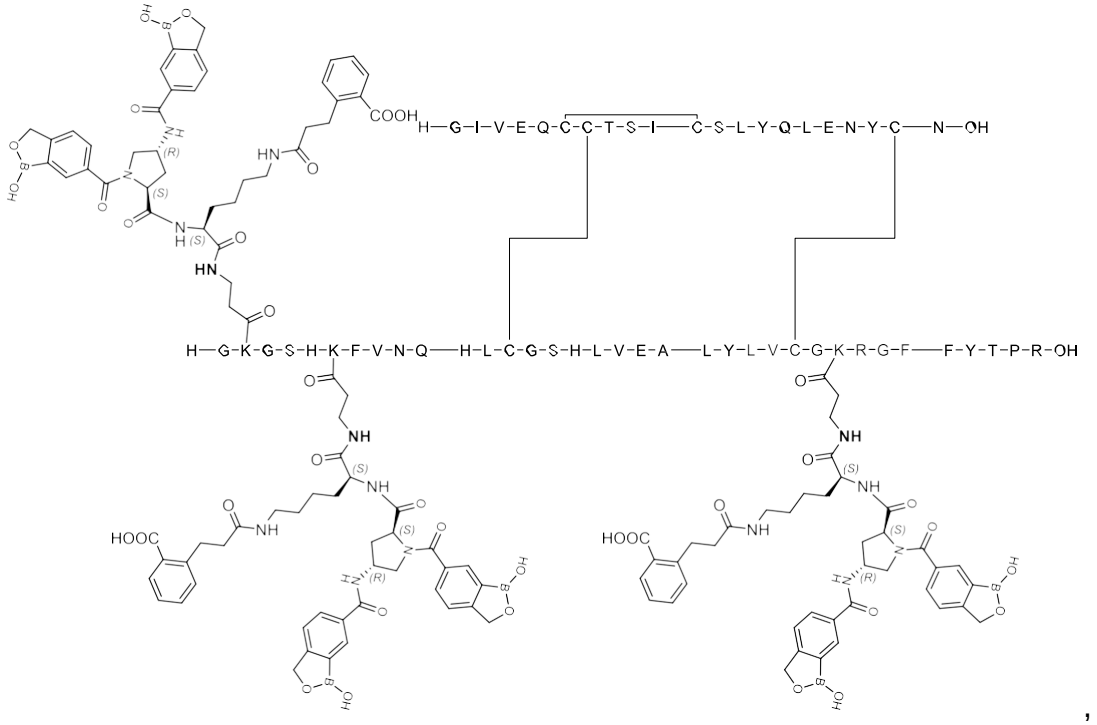


,

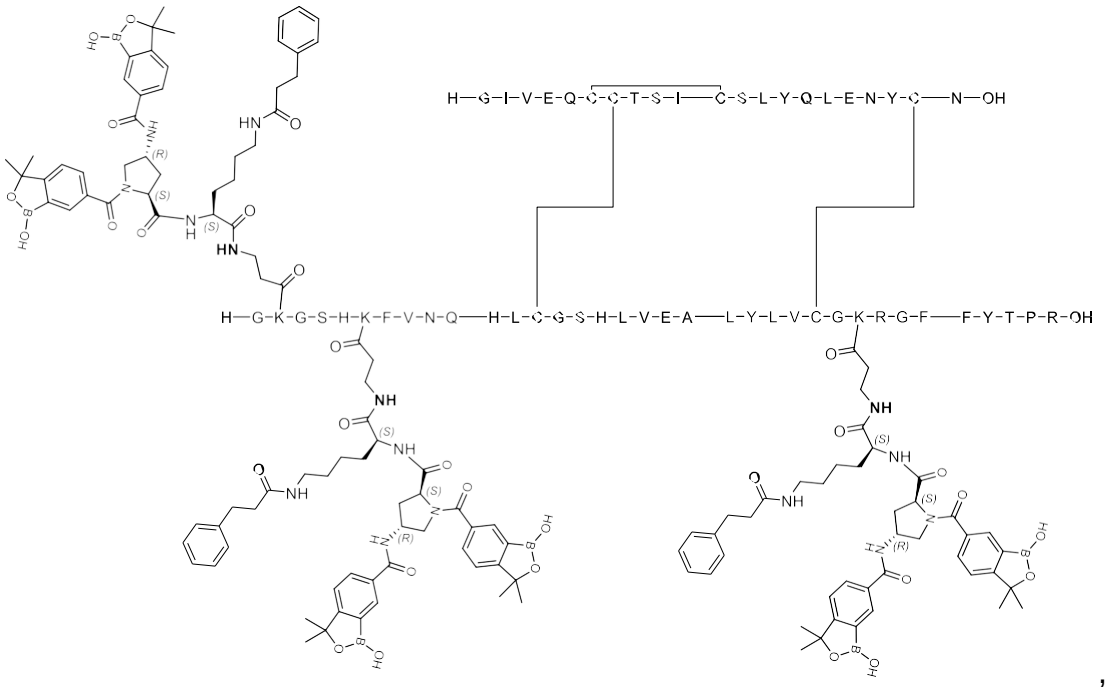
Ejemplo 23A:



Ejemplo 24A:

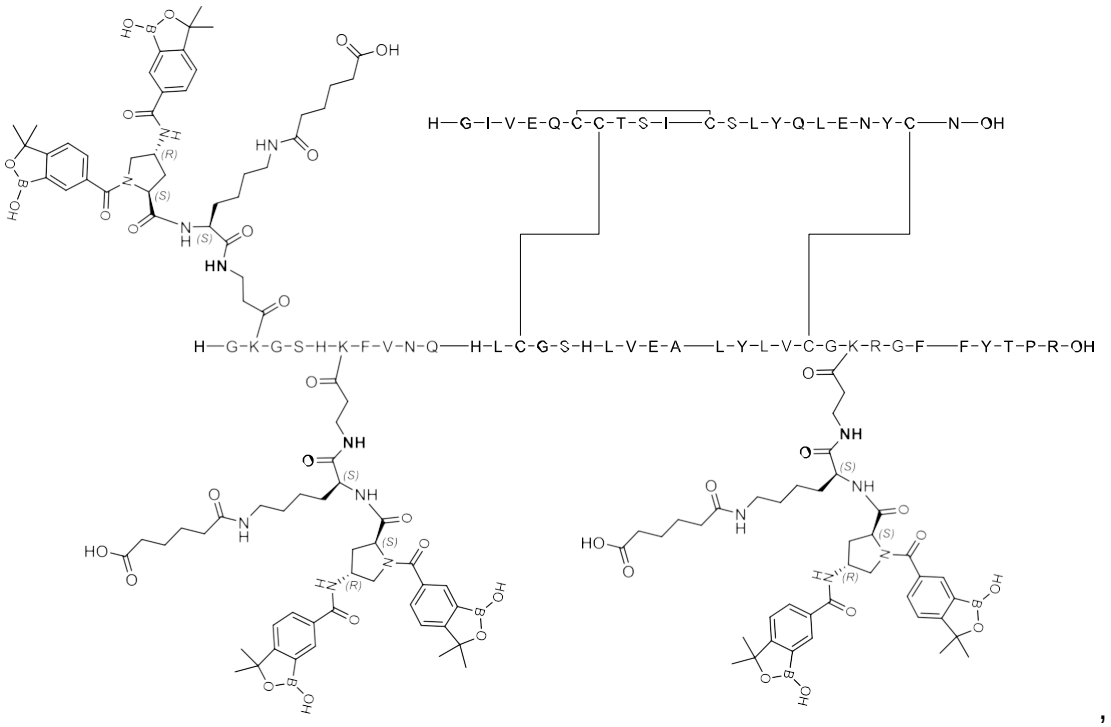


Ejemplo 25A:



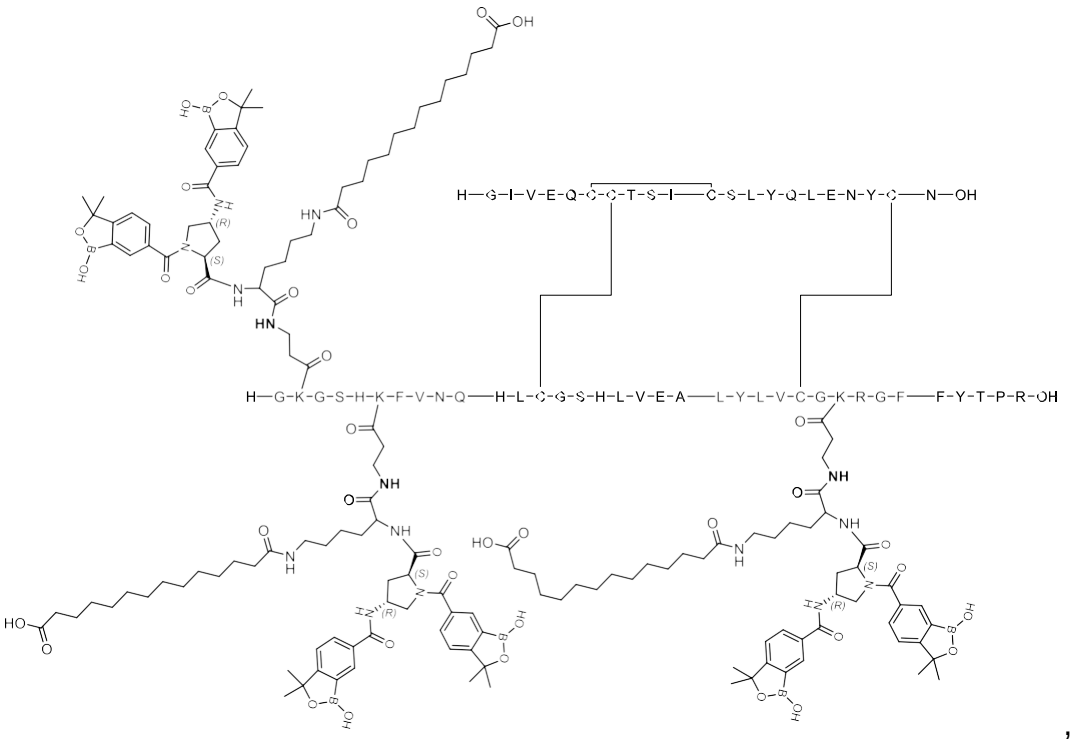
,

Ejemplo 26A:

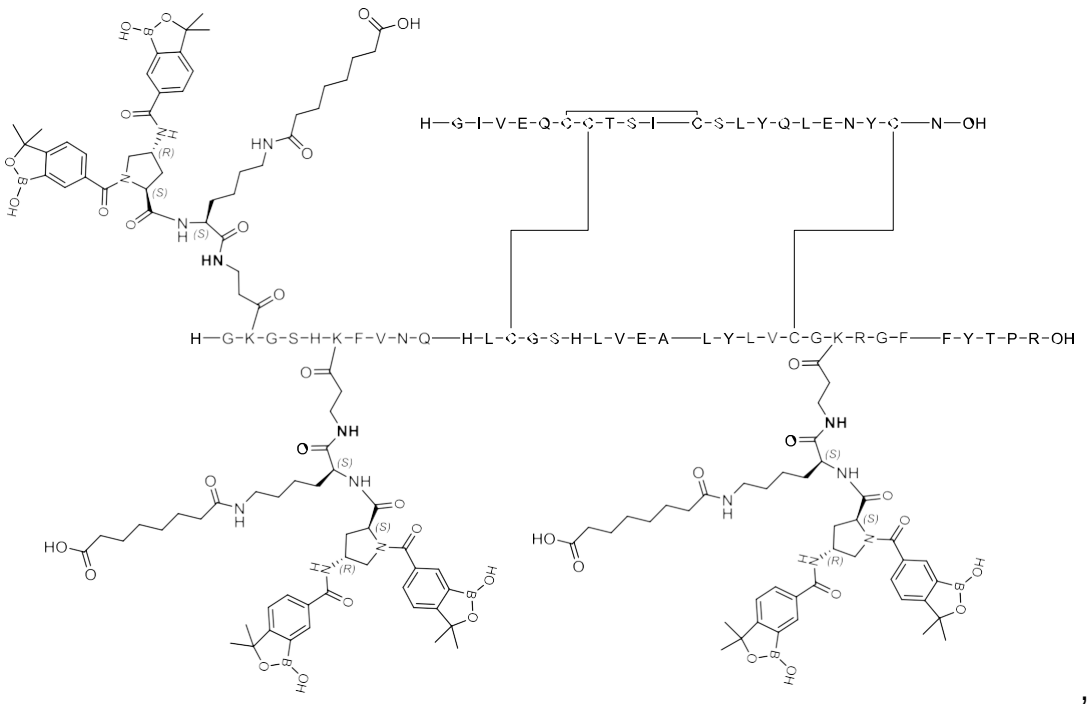


,

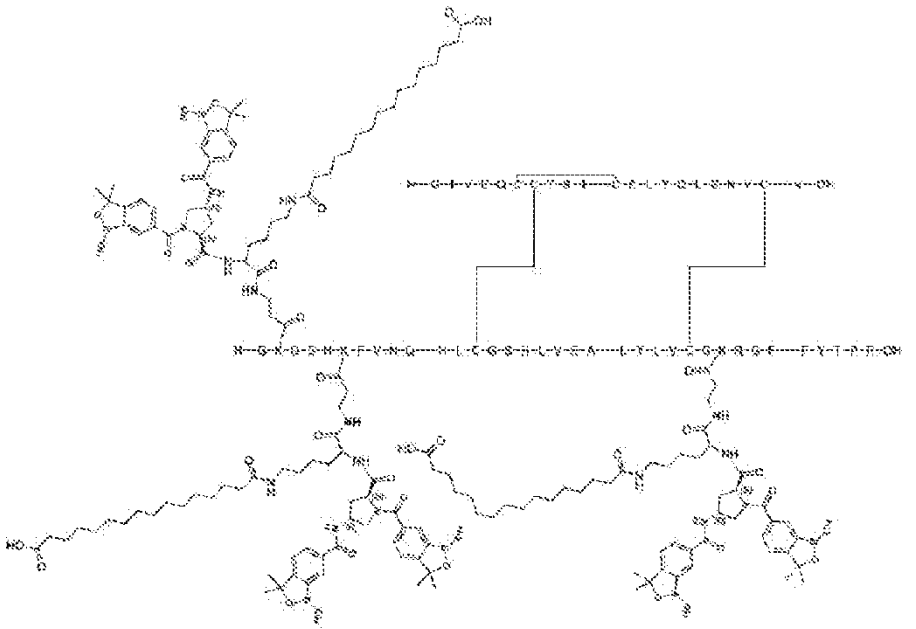
Ejemplo 27A:



Ejemplo 28A:

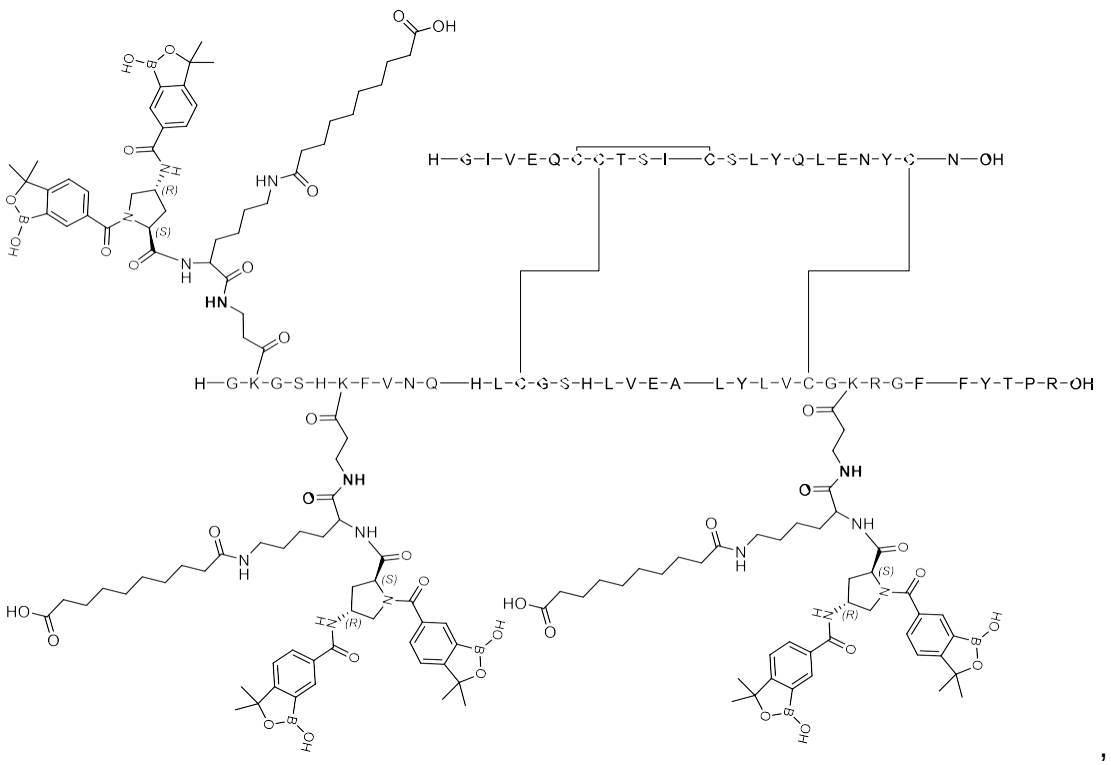


Ejemplo 29A:



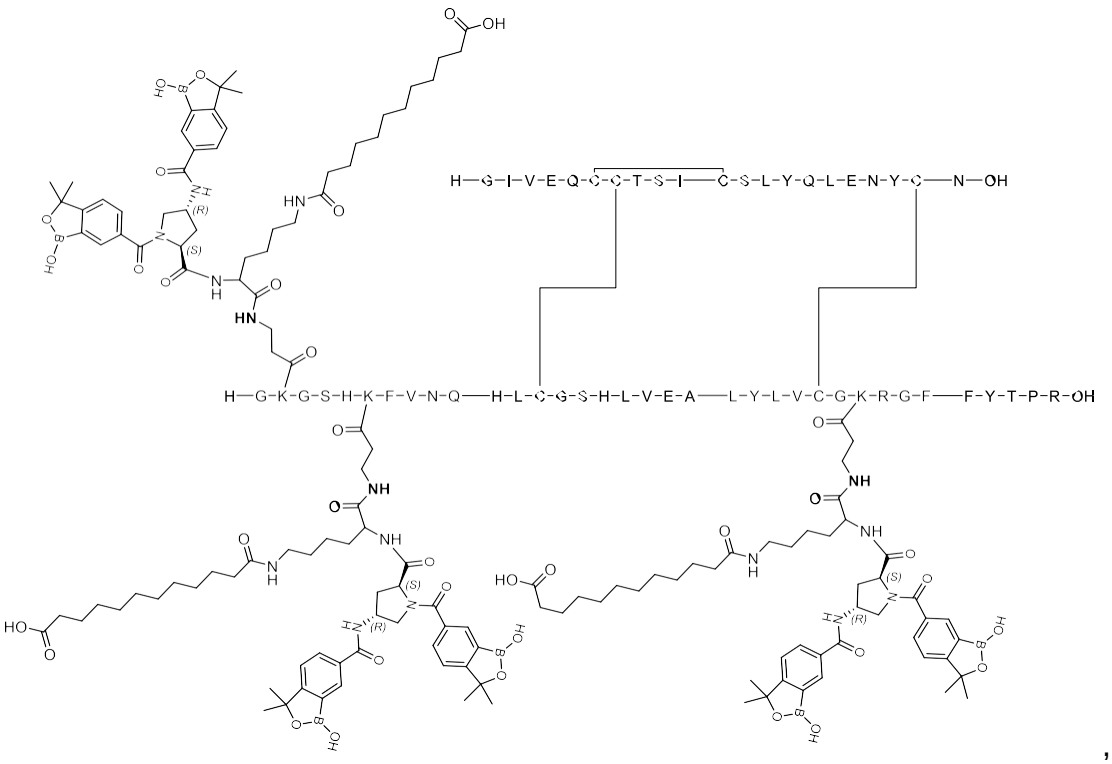
Profético

Ejemplo 30A:



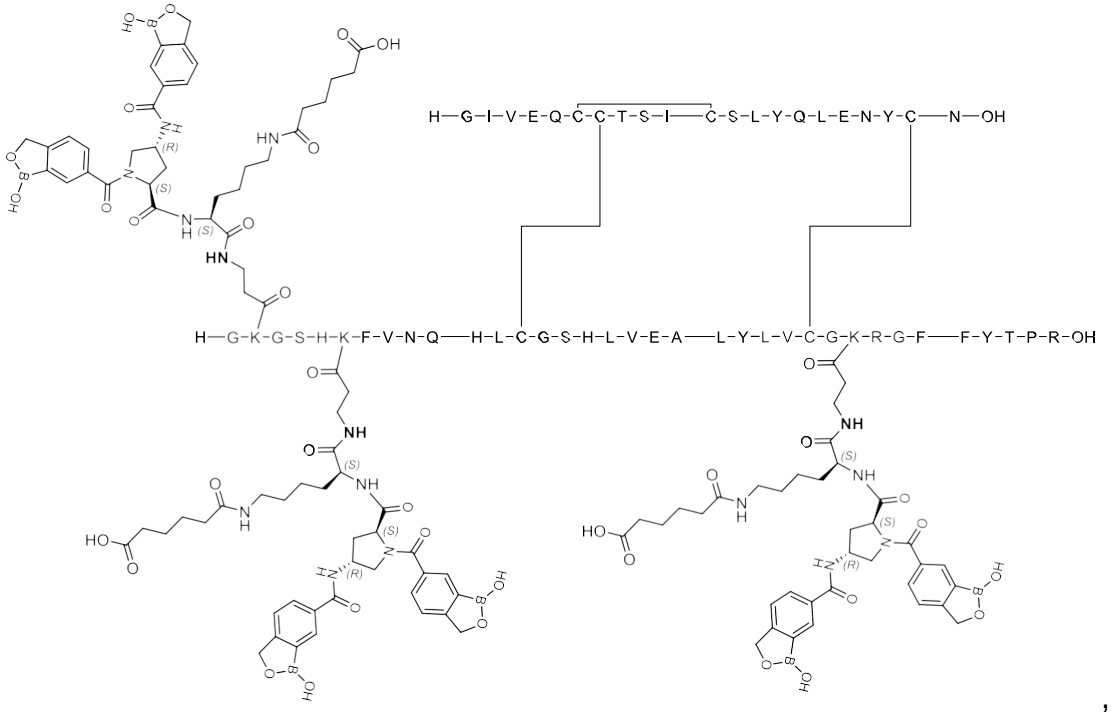
,

Ejemplo 31A:



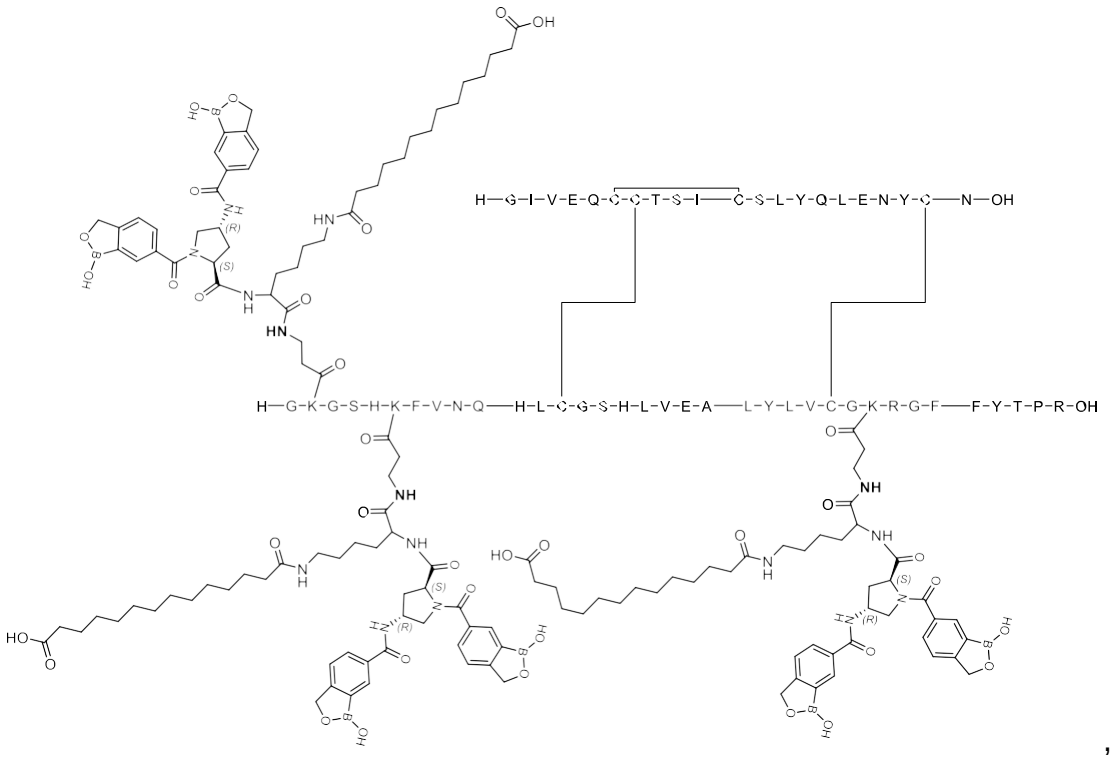
,

Ejemplo 32A:



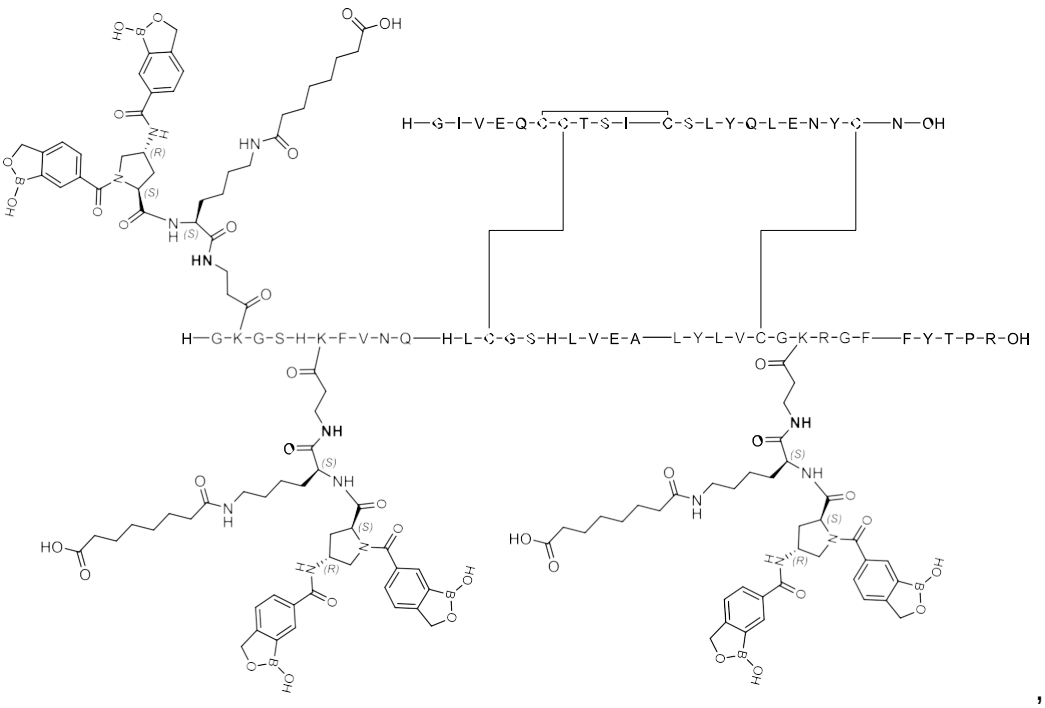
,

Ejemplo 33A:



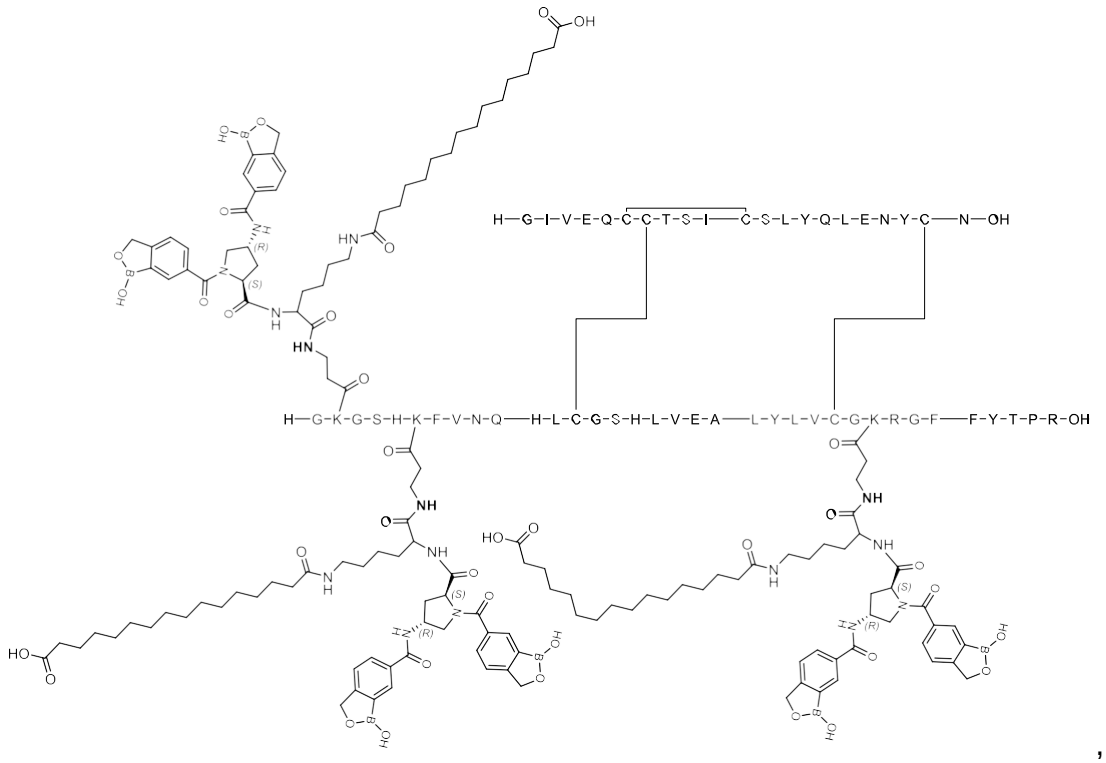
,

Ejemplo 34A:



,

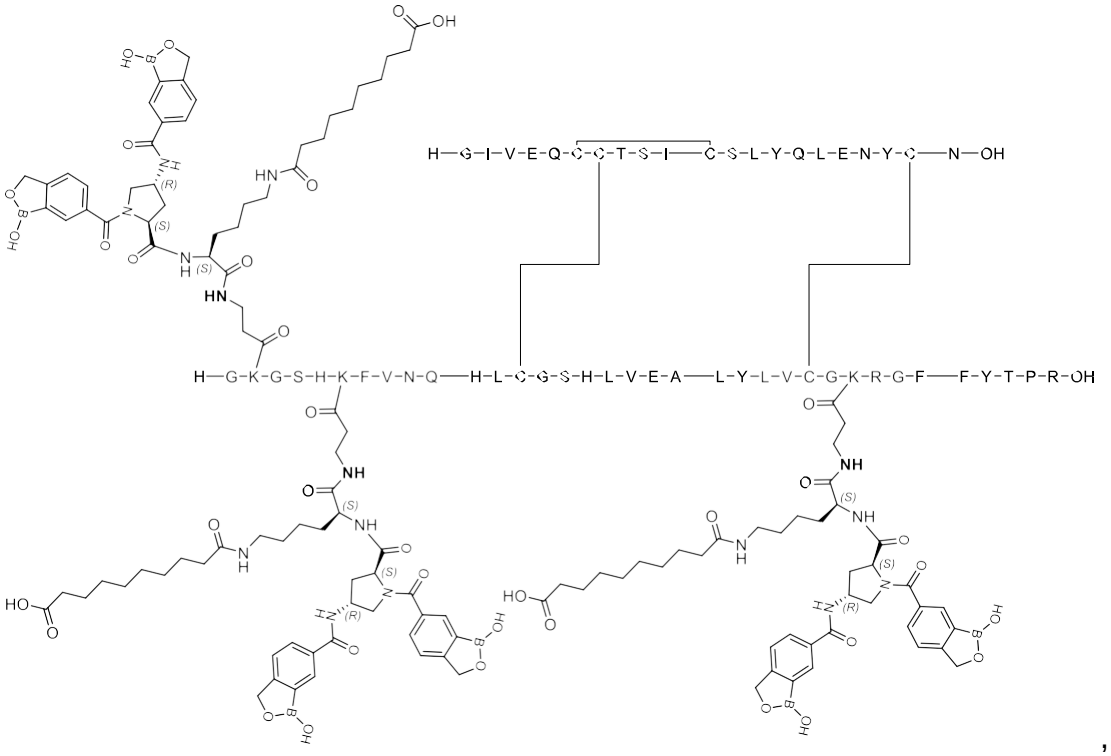
Ejemplo 35A:



,

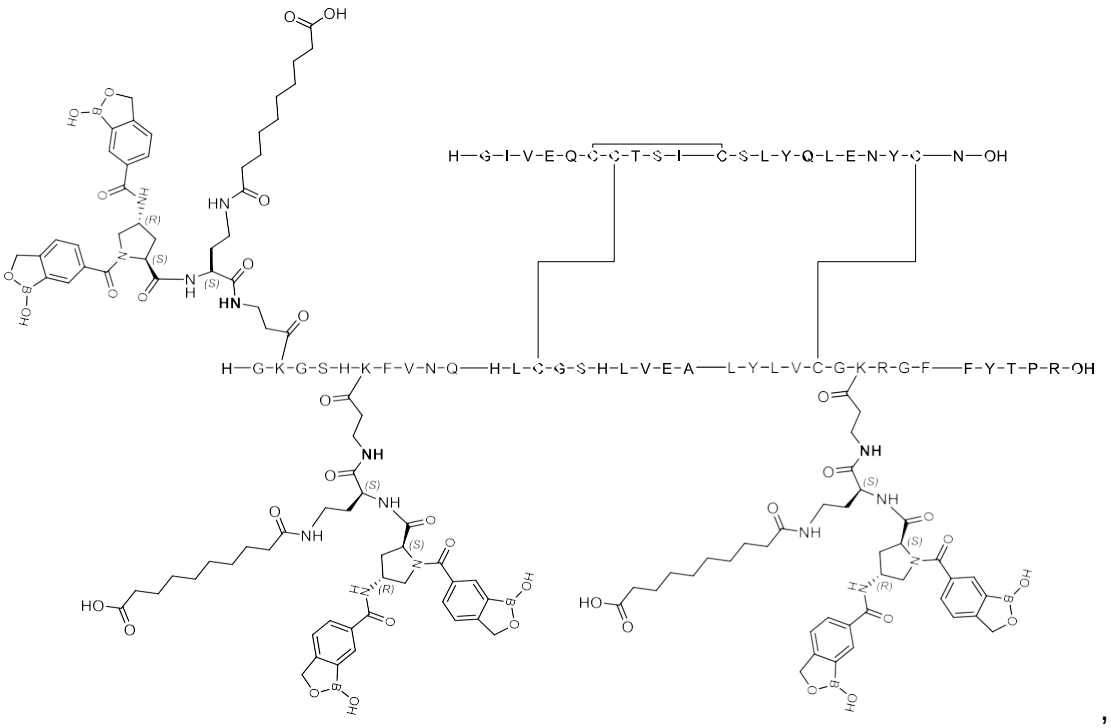
5

Ejemplo 36A:

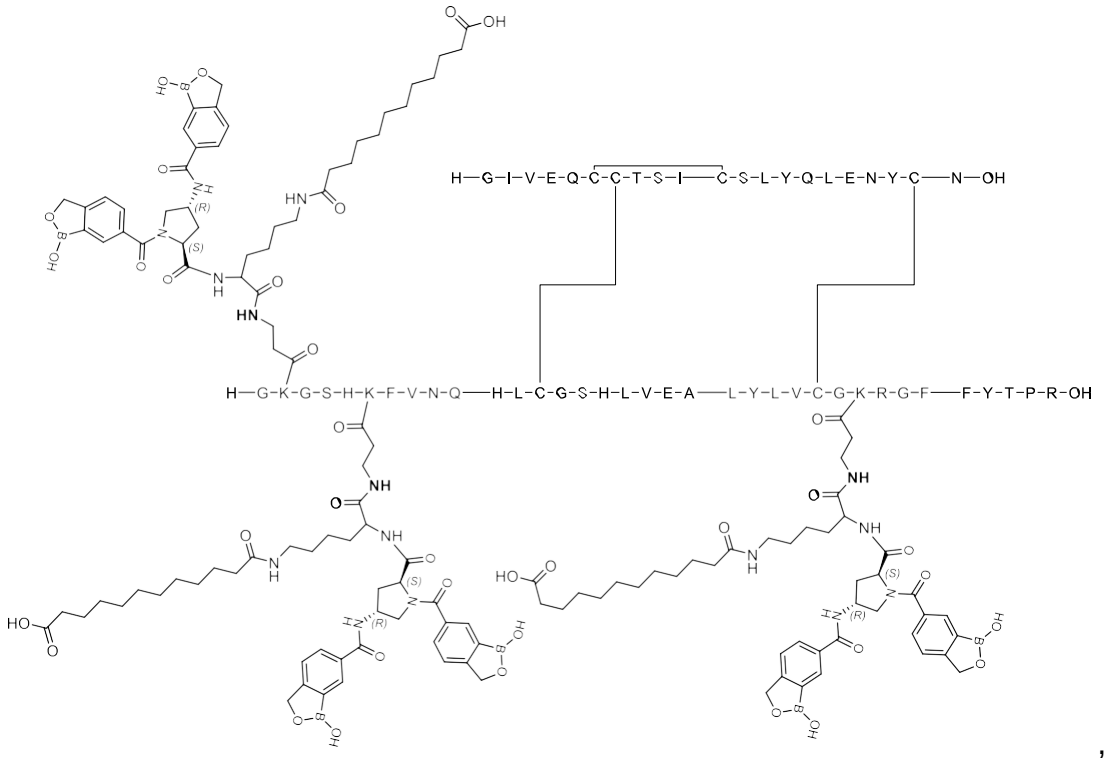


,

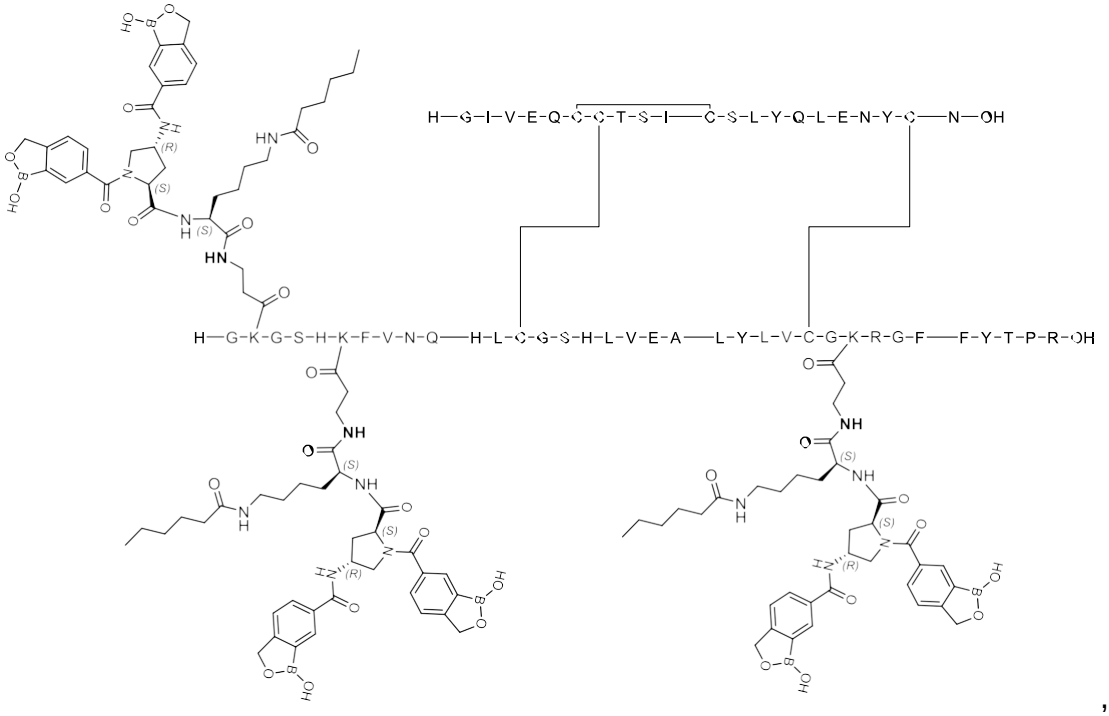
Ejemplo 37A:



Ejemplo 38A:

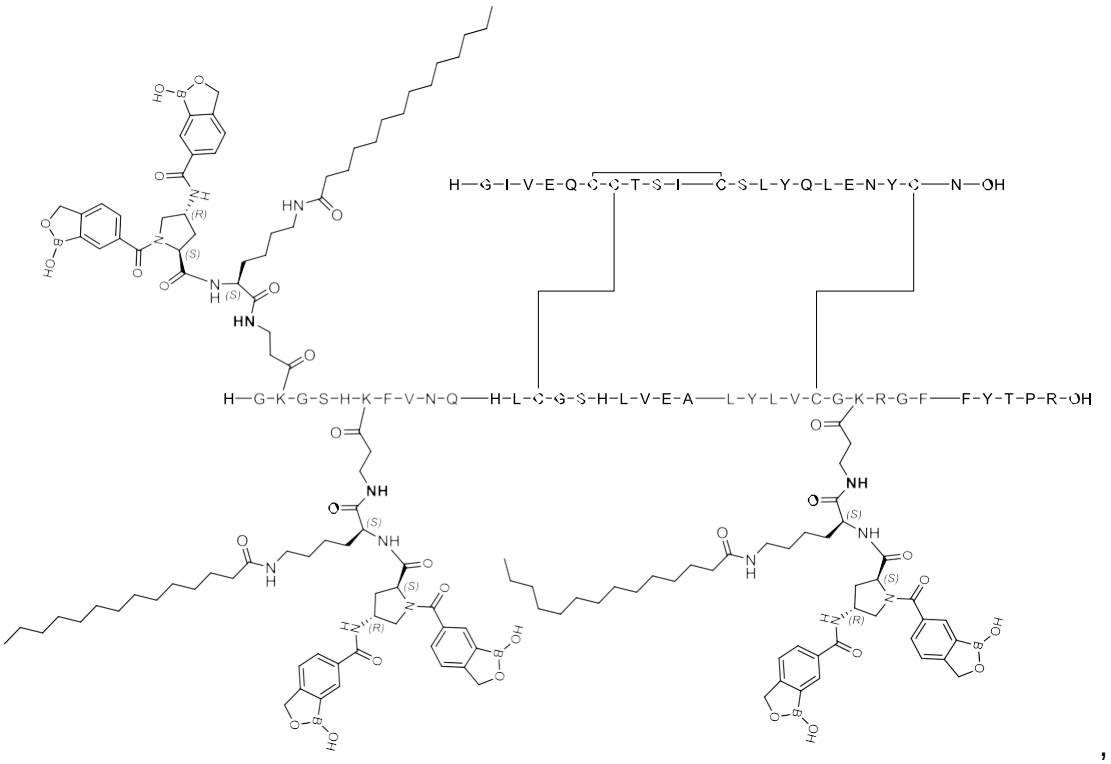


Ejemplo 39A:



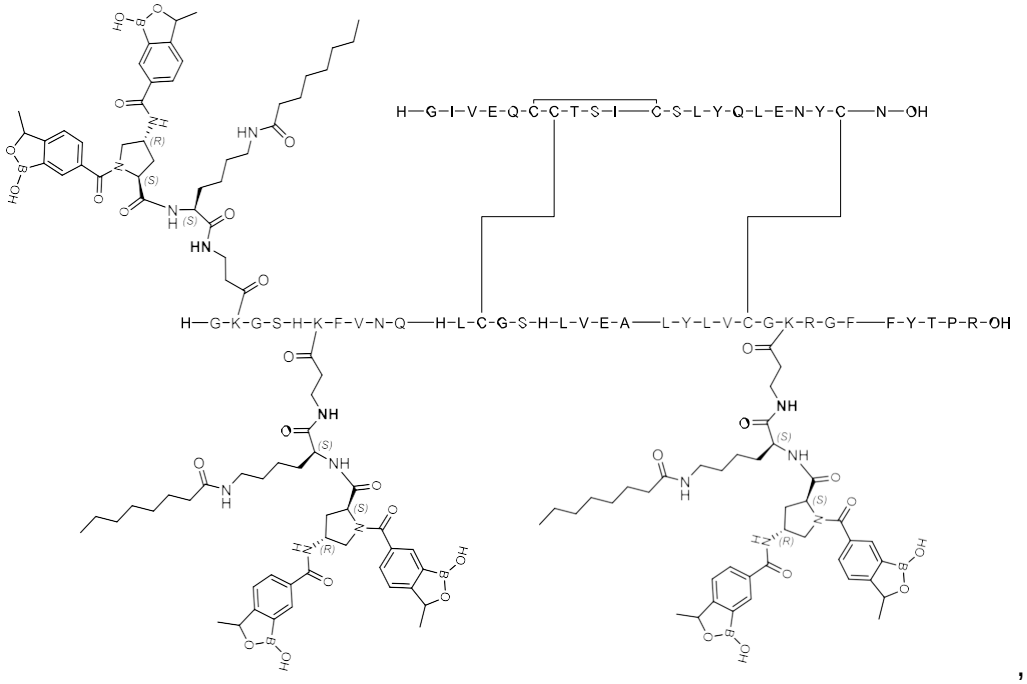
,

Ejemplo 40A:



,

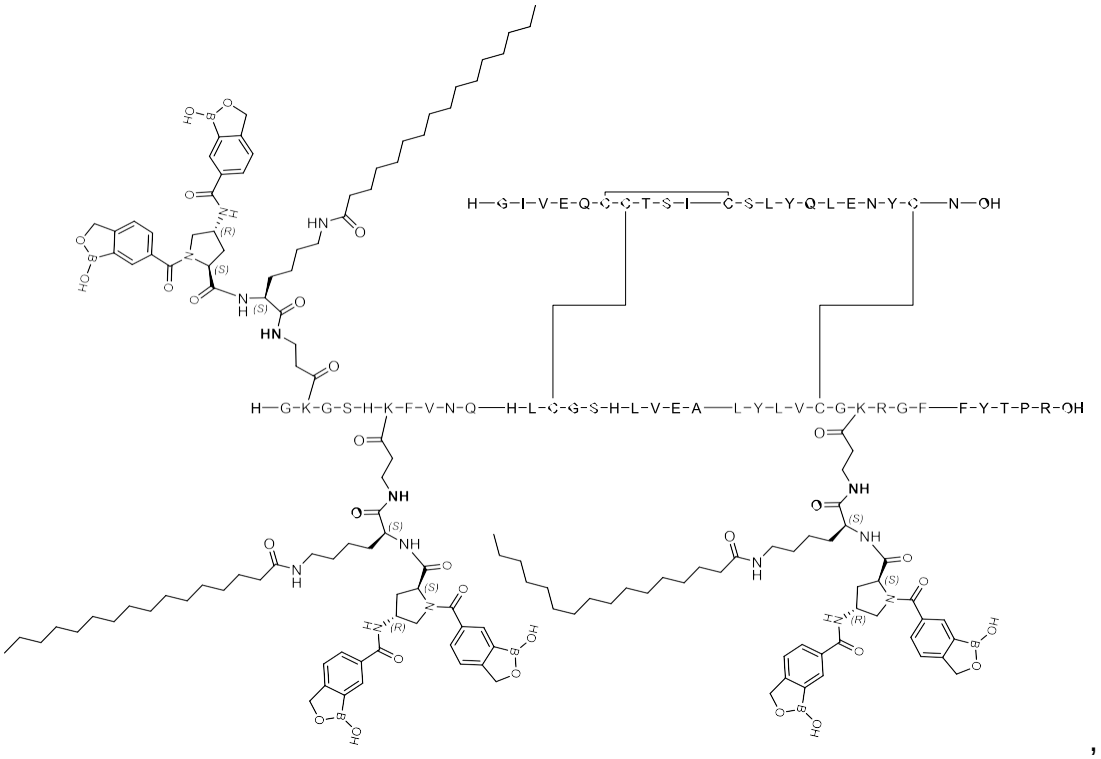
Ejemplo 41A:



,

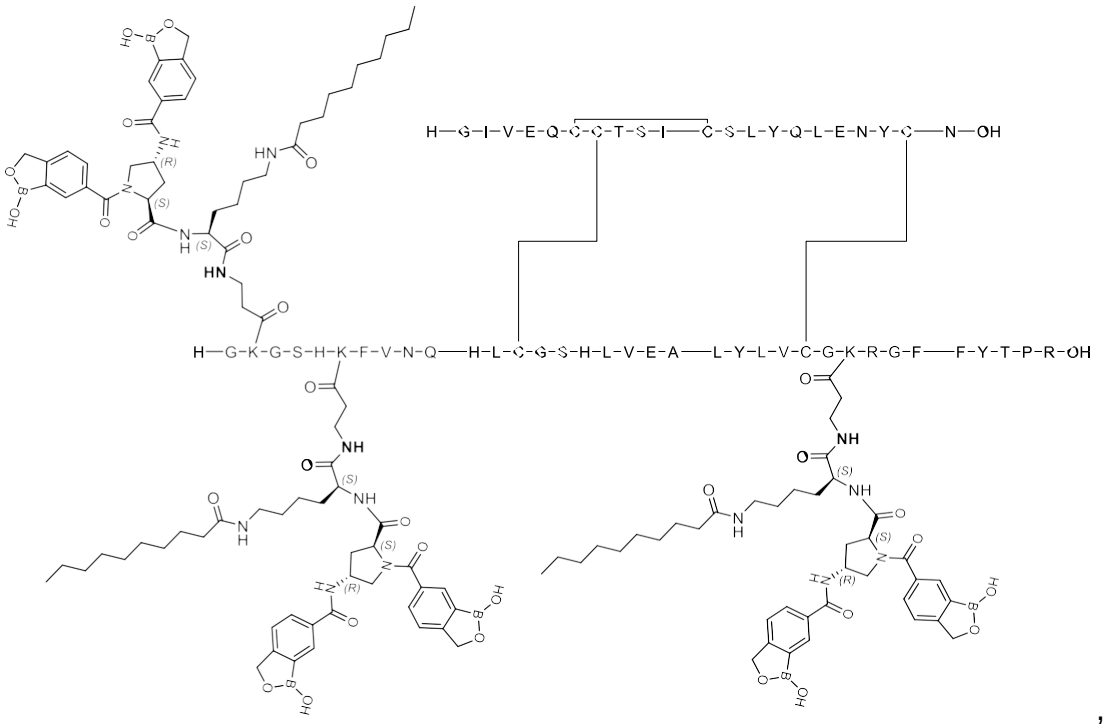
5

Ejemplo 42A:

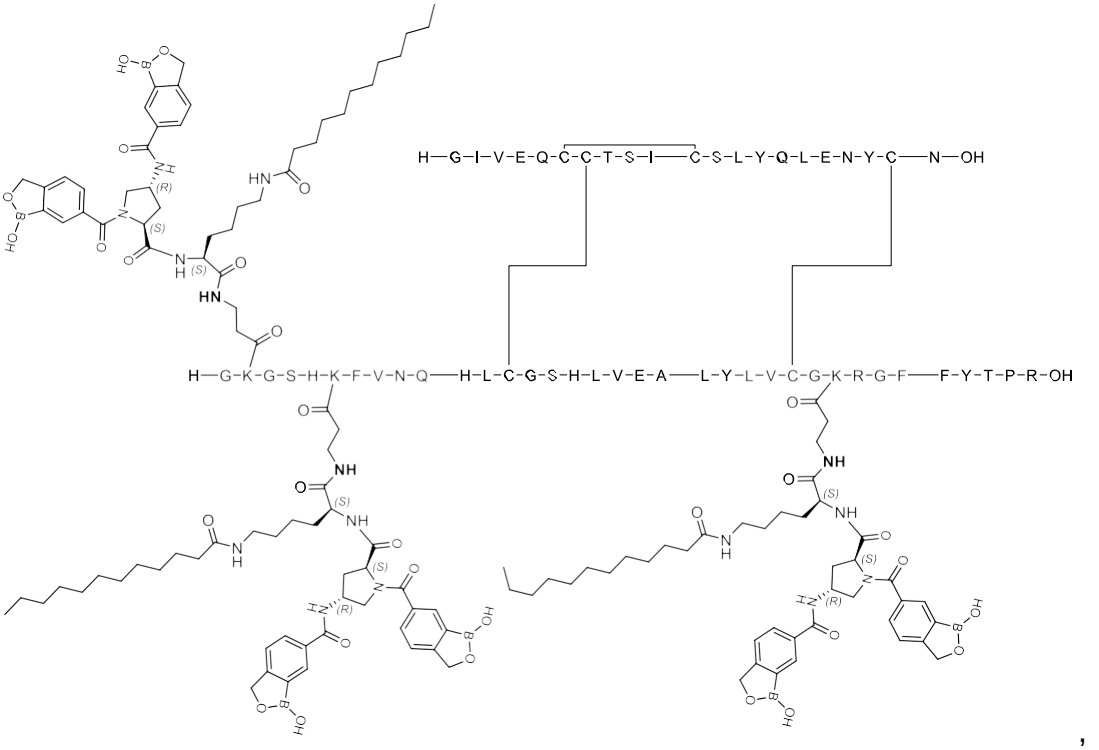


,

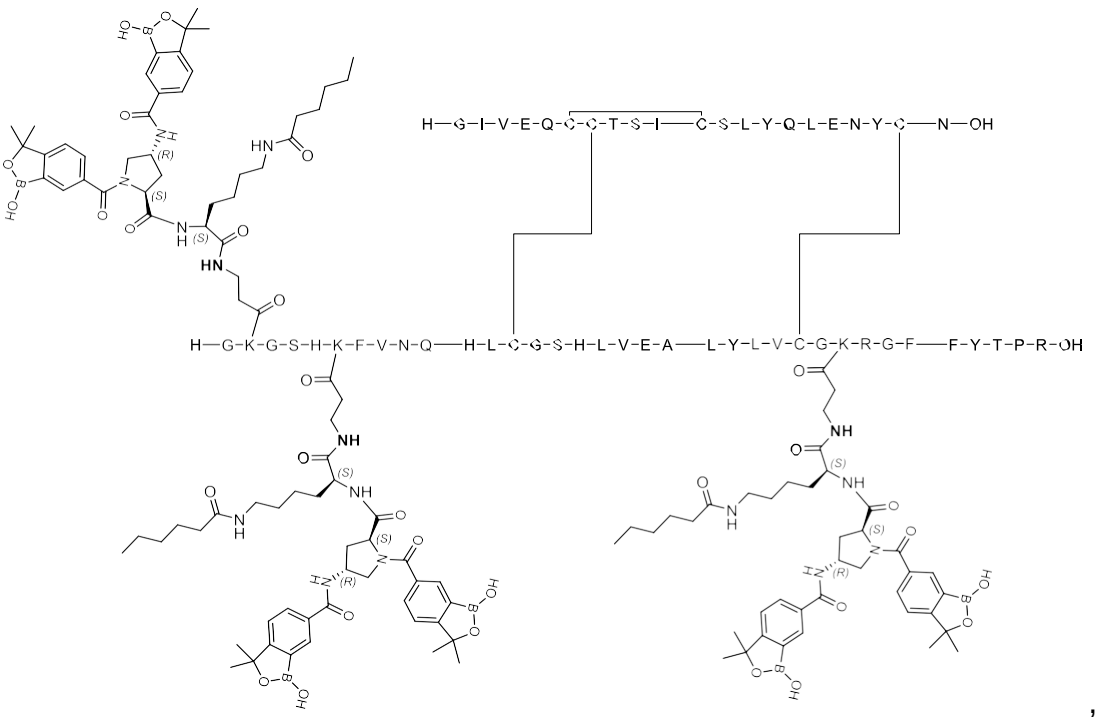
Ejemplo 43A:



Ejemplo 44A:

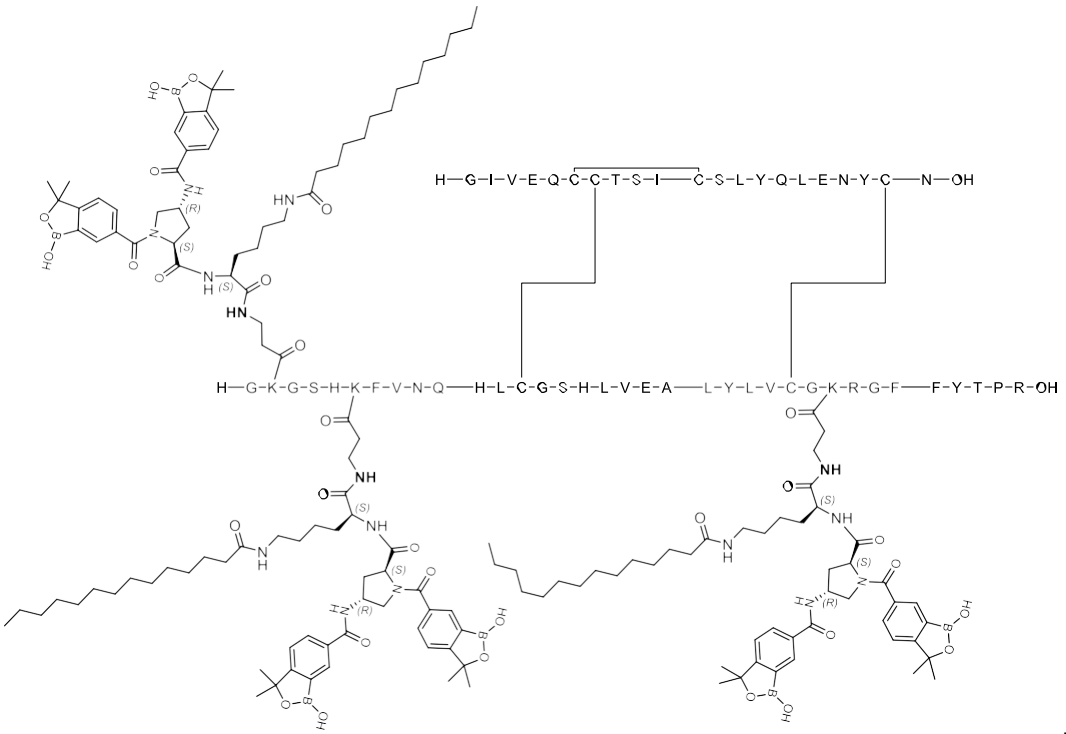


Ejemplo 45A:



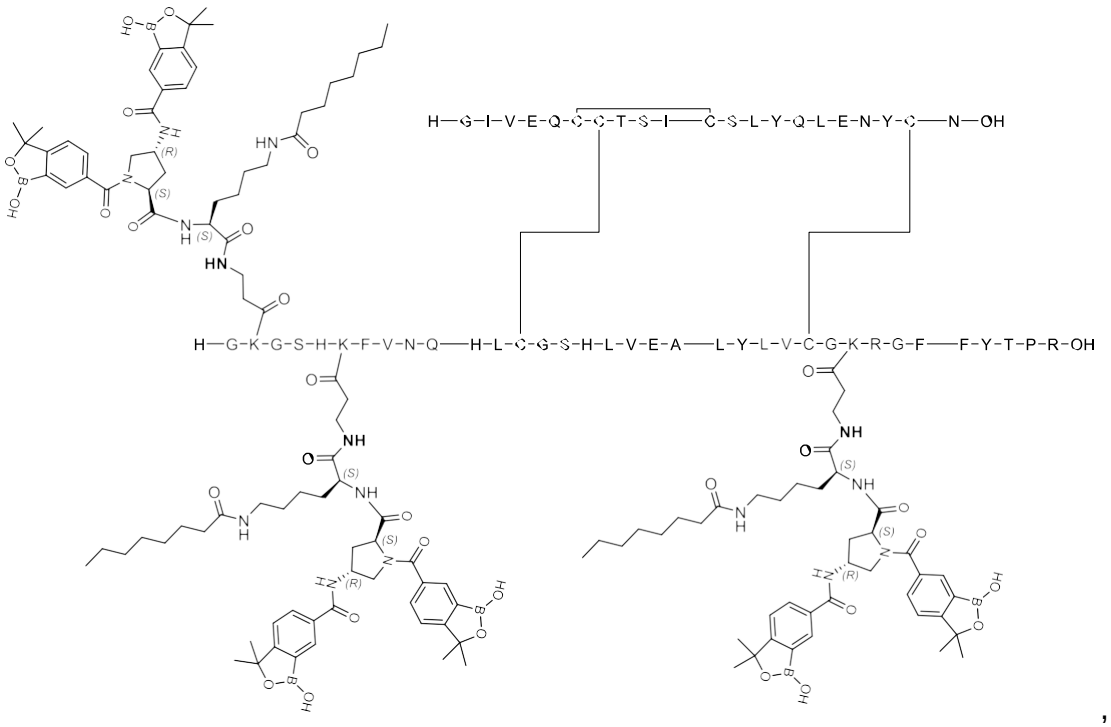
,

Ejemplo 46A:



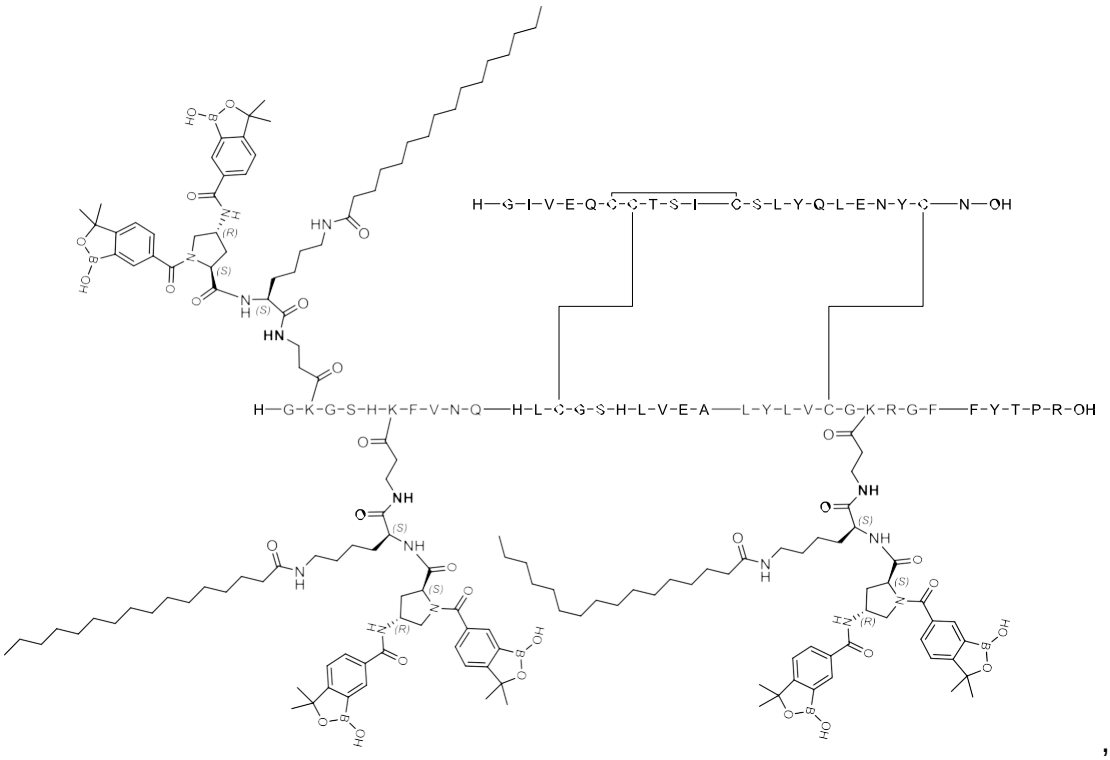
,

Ejemplo 47A:



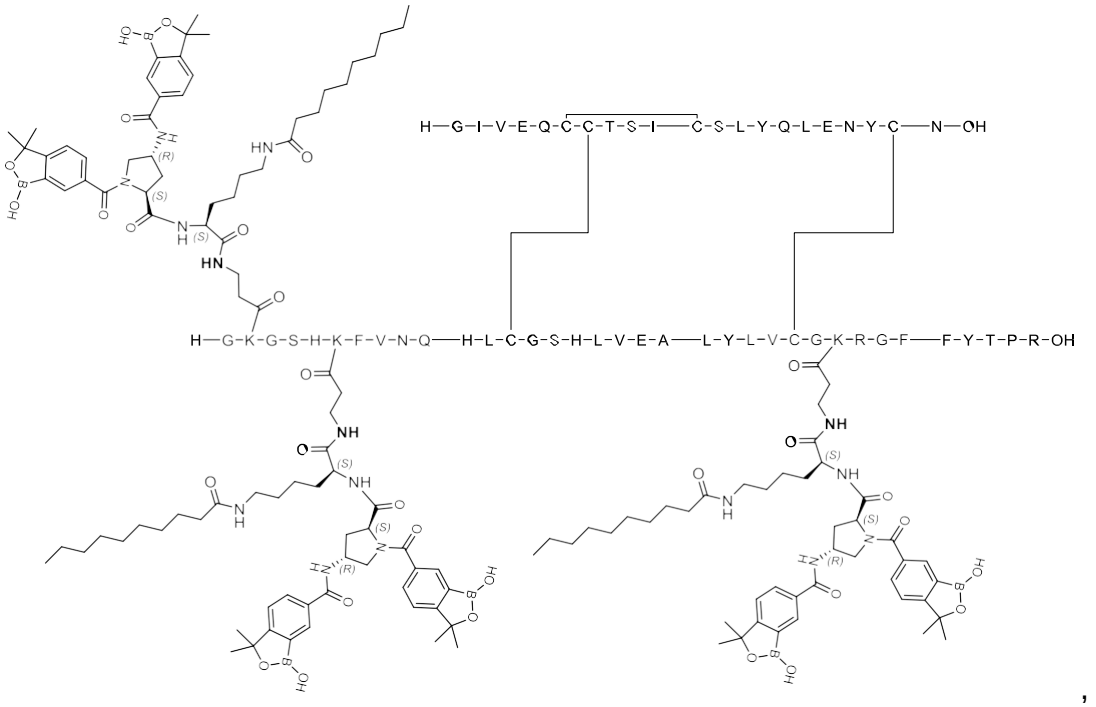
,

Ejemplo 48A:



,

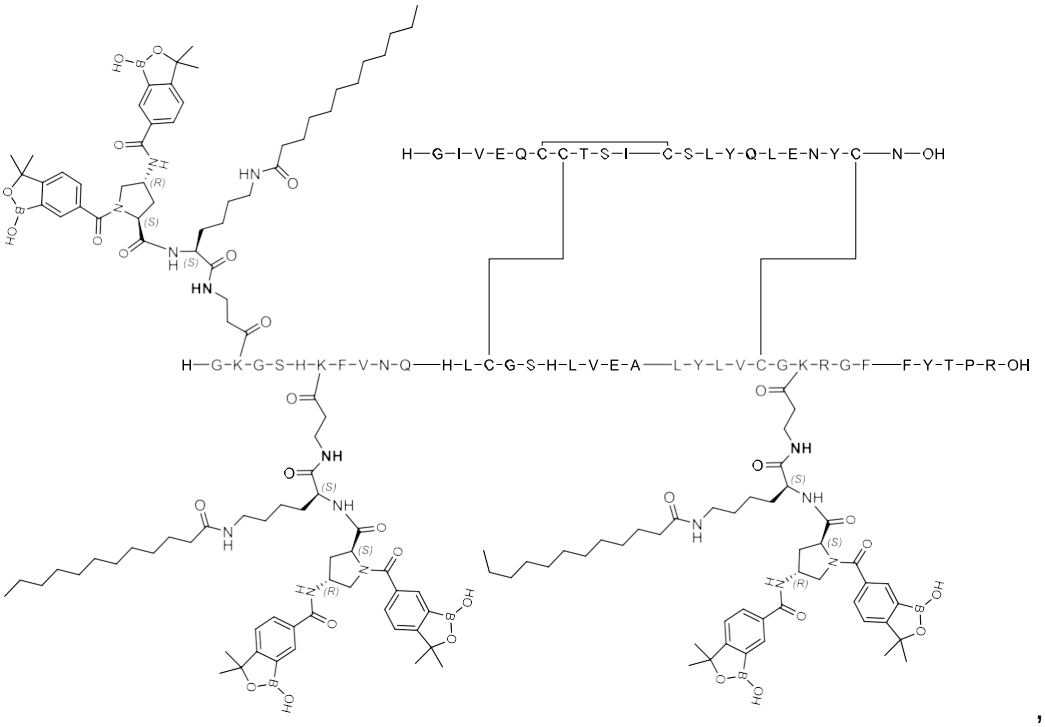
Ejemplo 49A:



,

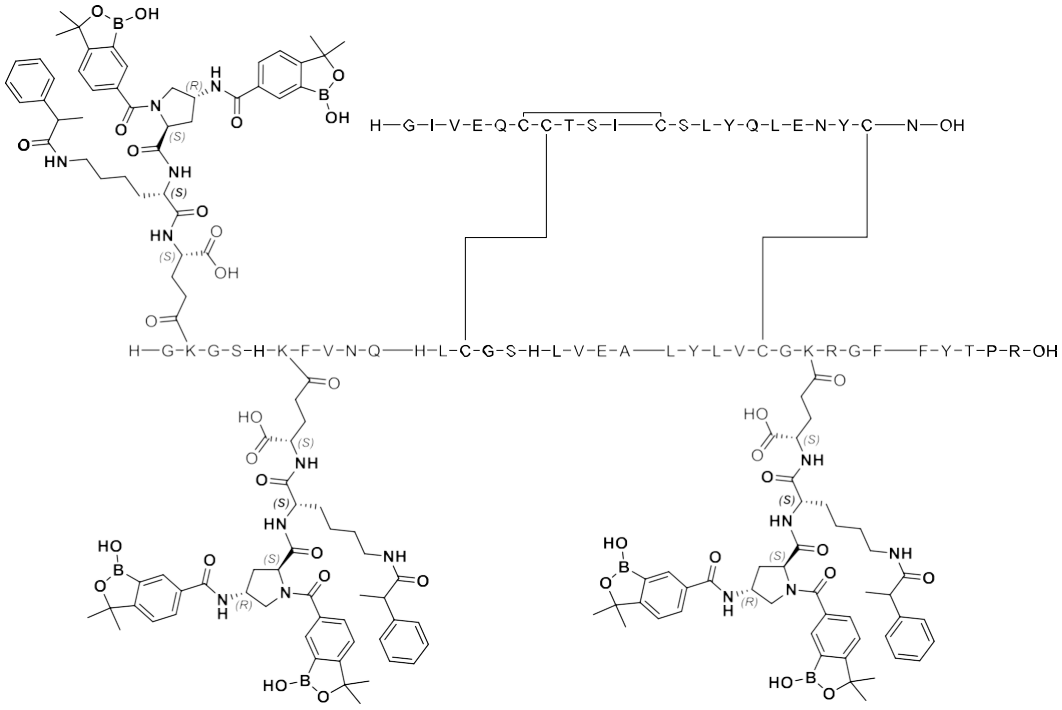
5

Ejemplo 50A:



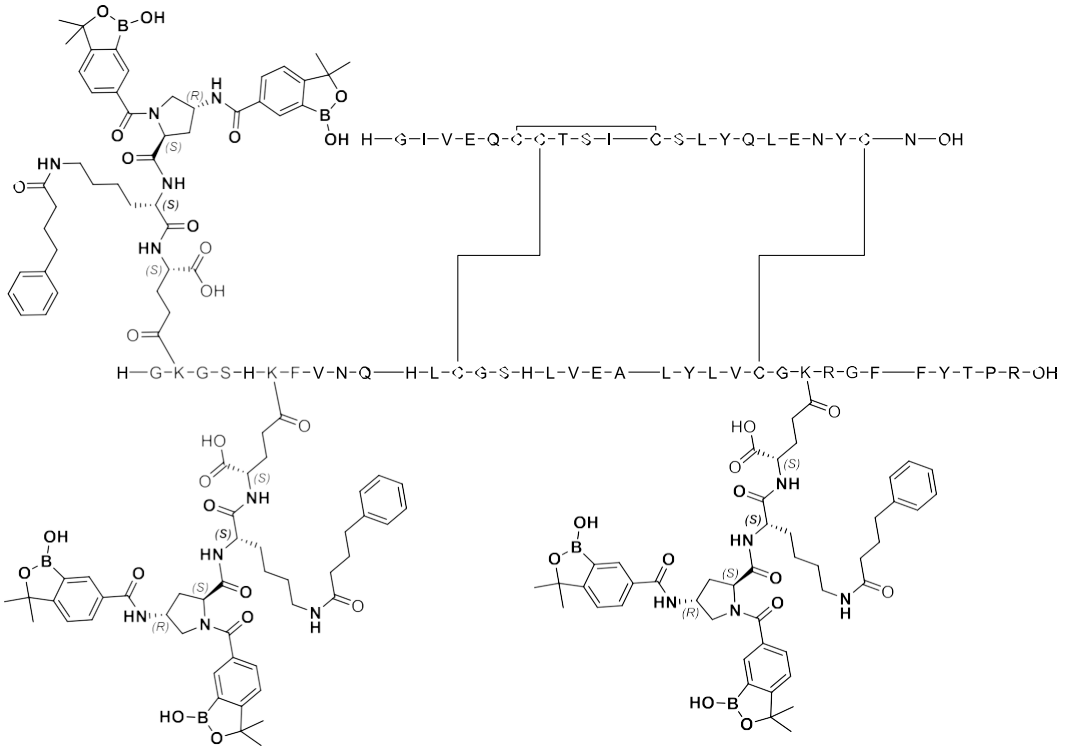
,

Ejemplo 51A:



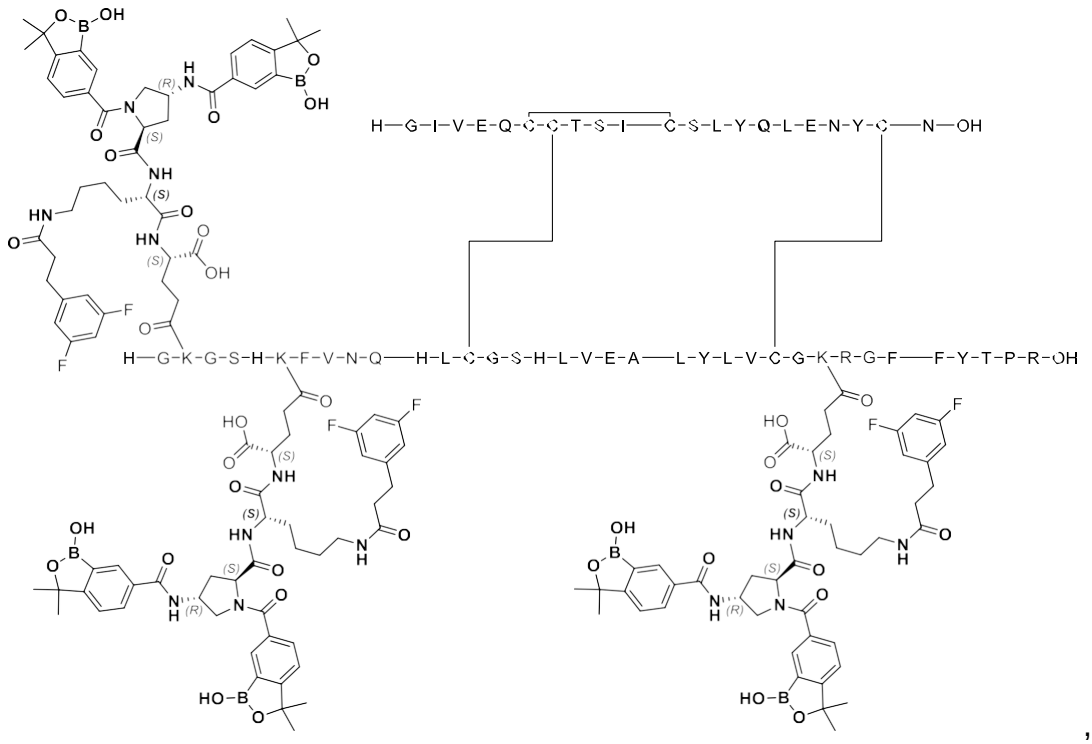
,

Ejemplo 52A:



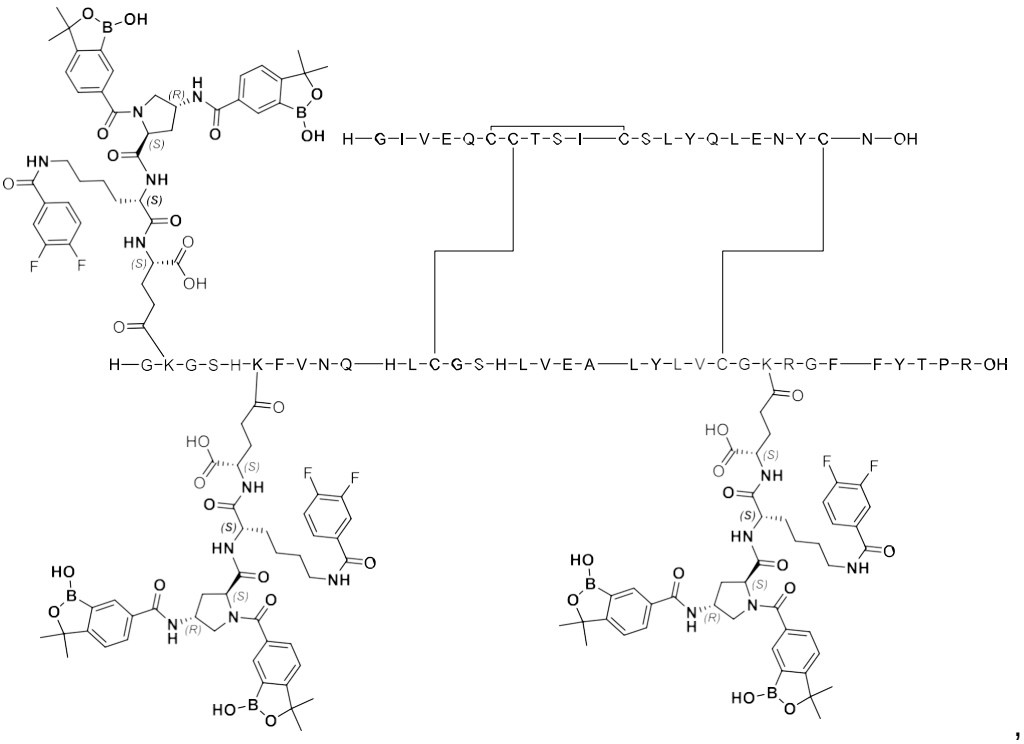
,

Ejemplo 53A:



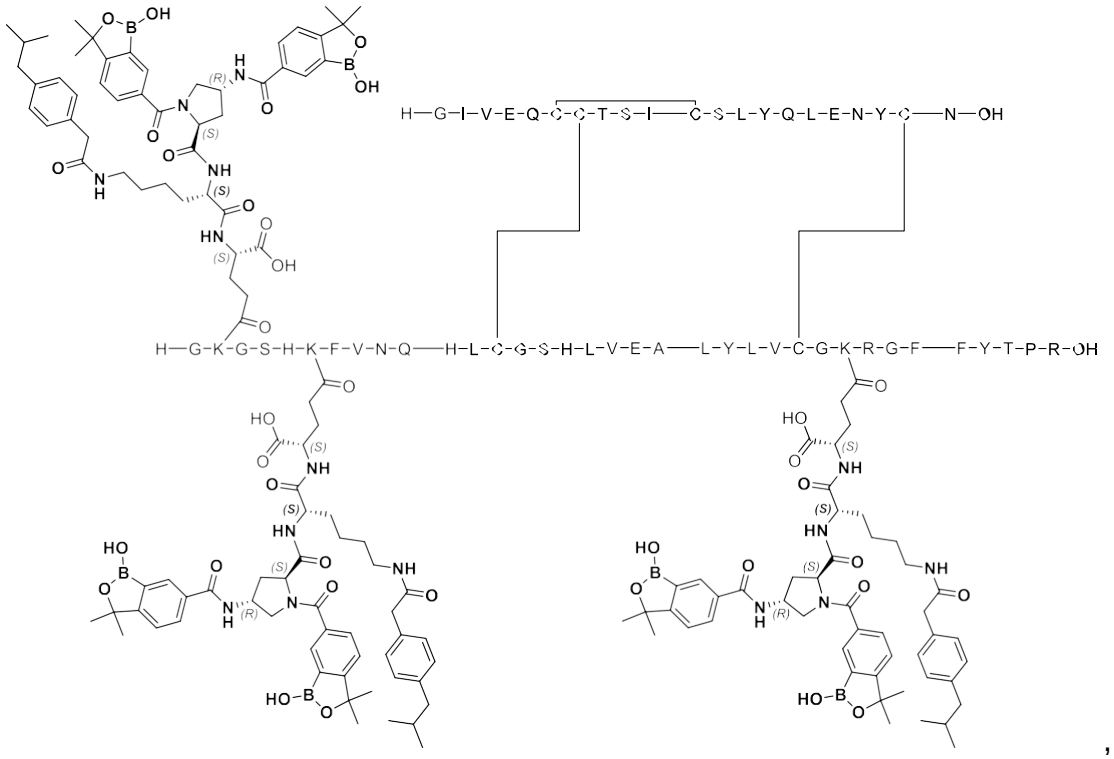
,

Ejemplo 54A:



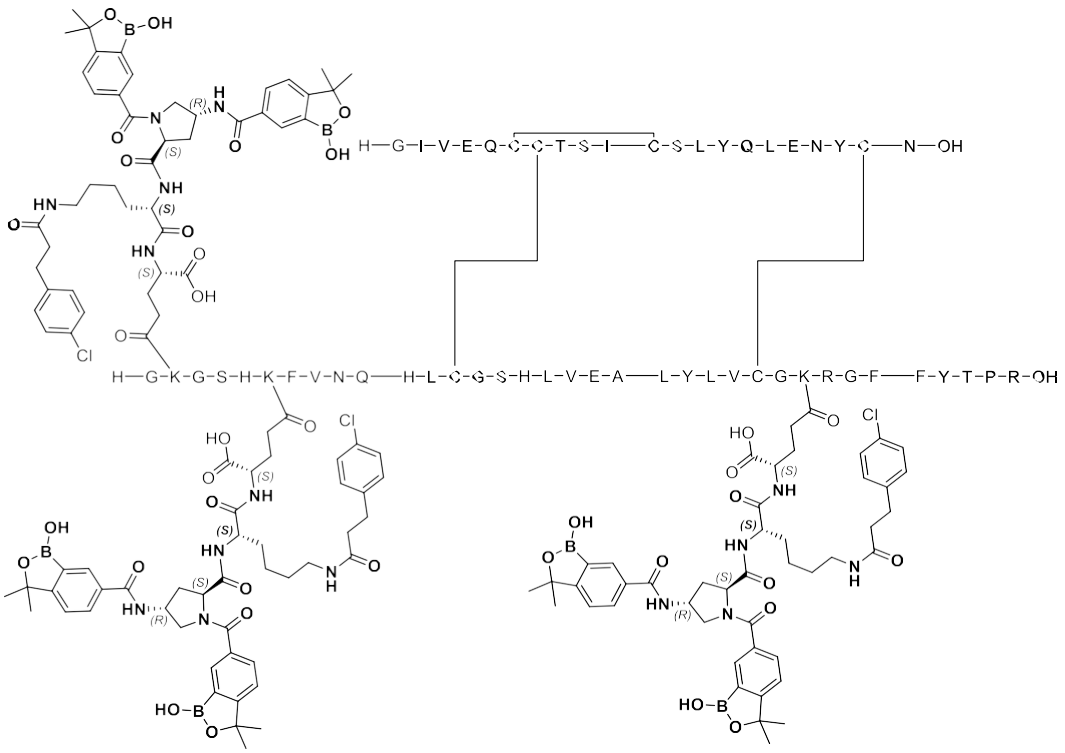
,

Ejemplo 55A:

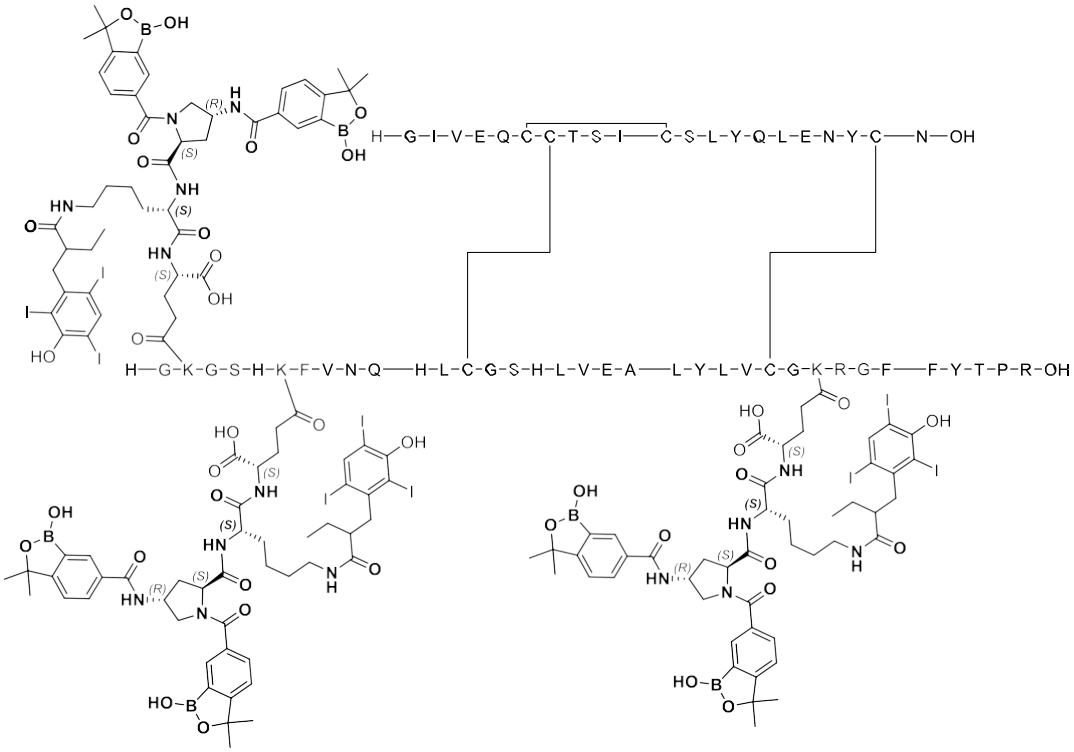


,

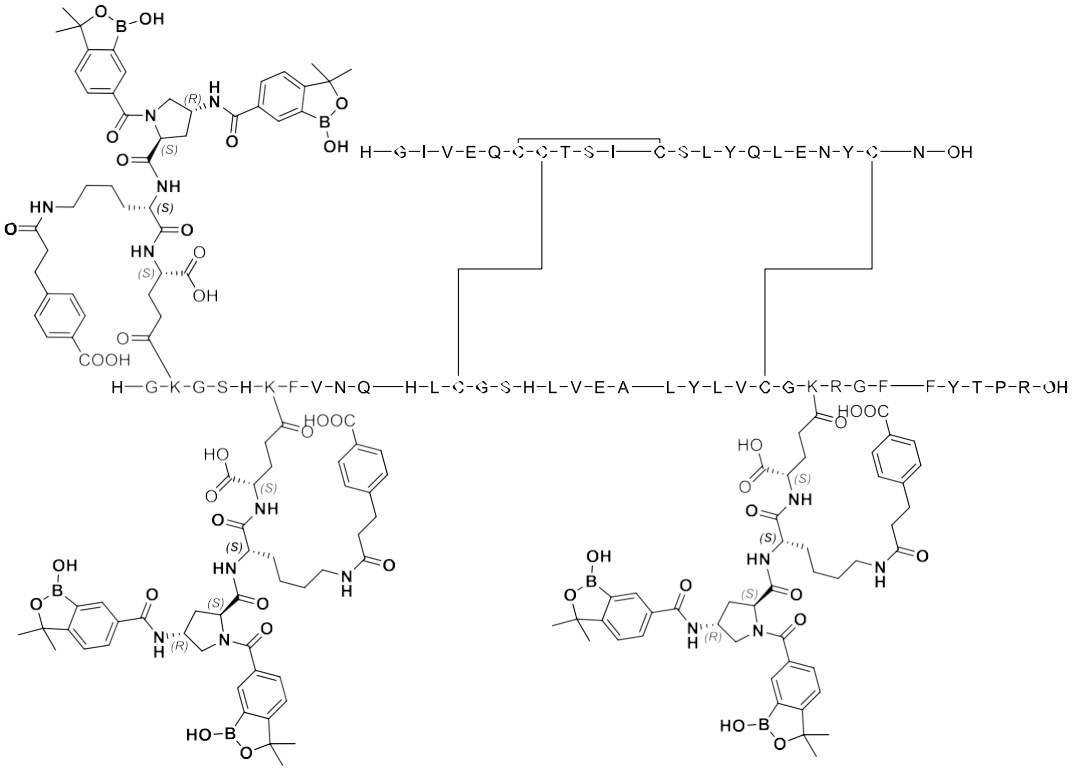
Ejemplo 56A:



Ejemplo 57A:

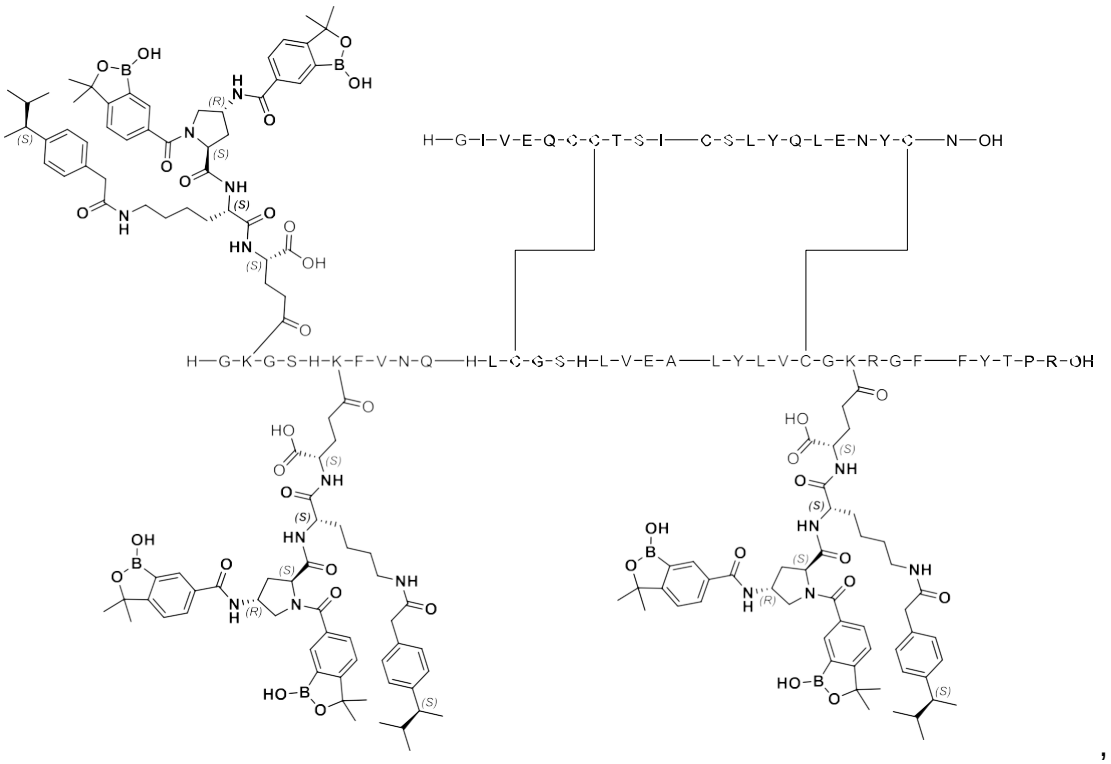


Ejemplo 58A:



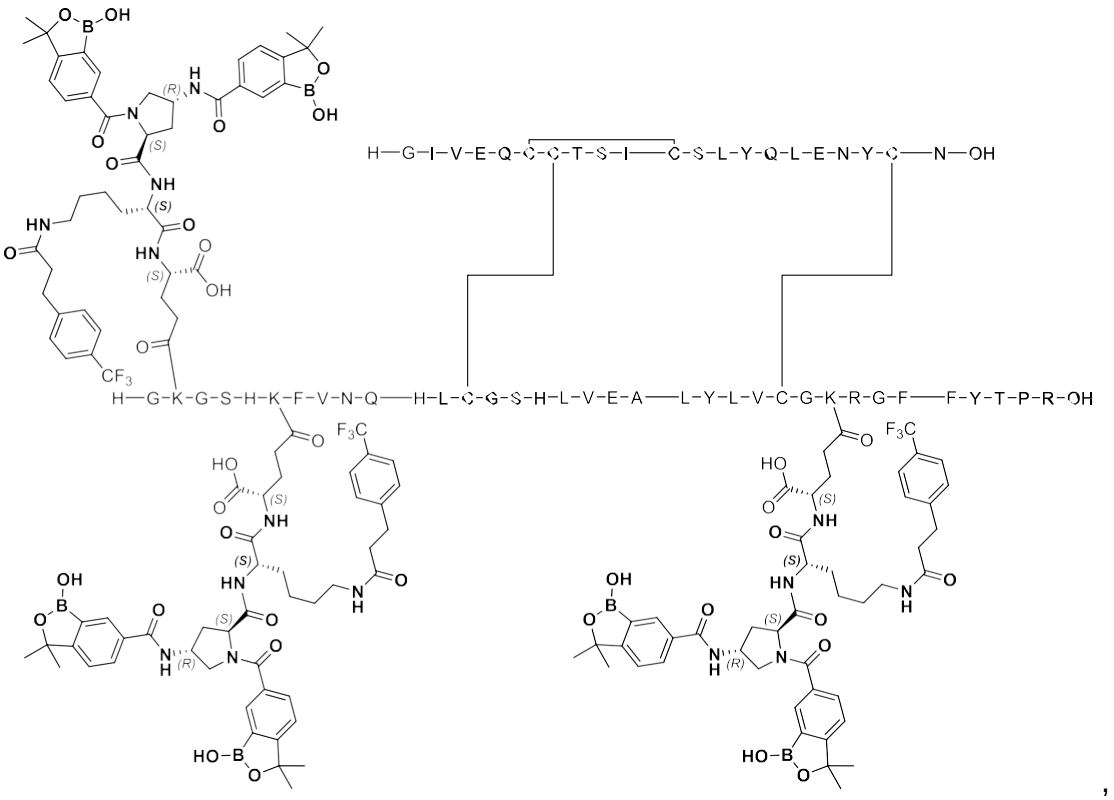
,

Ejemplo 59A:

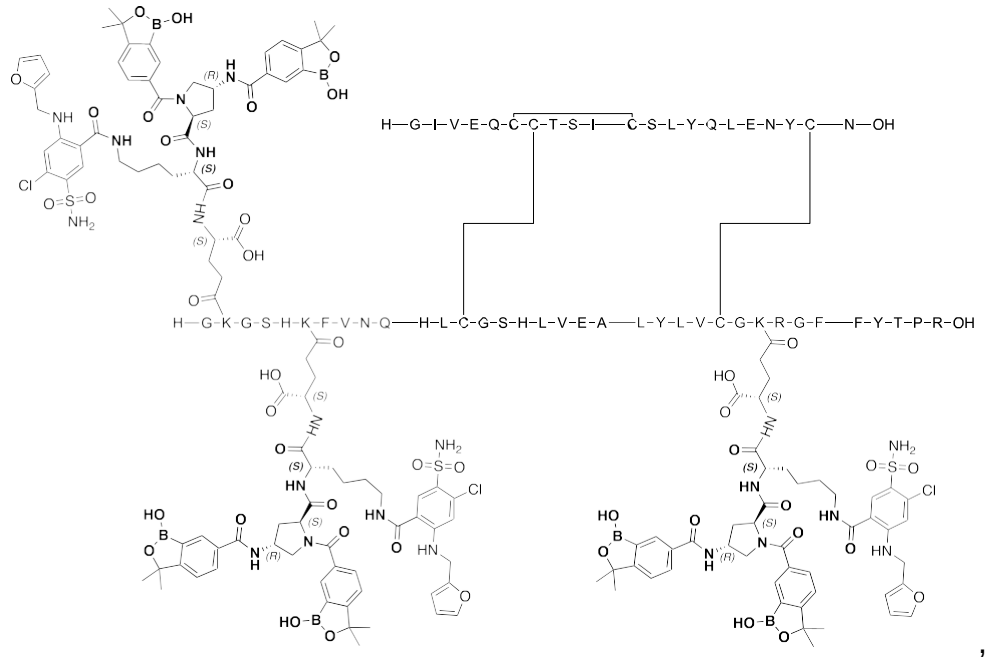

H—G—I—V—E—Q—C—C—T—S—I——C—S—L—Y—Q—L—E—N—Y—C——N—OH
H—G—K—G—S—H—K—F—V—N—Q——H—L—C—G—S—H—L—V—E—A——L—Y—L—V—C—G—K—R—G—F——F—Y—T—P—R—OH

,

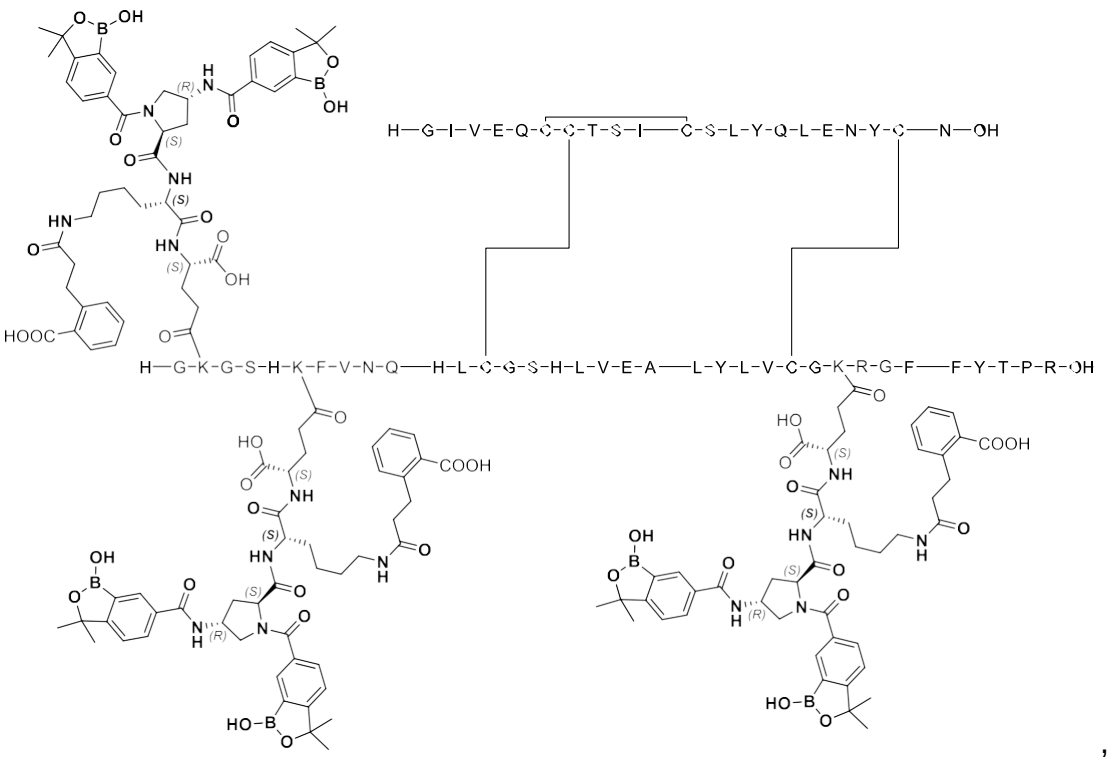
Ejemplo 60A:



Ejemplo 61A:

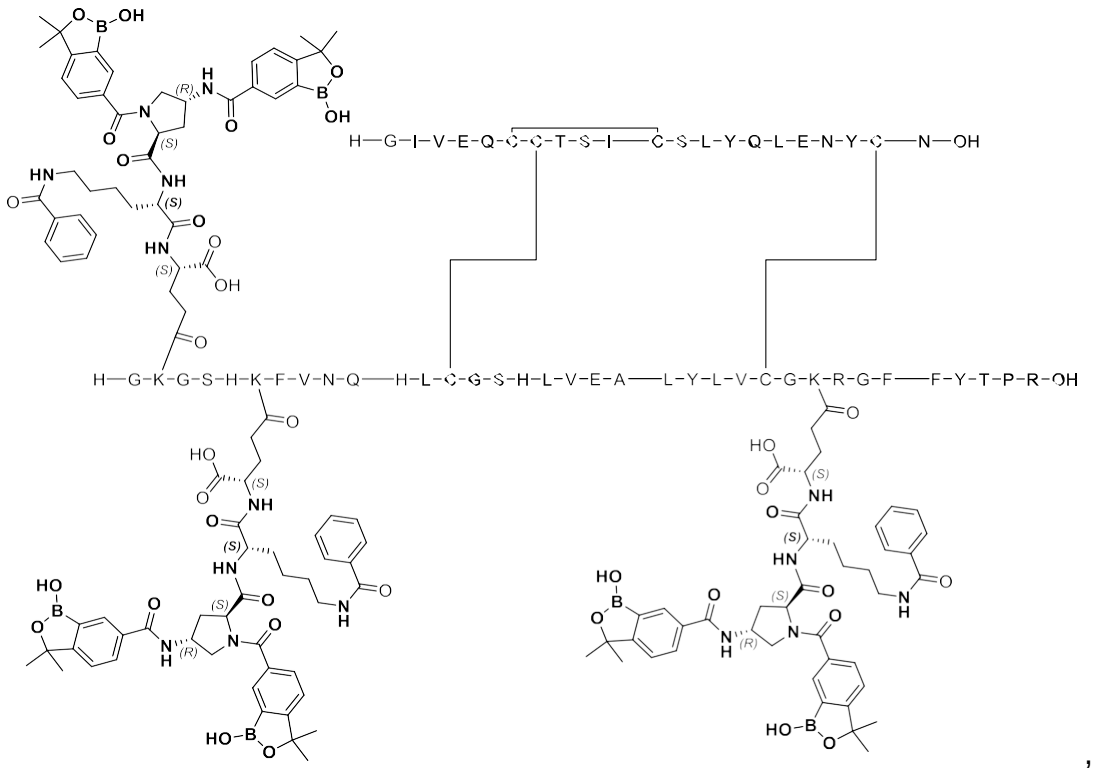


Ejemplo 62A:



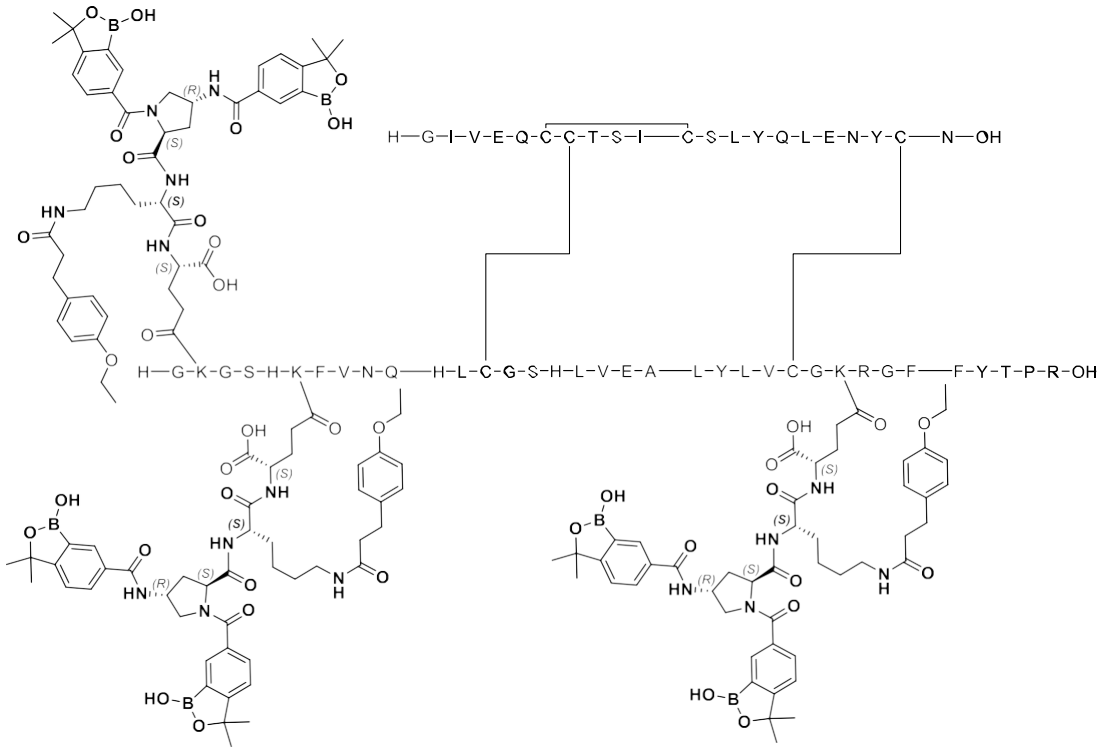
,

Ejemplo 63A:



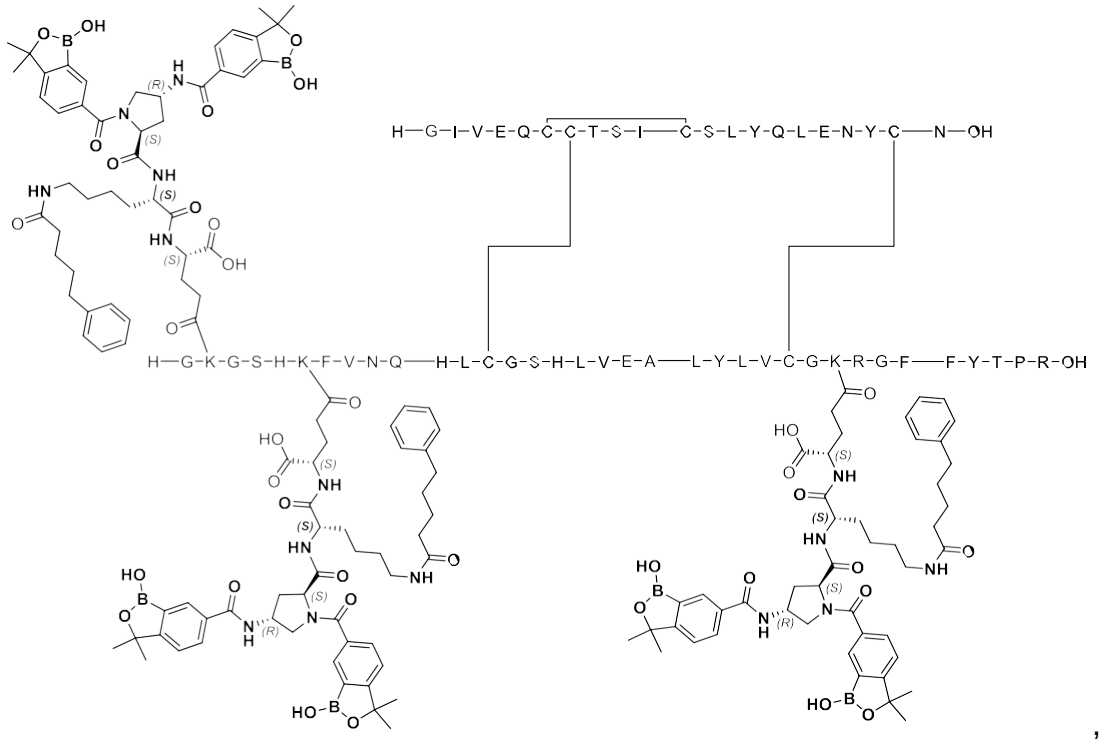
,

Ejemplo 64A:



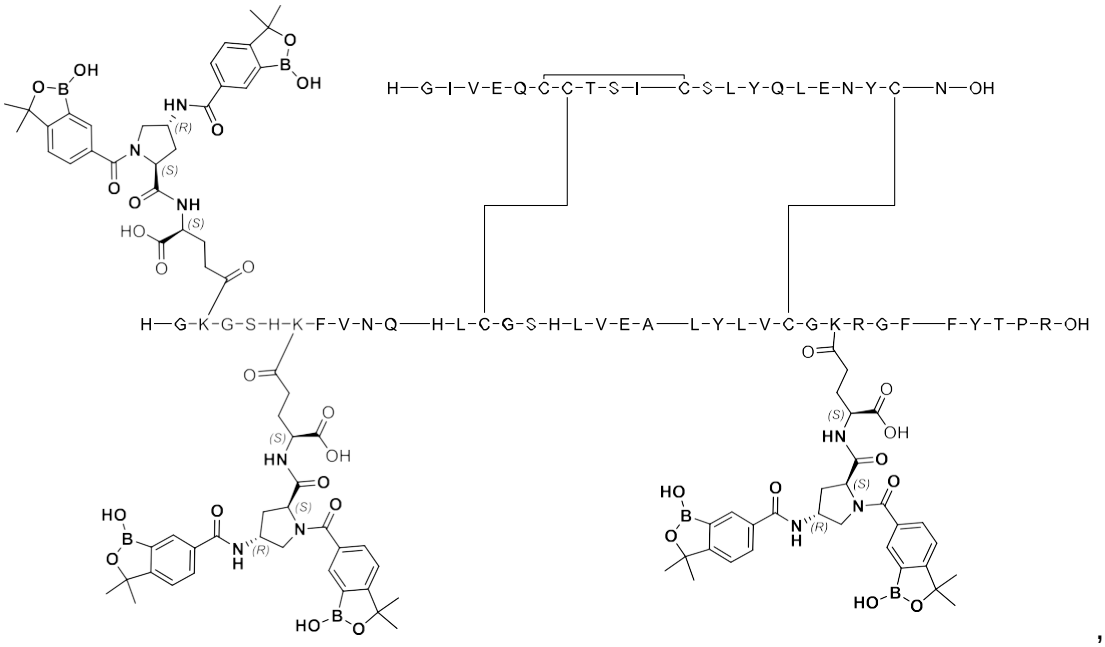
,

Ejemplo 65A:



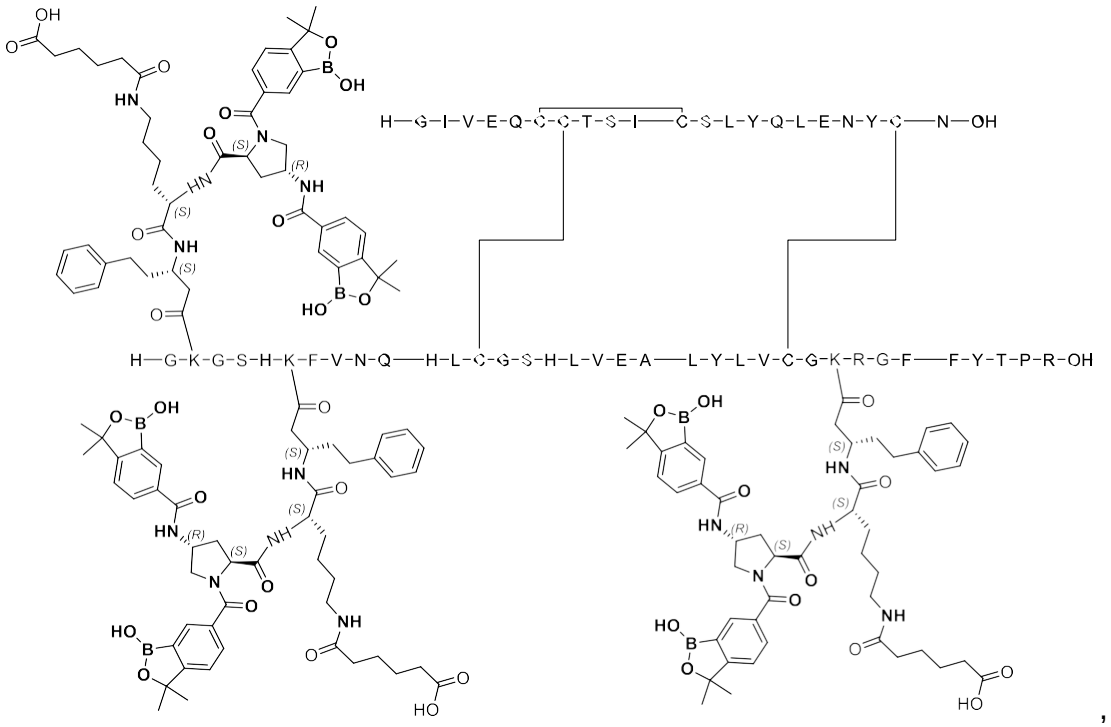
,

Ejemplo 66A:



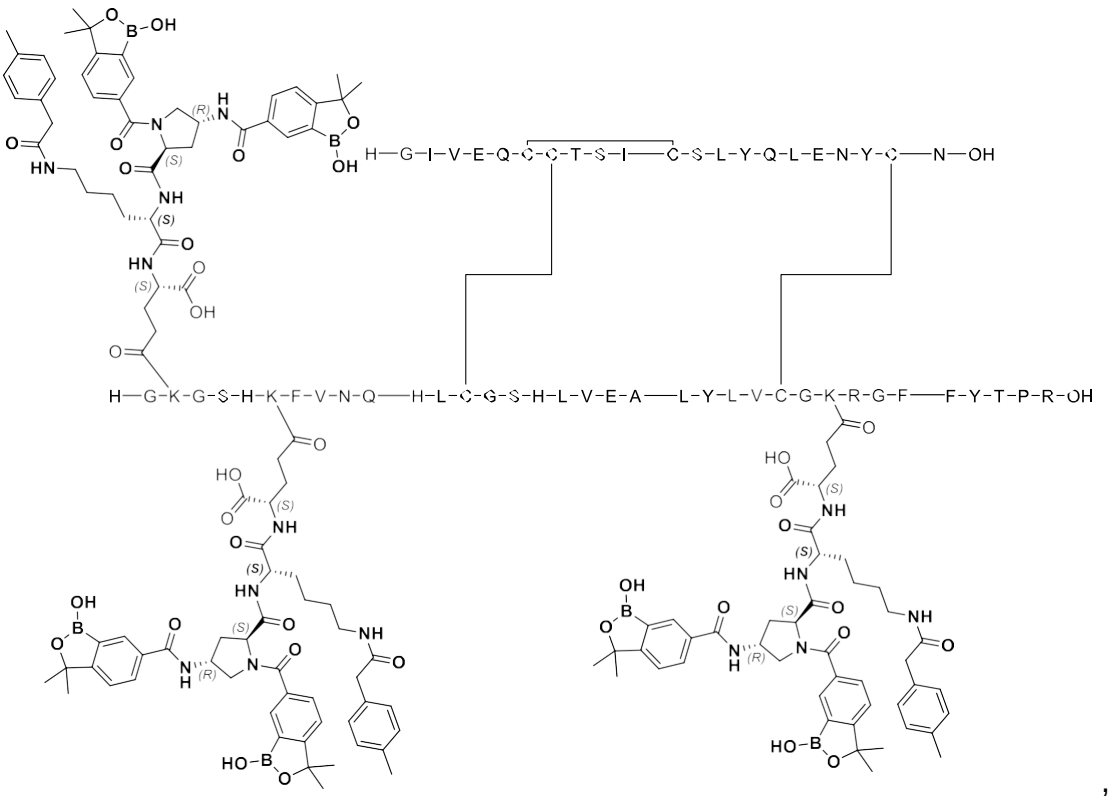
,

Ejemplo 67A:

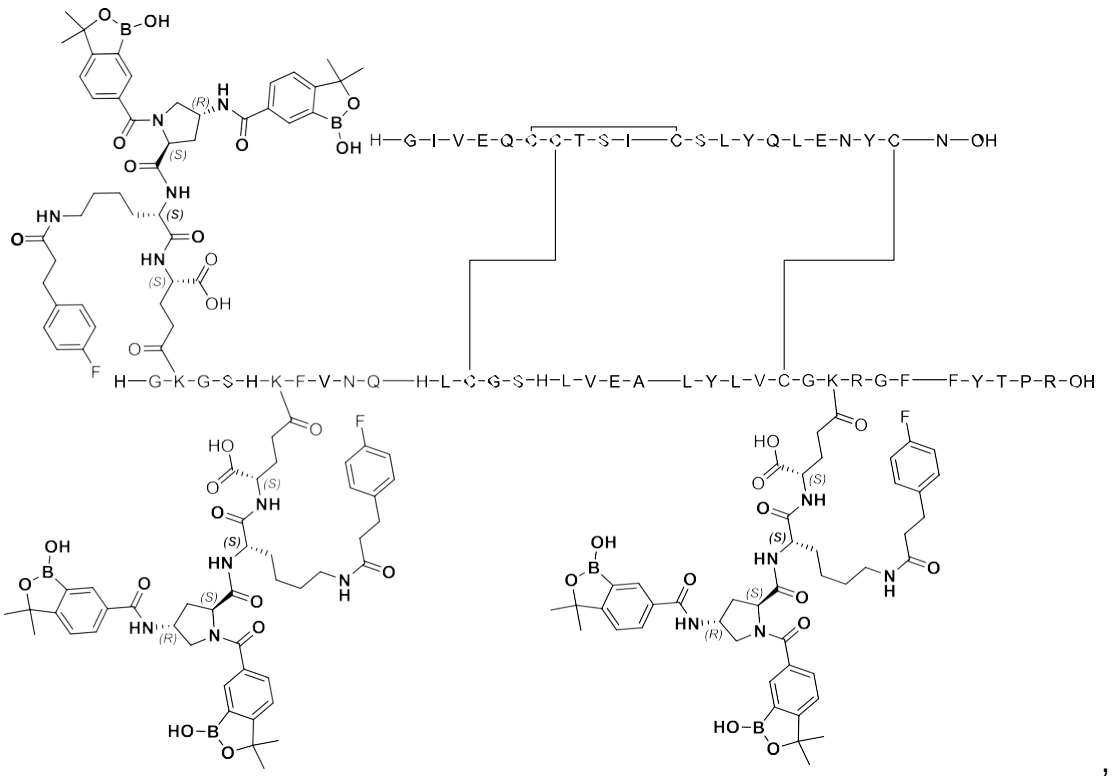


,

Ejemplo 68A:

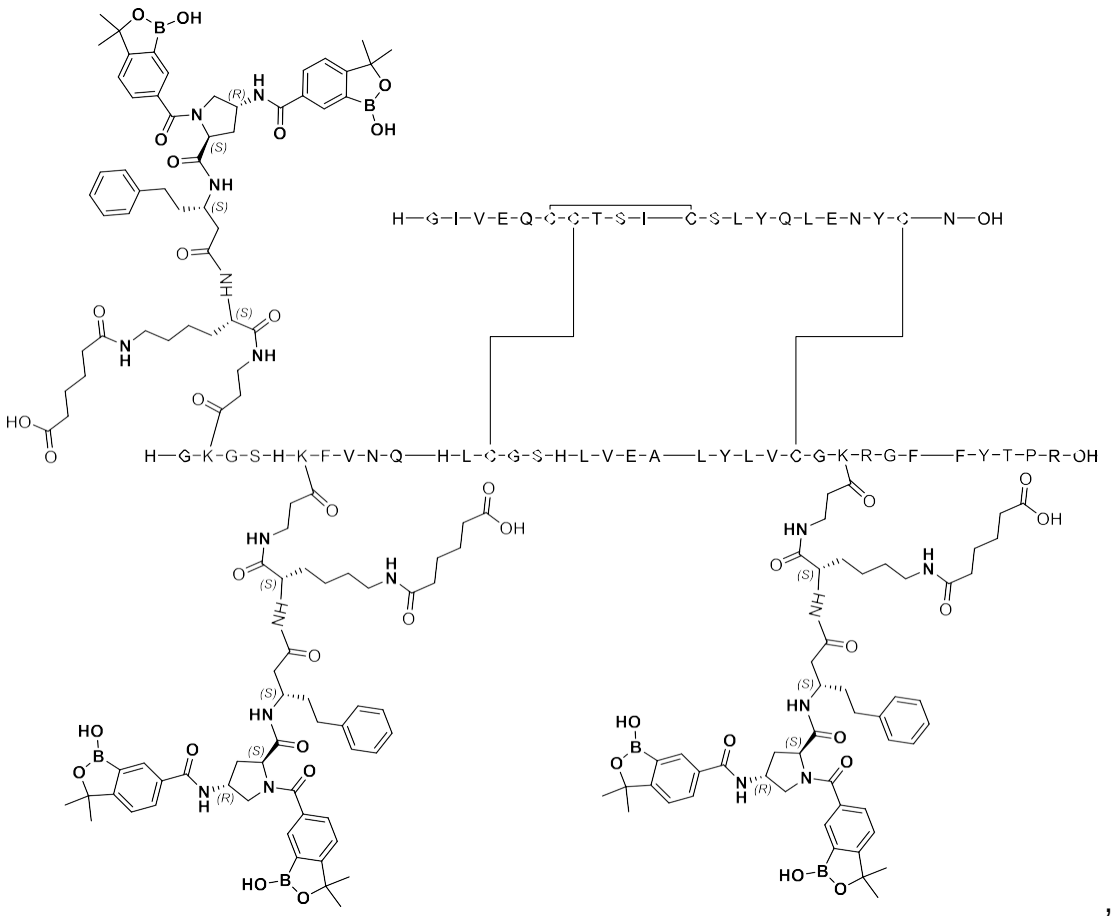


Ejemplo 69A:

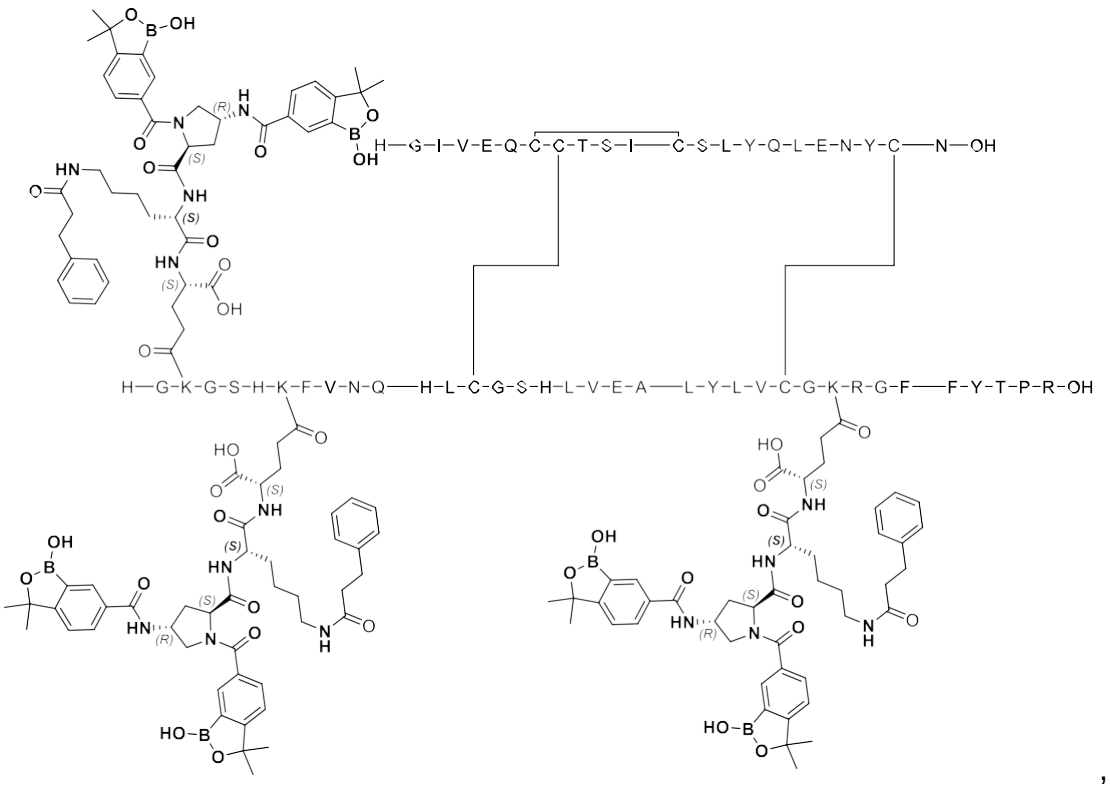


,

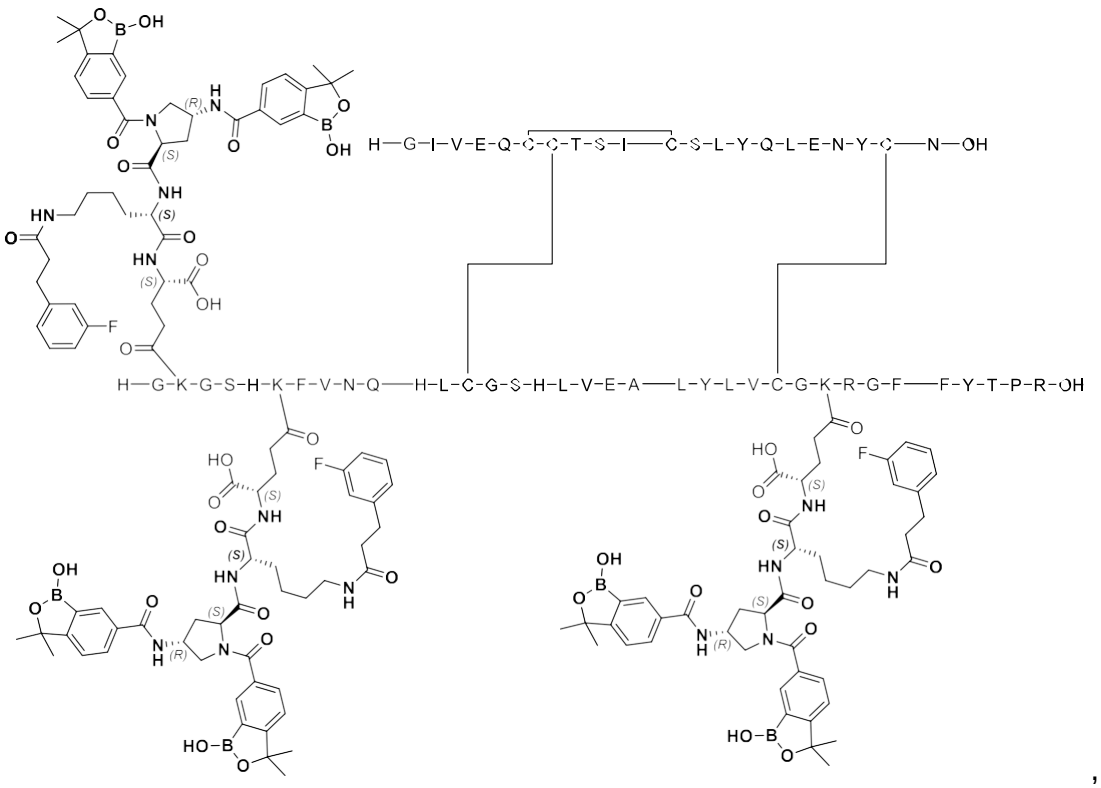
Ejemplo 70A:


H—G—I—V—E—Q—C—C—T—S—I—C—S—L—Y—Q—L—E—N—Y—C—N—OH
H—G—K—G—S—H—K—F—V—N—Q—H—L—C—G—S—H—L—V—E—A—L—Y—L—V—C—G—K—R—G—F—F—Y—T—P—R—OH

Ejemplo 71A:

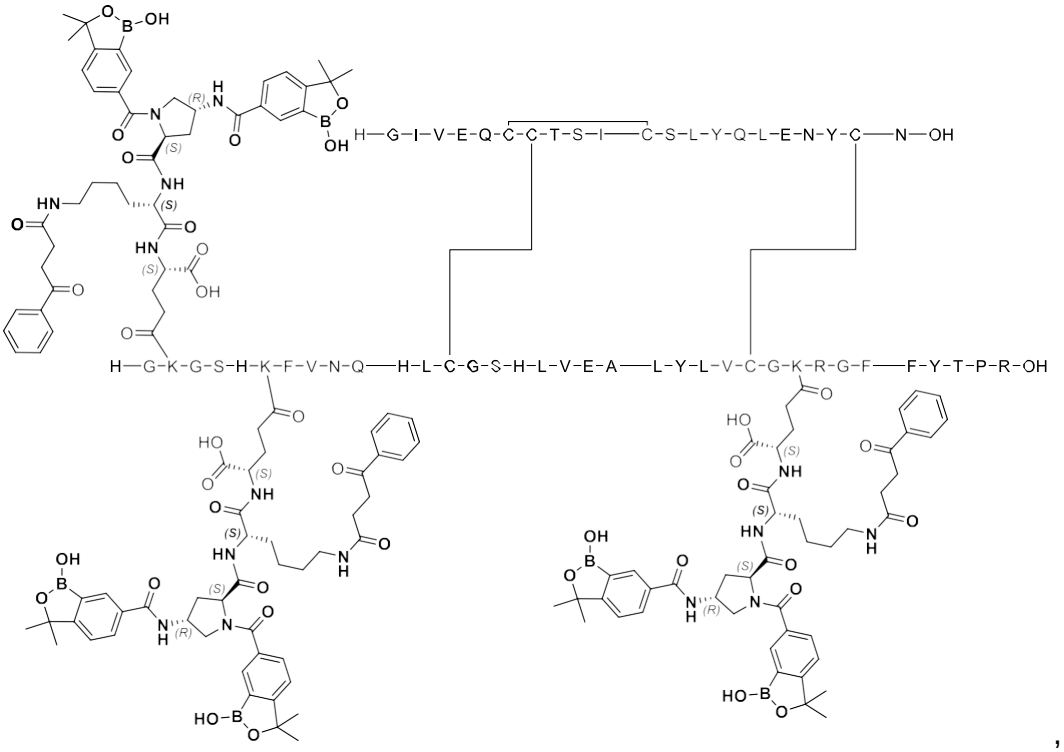


Ejemplo 72A:



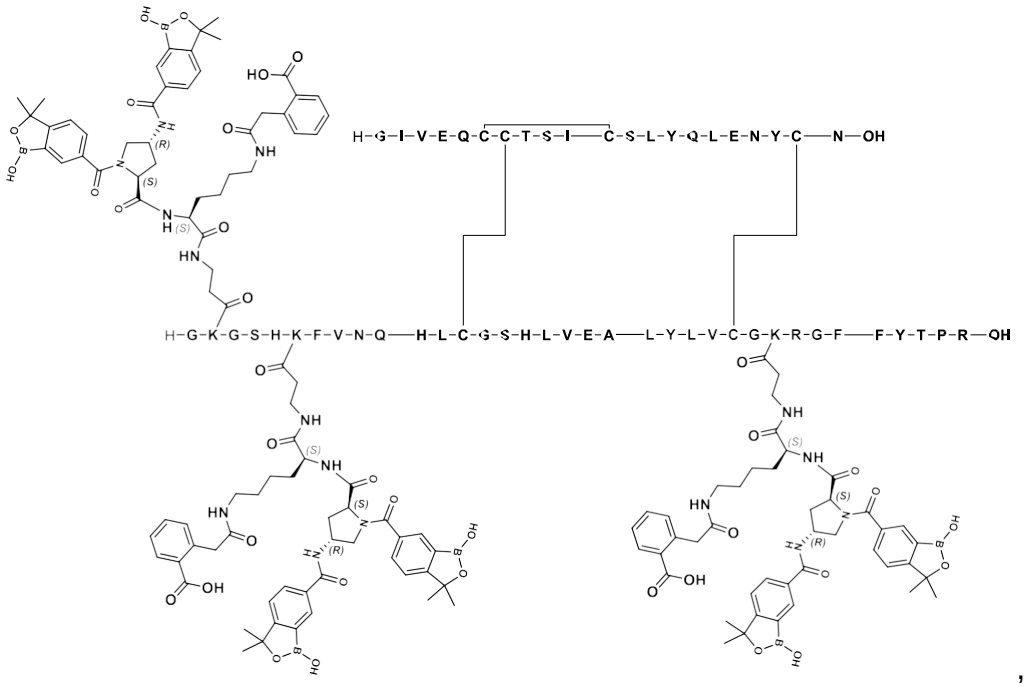
,

Ejemplo 73A:

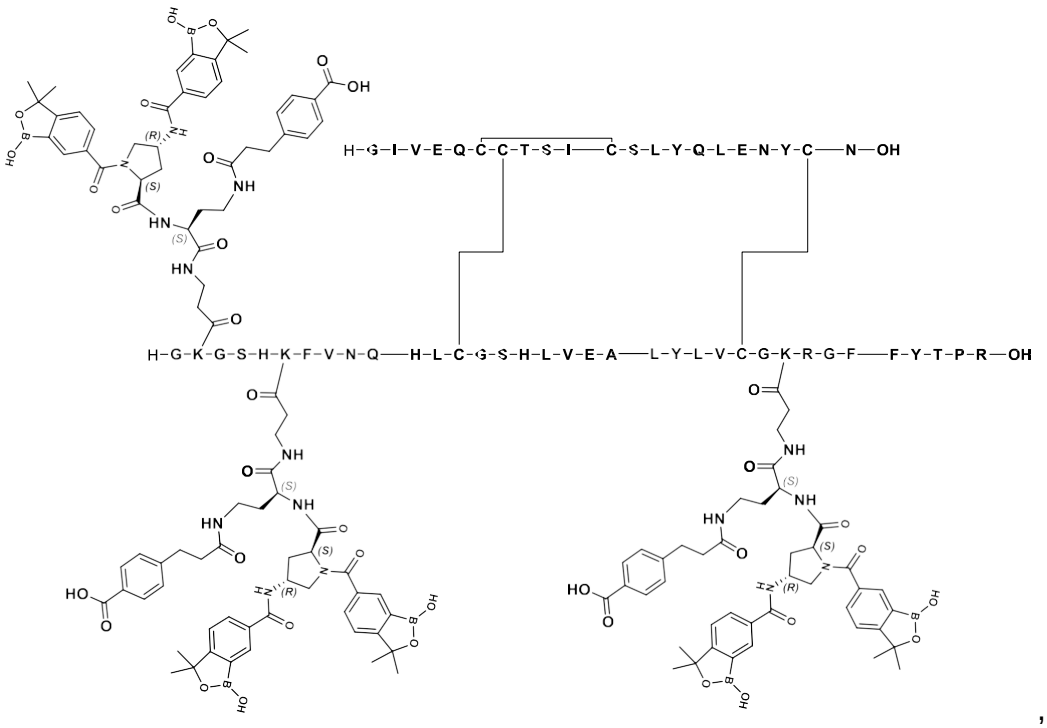


,

Ejemplo 74A:

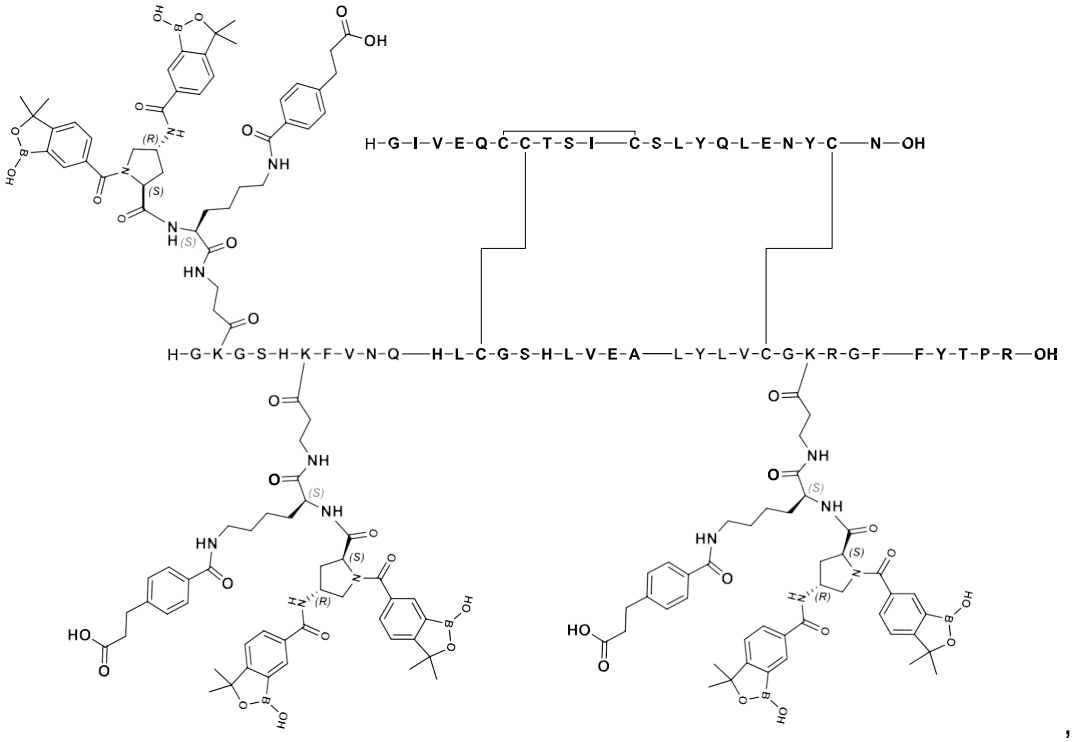


Ejemplo 75A:



,

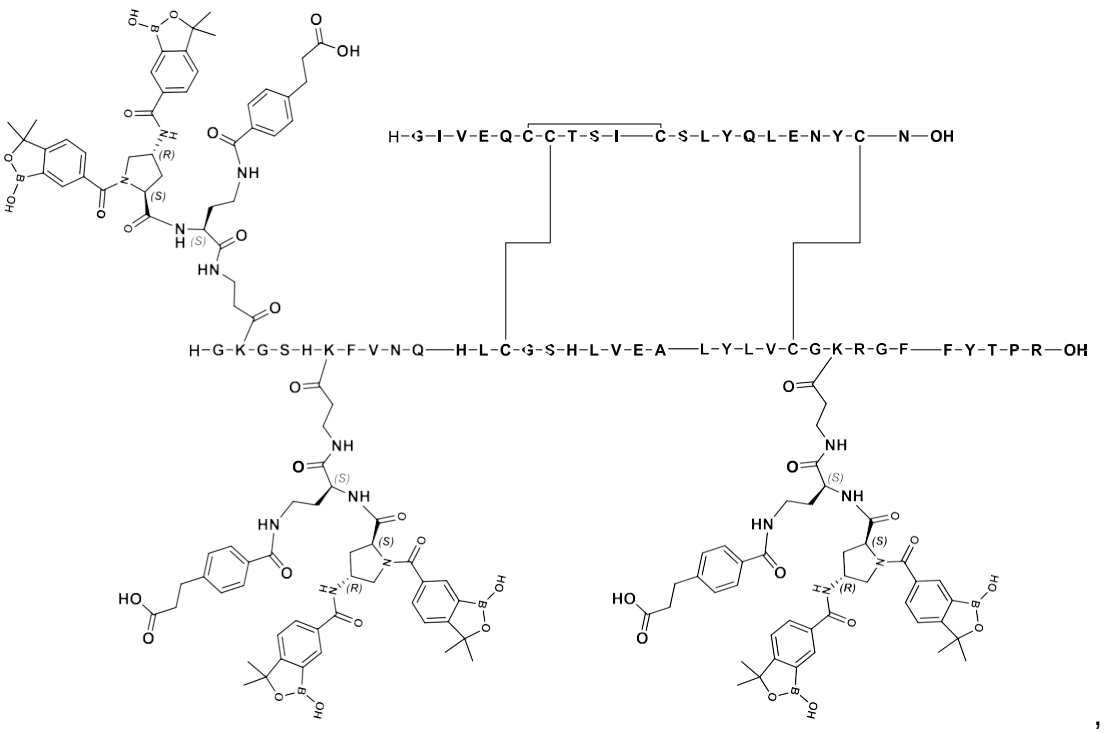
Ejemplo 76A:



,

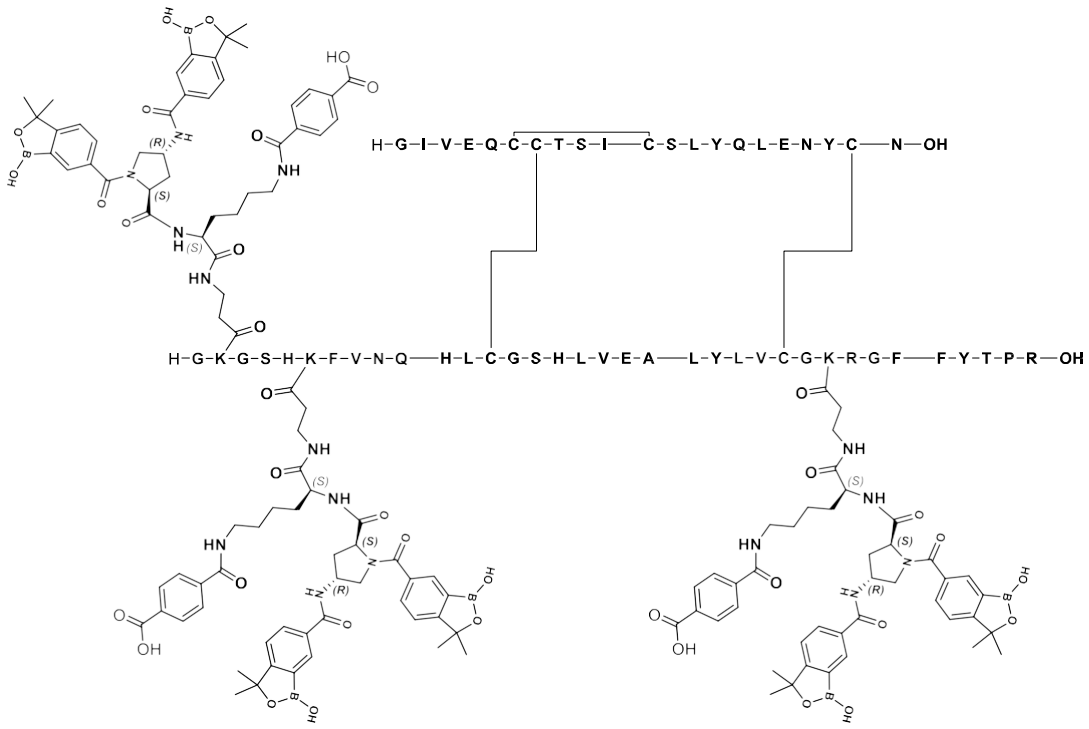
5

Ejemplo 77A:



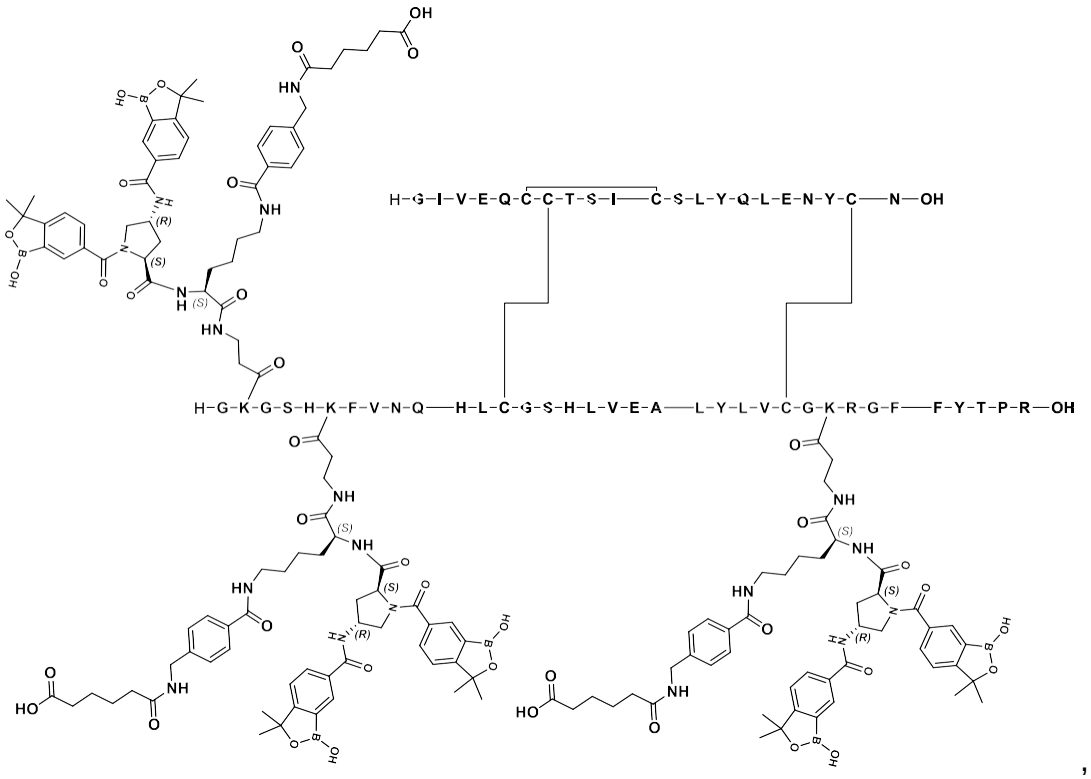
,

Ejemplo 78A:

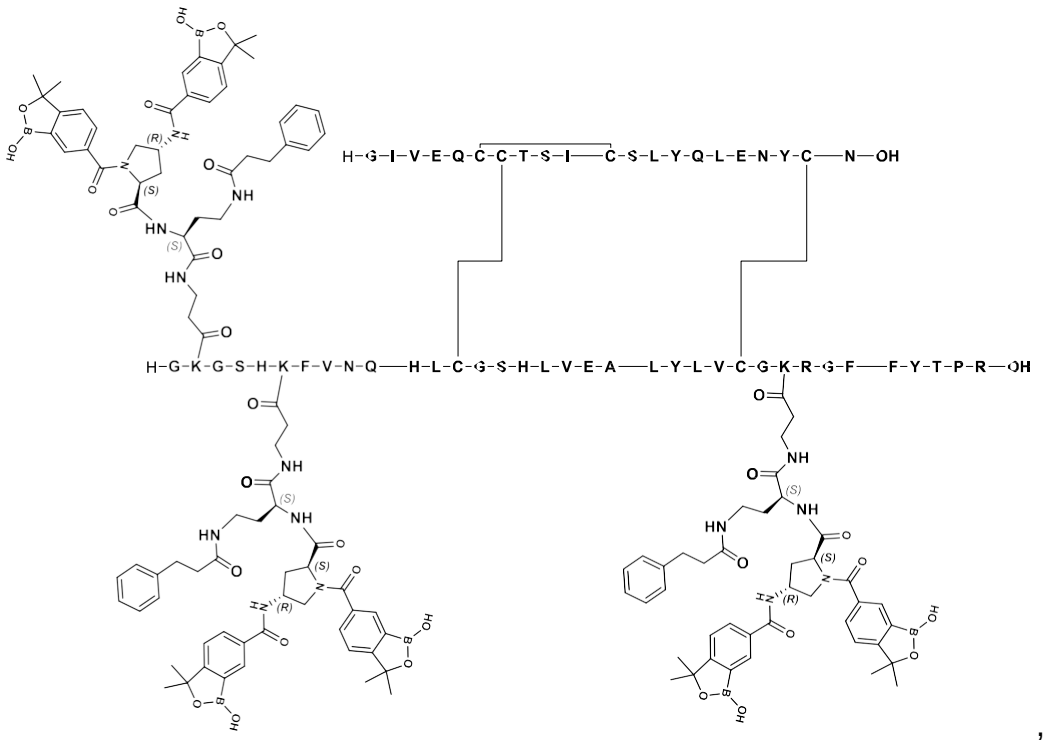


,

Ejemplo 79A:

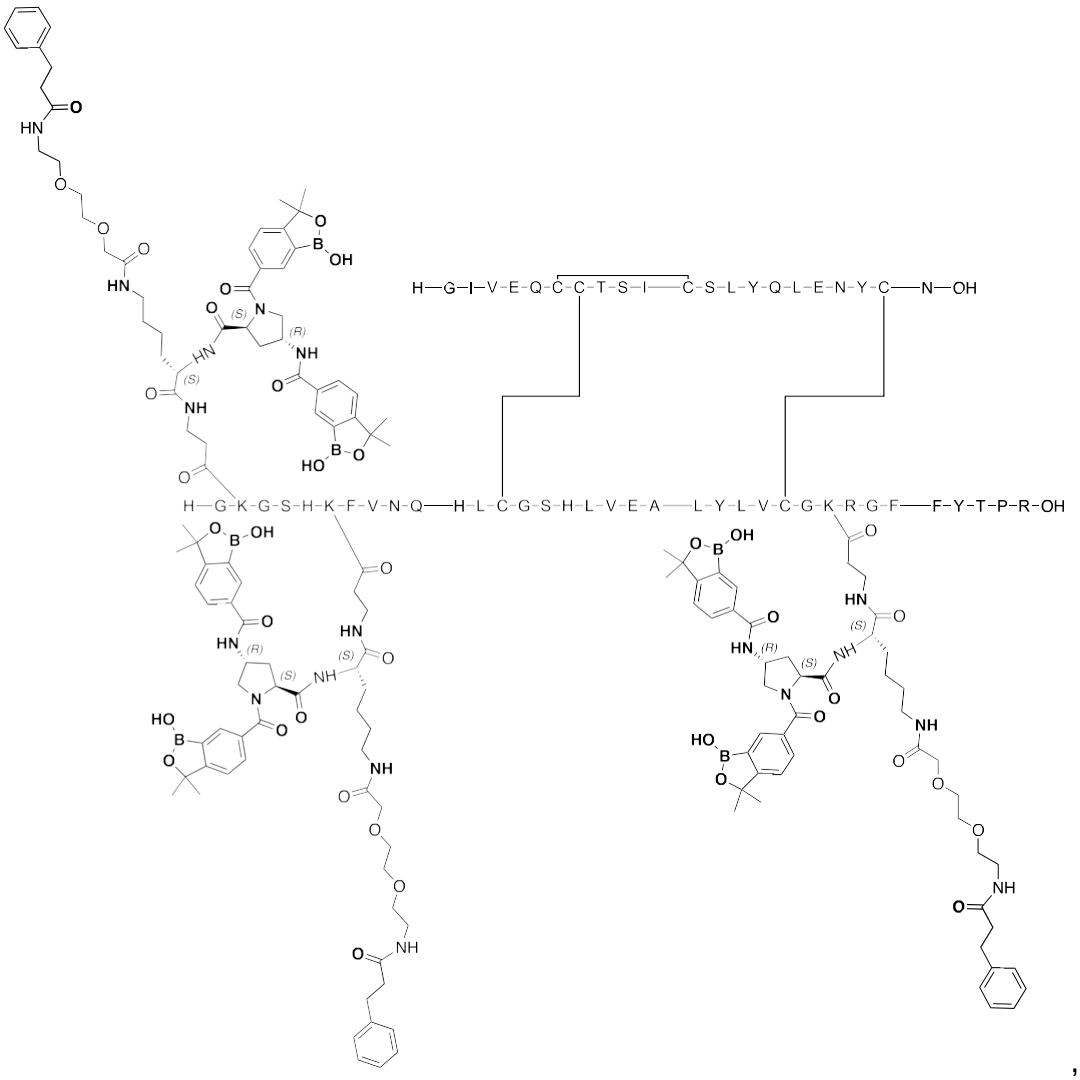


Ejemplo 80A:

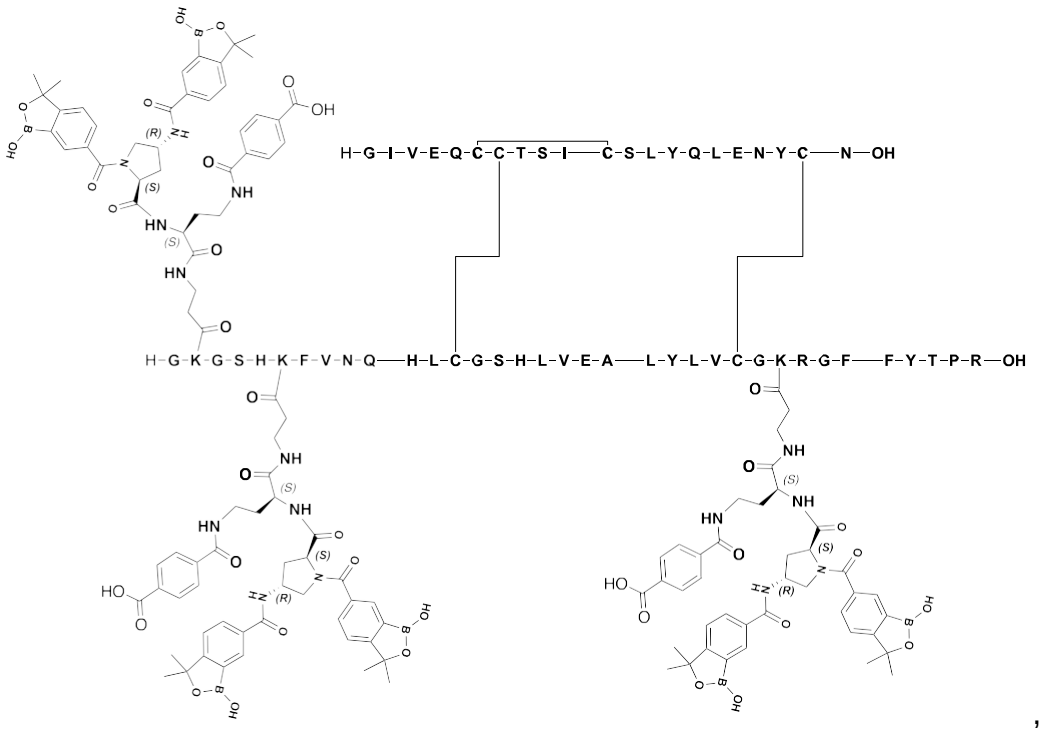

H-G-I-V-E-Q-C-C-T-S-I-C-S-L-Y-Q-L-E-N-Y-C-N-OH
H-G-K-G-S-H-K-F-V-N-Q-H-L-C-G-S-H-L-V-E-A-L-Y-L-V-C-G-K-R-G-F-F-Y-T-P-R-OH

,

Ejemplo 81A:

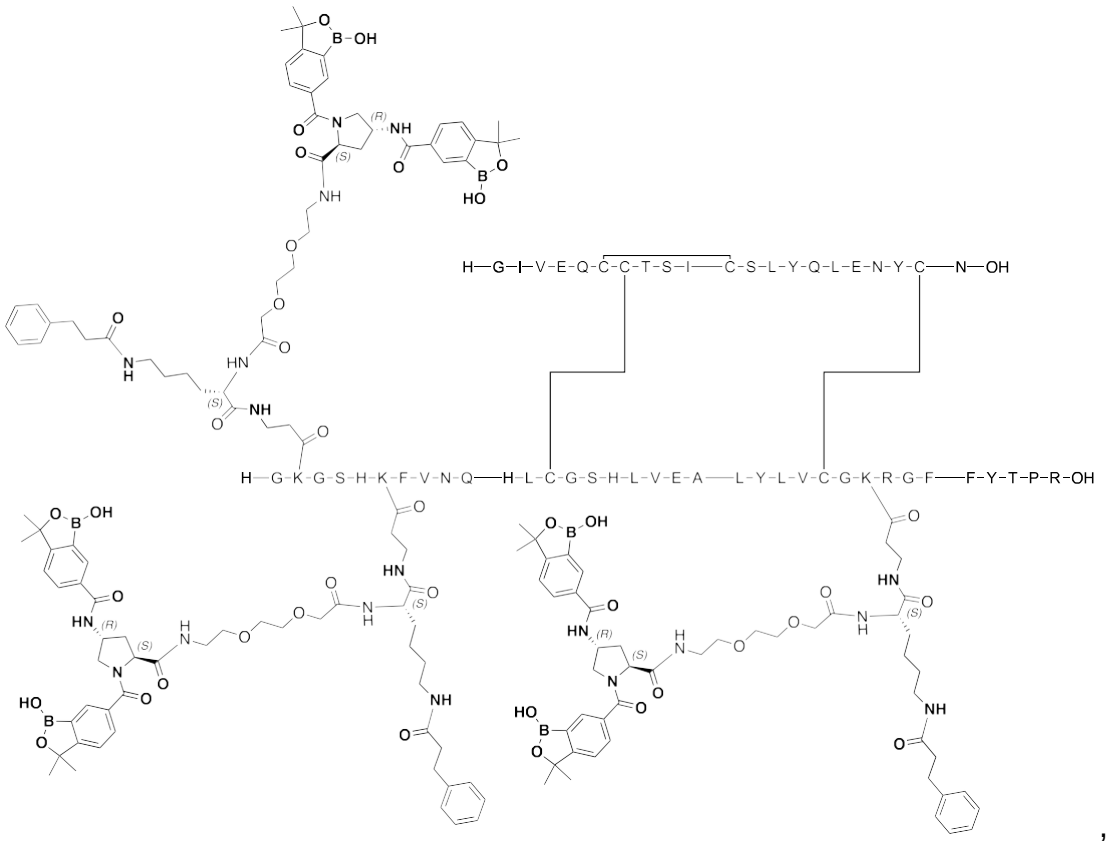


Ejemplo 82A:

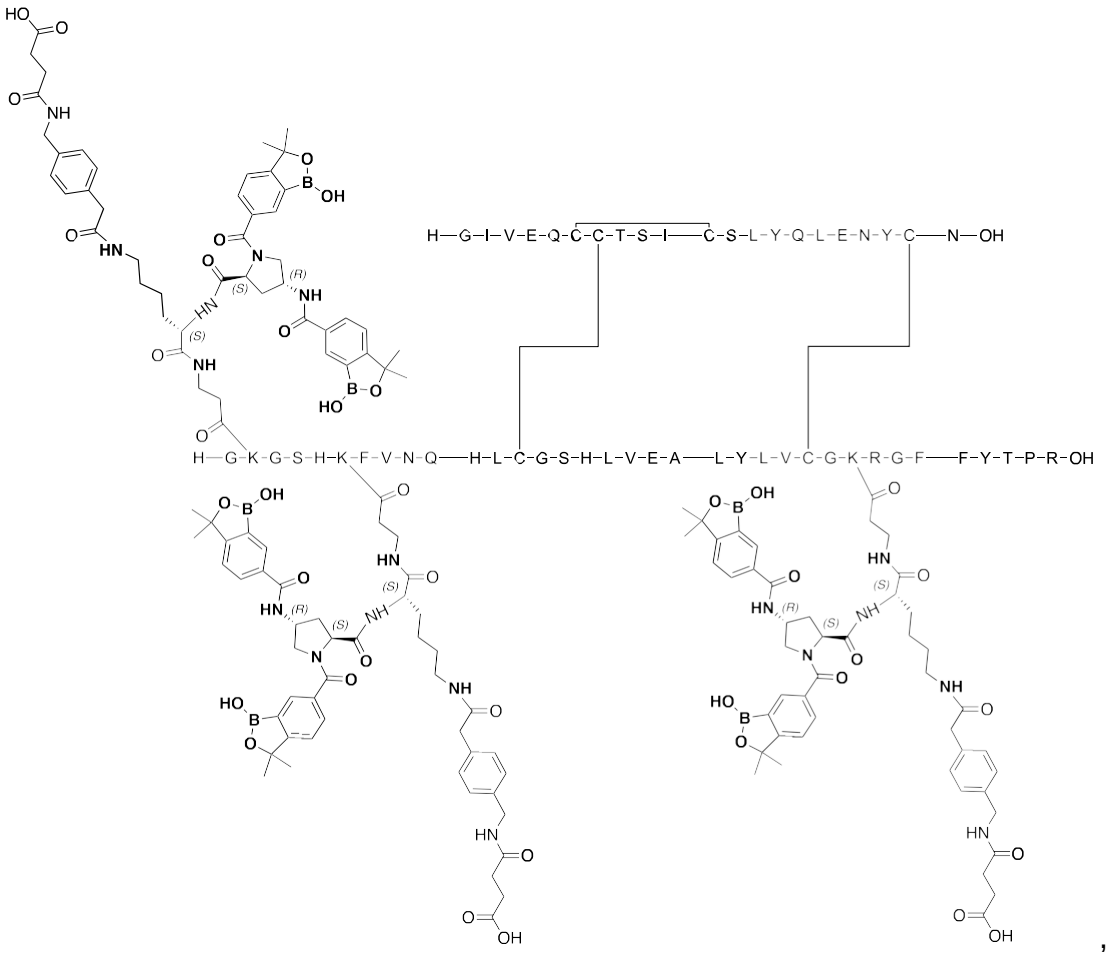

H-G-I-V-E-Q-C-C-T-S-I—C-S-L-Y-Q-L-E-N-Y-C—N—OH
H-G-K-G-S-H-K-F-V-N-Q—H-L-C-G-S-H-L-V-E-A—L-Y-L-V-C-G-K-R-G-F—F-Y-T-P-R—OH

,

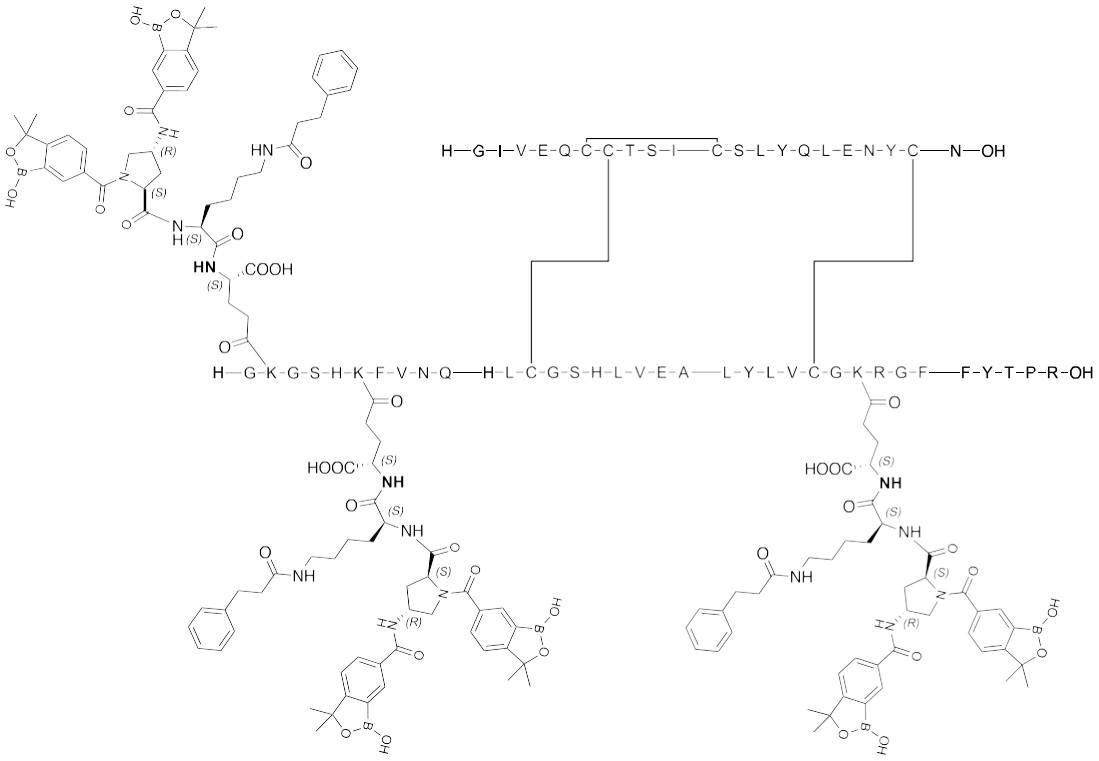
Ejemplo 83A:



Ejemplo 84A:



Ejemplo 85A:



; o

una sal farmacéuticamente aceptable de este, un isótopo de este y combinaciones de este.

35. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en un polipéptido que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de 1, 24051, y 24052; y en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 24063, 25228, 25229, 25232, 25305, 25308, 25312, 25236, 25095, y 25380-25397.

36. Una composición farmacéutica que comprende al menos un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable de este de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-35 y un portador farmacéuticamente aceptable.

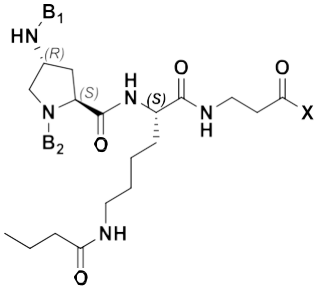
37. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde X1 es una insulina que comprende además de 1 a 5 residuos reemplazados, insertados, añadidos, o mutados a un aminoácido que tiene una amina libre conjugada mediante uno o más del Z1b a un Z1c.

38. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde al menos un Z1c se conjuga mediante uno o más del Z1b a una cadena lateral de amina libre de un aminoácido en X1 que se ha reemplazado, insertado, o mutado en una insulina.

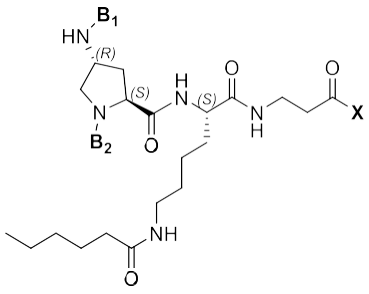
39. Un compuesto de la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o sal farmacéuticamente aceptable de este:

Z1c-enlazador

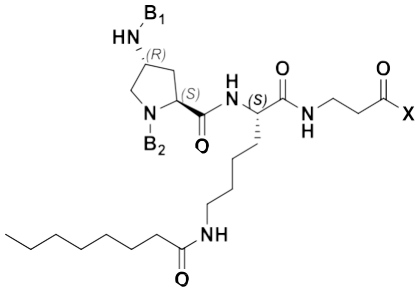
en donde el Z1c-enlazador se selecciona de:



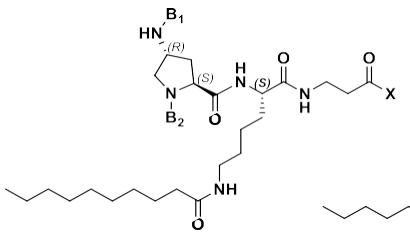
FFL-1



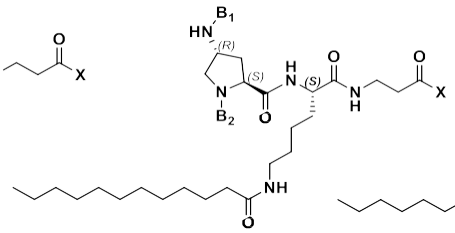
FFL-2



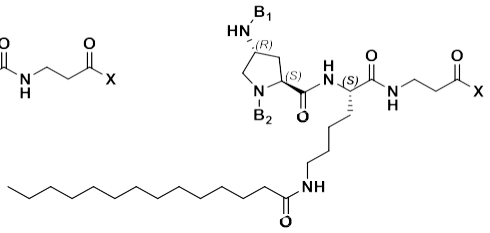
FFL-3



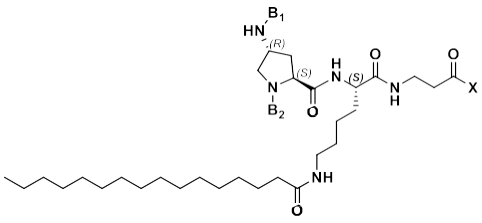
FFL-4



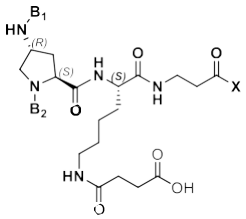
FFL-5



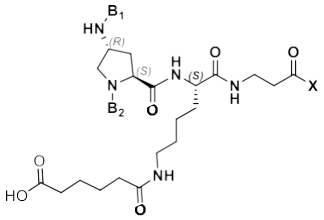
FFL-6



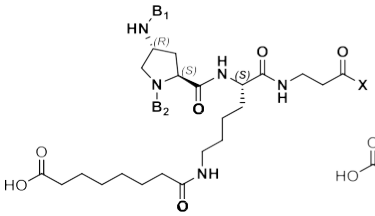
FFL-7



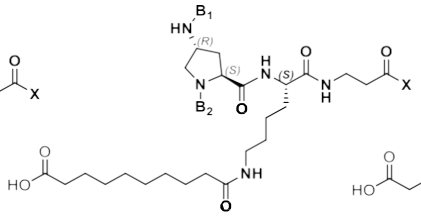
FFL-8



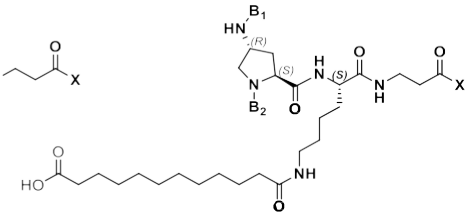
FFL-9



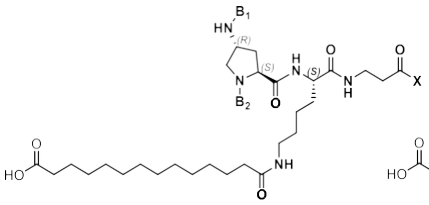
FFL-10



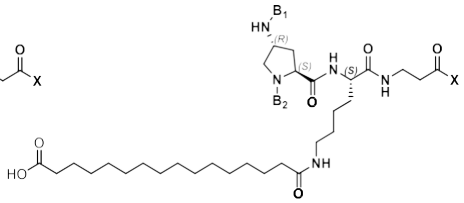
FFL-11



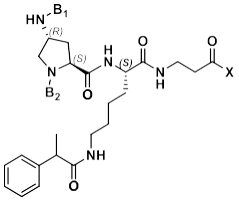
FFL-12



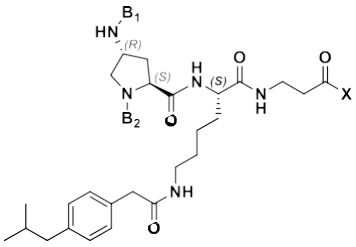
FFL-13



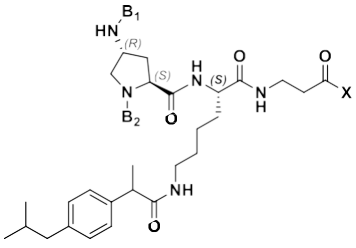
FFL-14



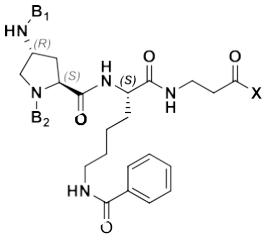
FFL-15



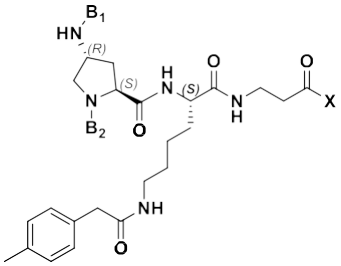
FFL-16



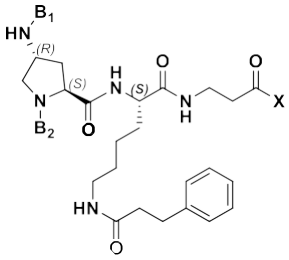
FFL-17



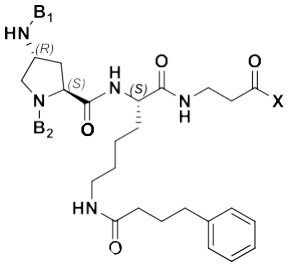
FFL-18



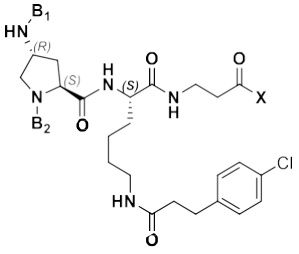
FFL-19



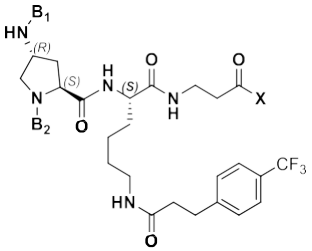
FFL-20



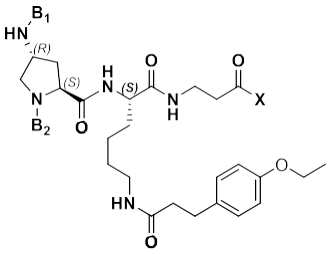
FFL-21



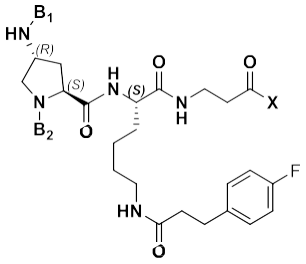
FFL-22



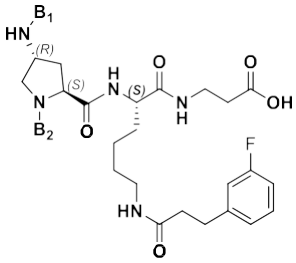
FFL-23



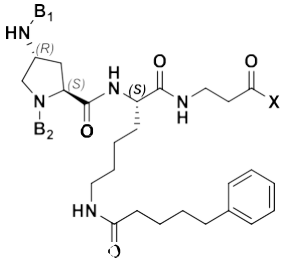
FFL-24



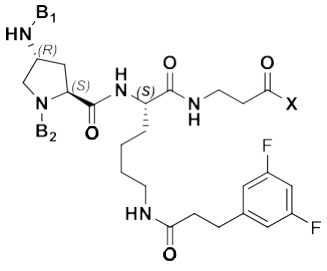
FFL-25



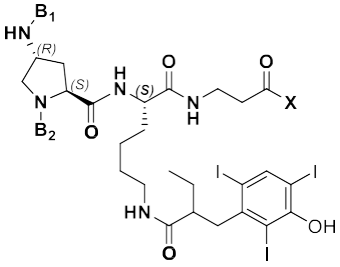
FFL-26



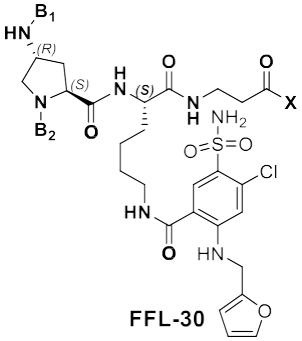
FFL-27



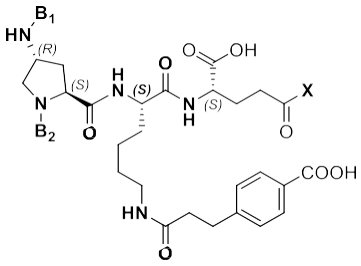
FFL-28



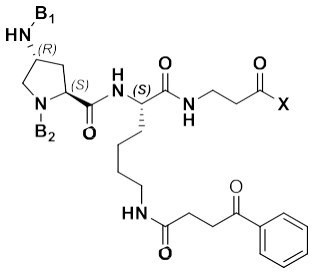
FFL-29



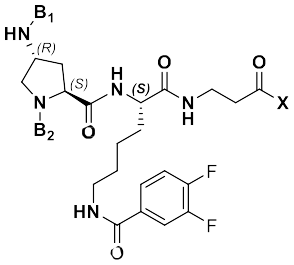
FFL-30



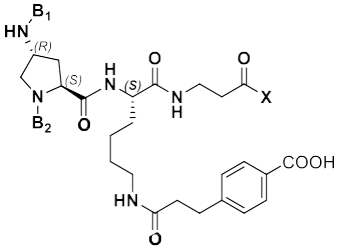
FFL-31



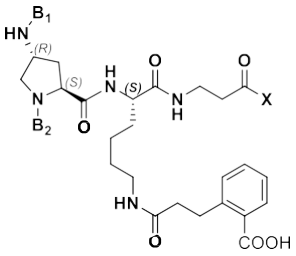
FFL-32



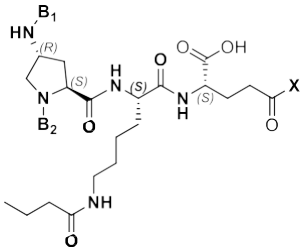
FFL-33



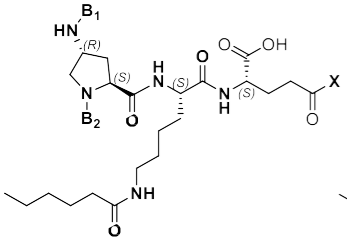
FFL-34



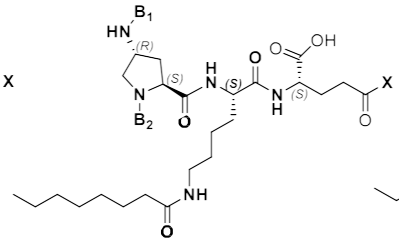
FFL-35



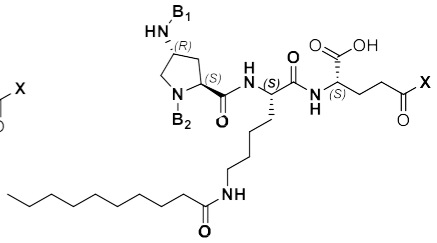
FFL-36



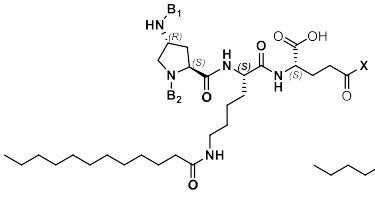
FFL-37



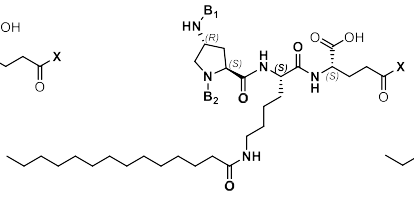
FFL-38



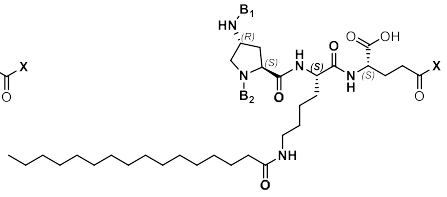
FFL-39



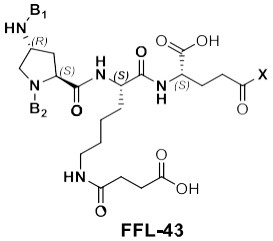
FFL-40



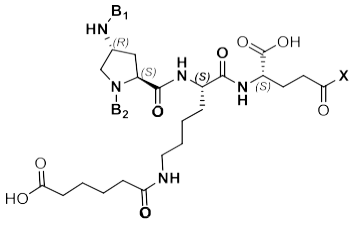
FFL-41



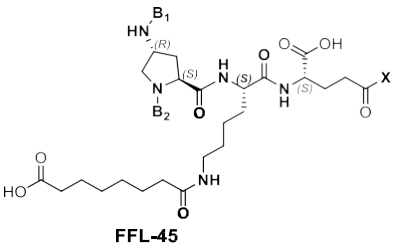
FFL-42



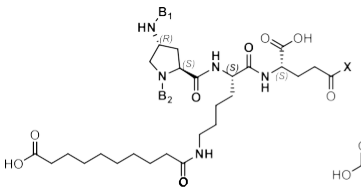
FFL-43



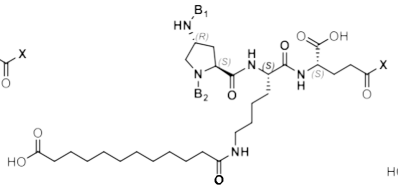
FFL-44



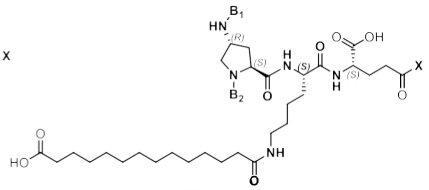
FFL-45



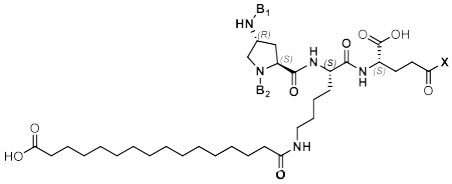
FFL-46



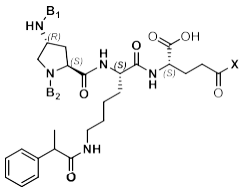
FFL-47



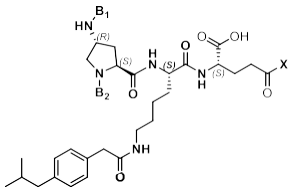
FFL-48



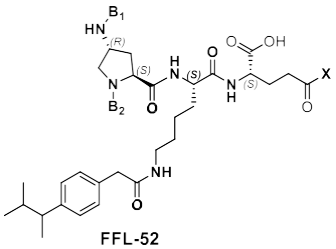
FFL-49



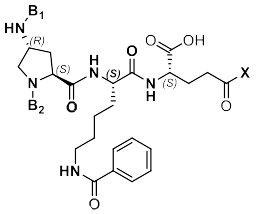
FFL-50



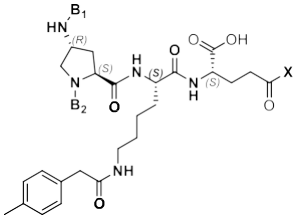
FFL-51



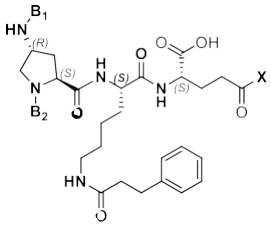
FFL-52



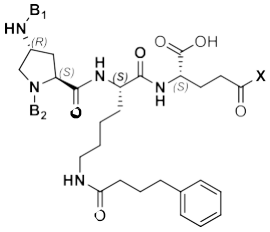
FFL-53



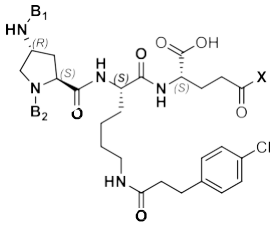
FFL-54



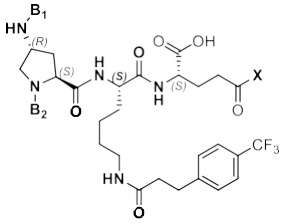
FFL-55



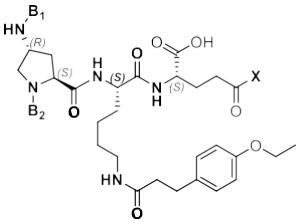
FFL-56



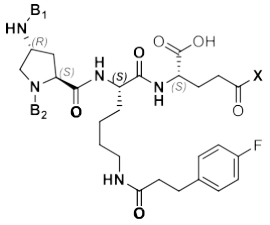
FFL-57



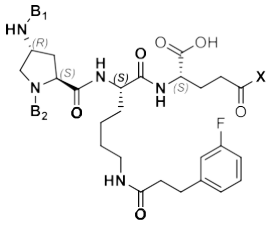
FFL-58



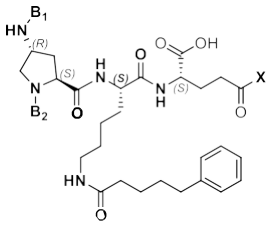
FFL-59



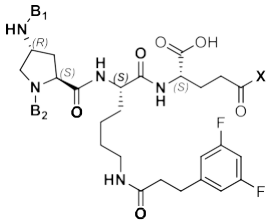
FFL-60



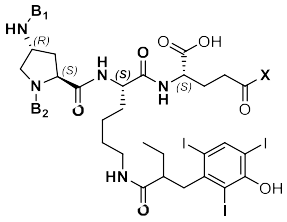
FFL-61



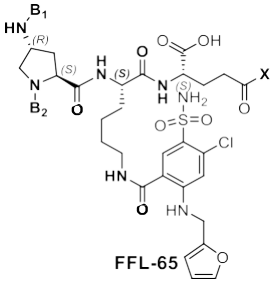
FFL-62



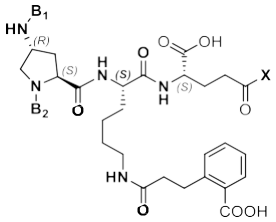
FFL-63



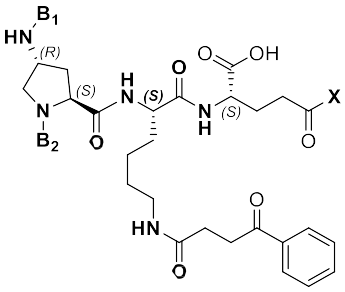
FFL-64



FFL-65

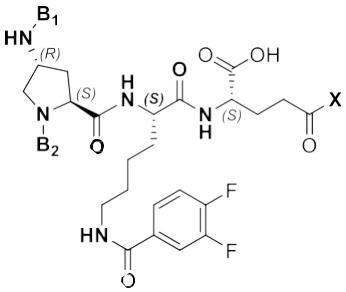


FFL-66



FFL-67

, y

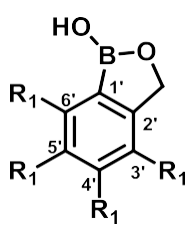


FFL-68

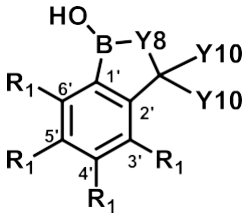
, en donde X se selecciona de un grupo saliente, NH_2, y H; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro.

40. El compuesto de la reivindicación 39, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, que comprende al menos un B_1 o B_2 independientemente seleccionado de las Fórmulas F2 y F7, en donde las Fórmulas F2 y F7 son:



(F2)



(F7)

;

en donde:

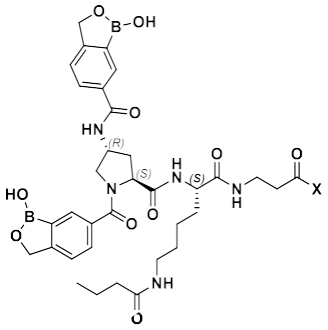
R_1 en la posición 5’ representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c;

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

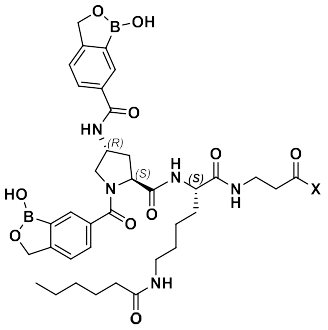
Y8 es O, o Y8 es NR, en donde R es un grupo alquilo C_1-C_6 o H; y

cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, y CF_3, en donde para al menos un F7 al menos un Y10 no es H.

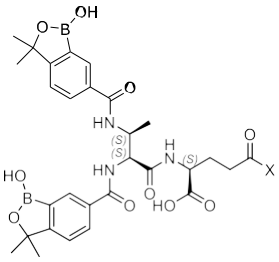
41. El compuesto de la reivindicación 39, en donde el Z1c-enlazador se selecciona de:



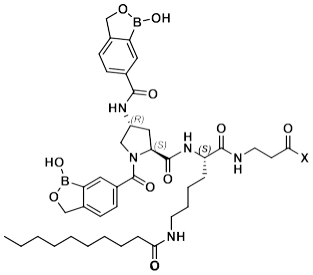
DSL-1



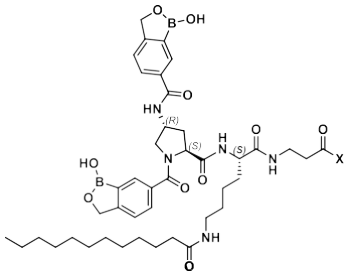
DSL-2



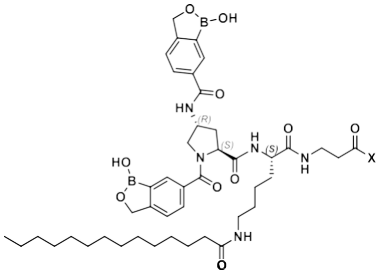
DSL-3



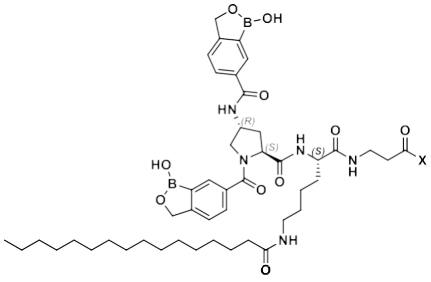
DSL-4



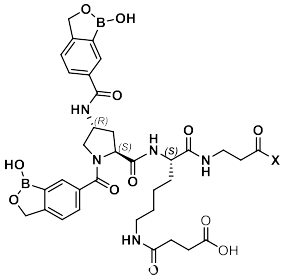
DSL-5



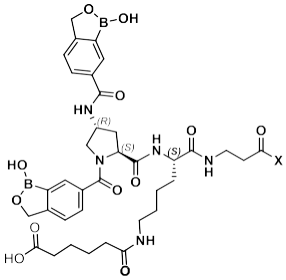
DSL-6



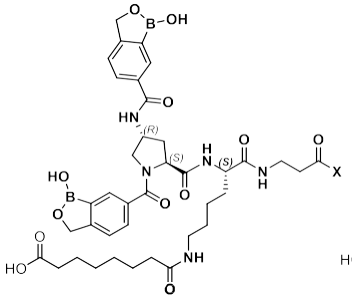
DSL-7



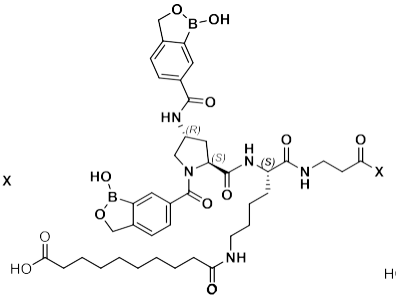
DSL-8



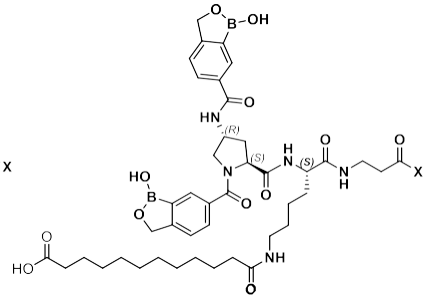
DSL-9



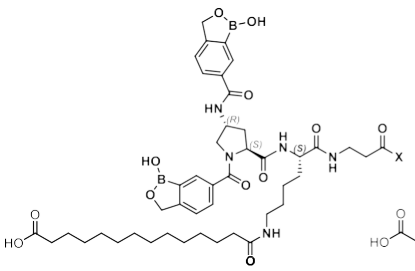
DSL-10



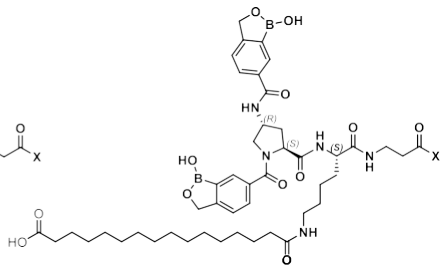
DSL-11



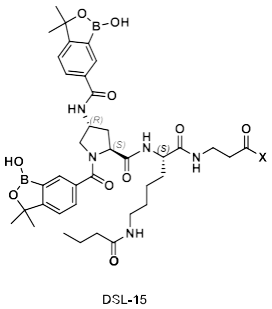
DSL-12



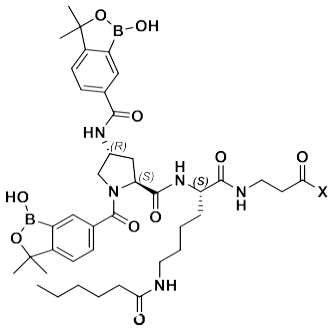
DSL-13



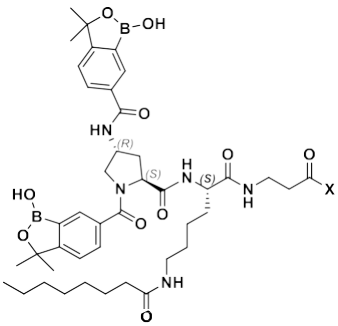
DSL-14



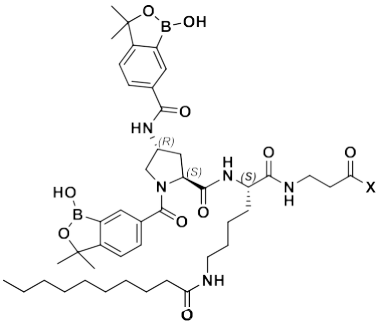
DSL-15



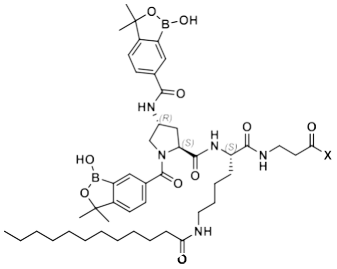
DSL-16



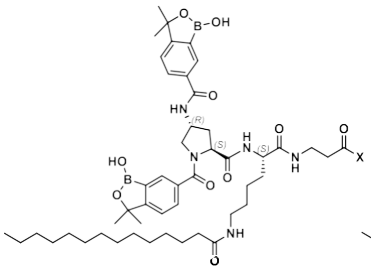
DSL-17



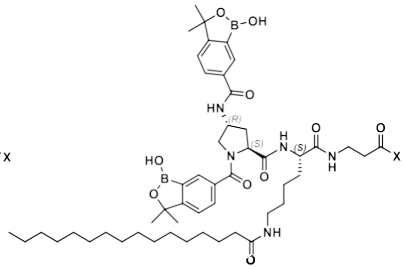
DSL-18



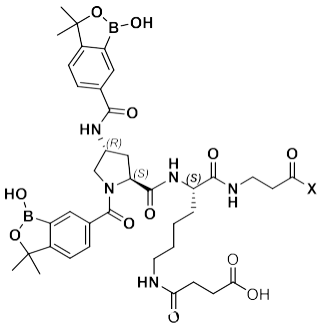
DSL-19



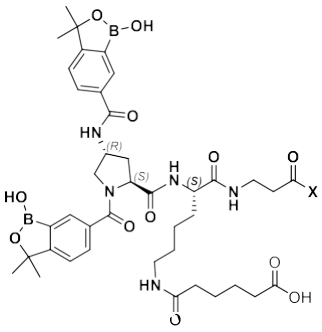
DSL-20



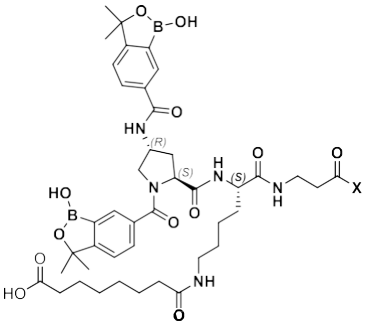
DSL-21



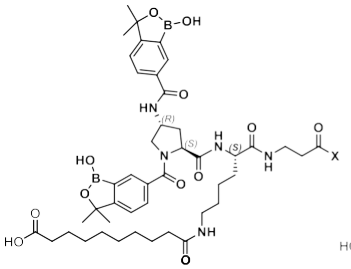
DSL-22



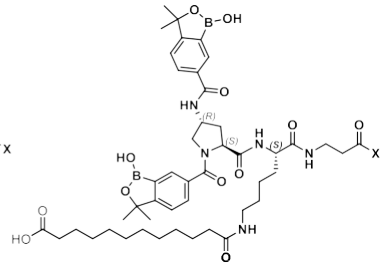
DSL-23



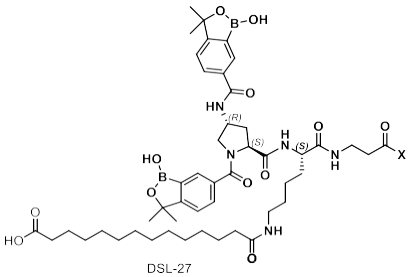
DSL-24



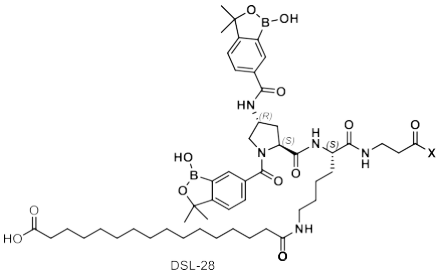
DSL-25



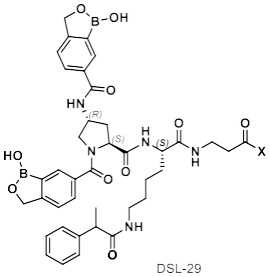
DSL-26



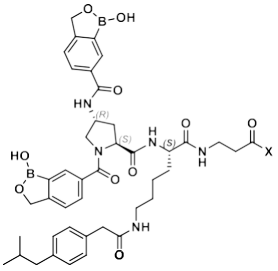
DSL-27



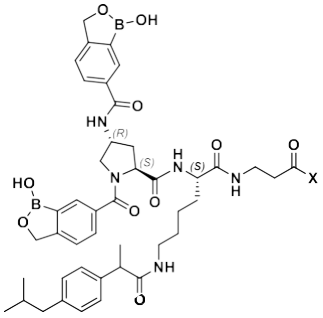
DSL-28



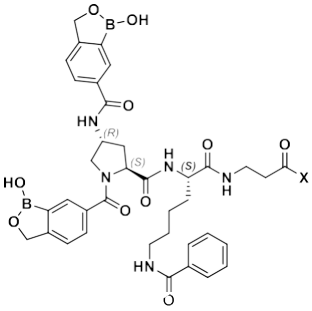
DSL-29



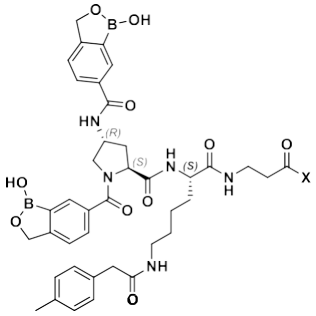
DSL-30



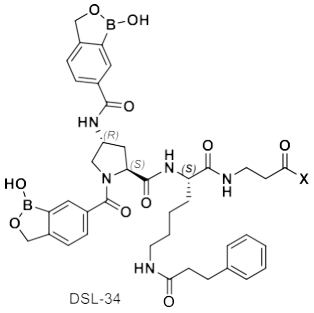
DSL-31



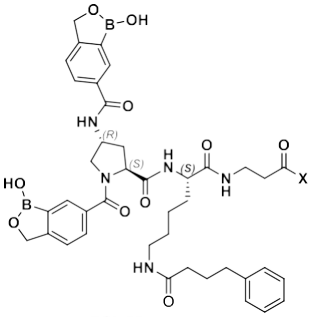
DSL-32



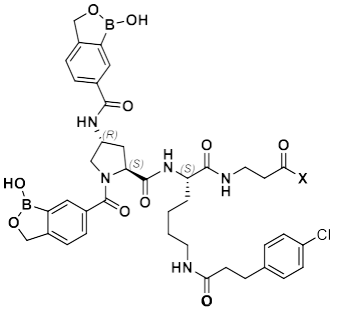
DSL-33



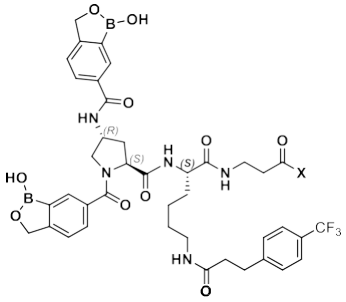
DSL-34



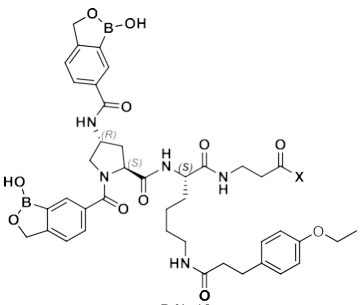
DSL-35



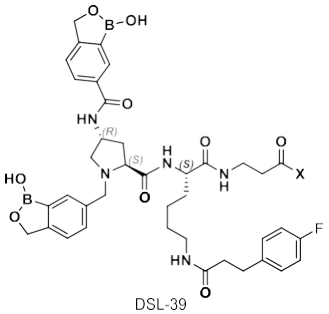
DSL-36



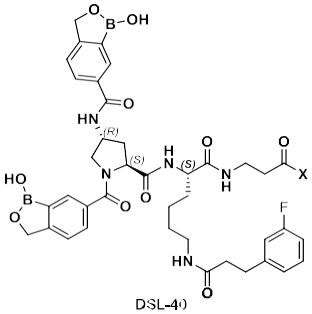
DSL-37



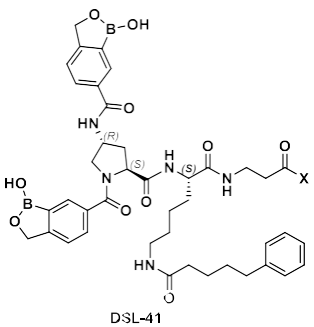
DSL-38



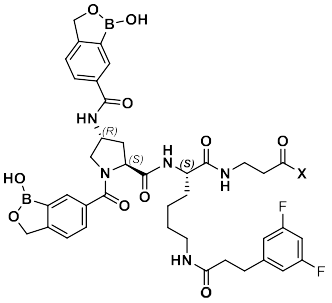
DSL-39



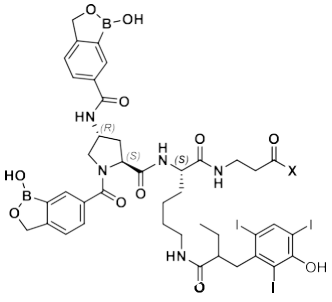
DSL-40



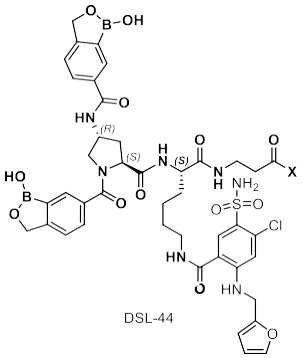
DSL-41



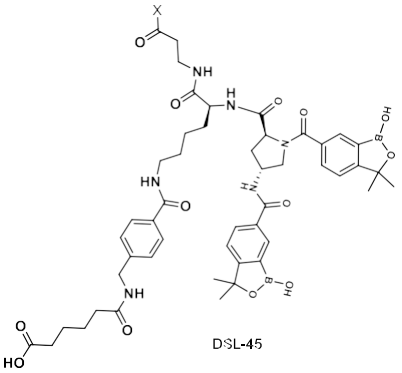
DSL-42



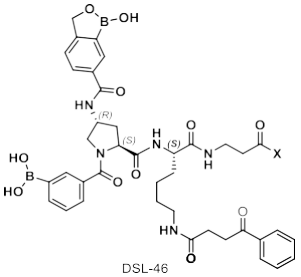
DSL-43



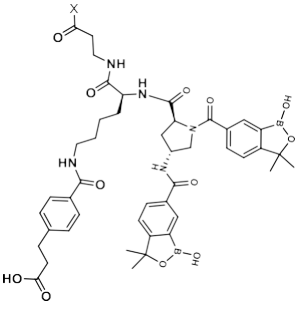
DSL-44



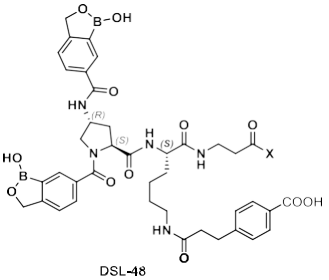
DSL-45



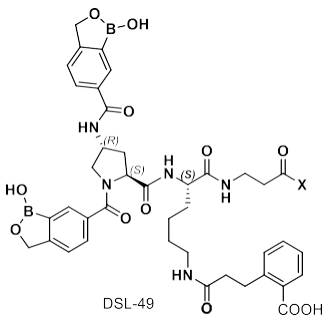
DSL-46

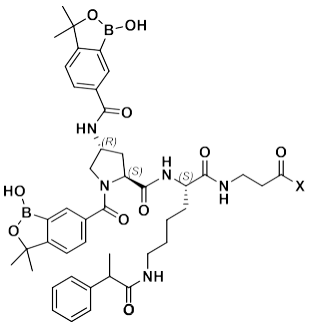


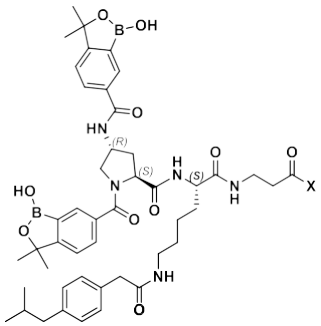
DSL-47

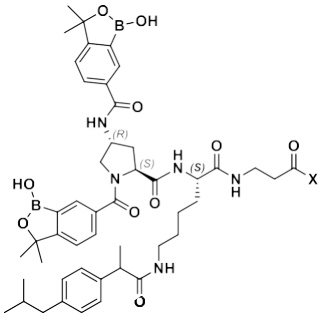


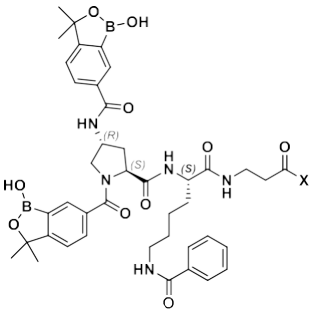
DSL-48

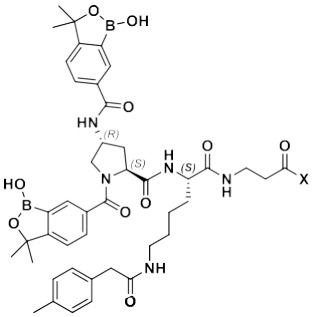

DSL-49

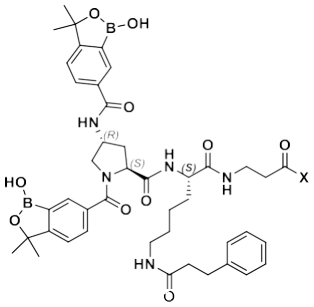

DSL-50

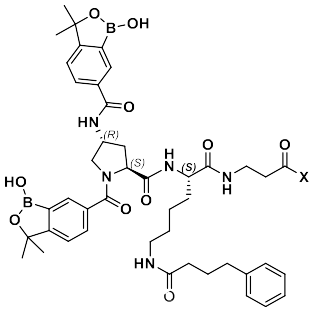

DSL-51

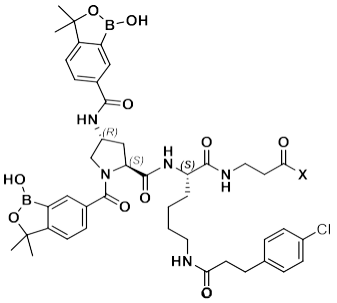

DSL-52

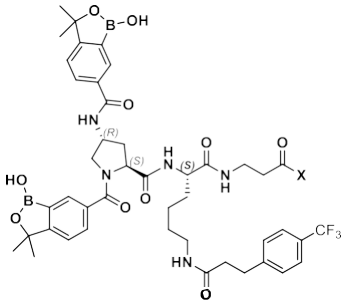

DSL-53

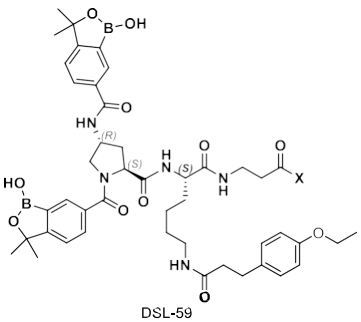

DSL-54

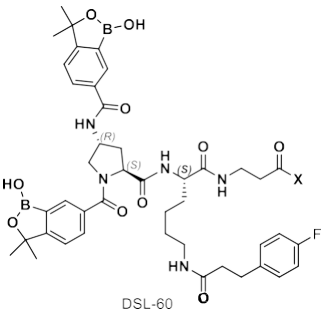

DSL-55

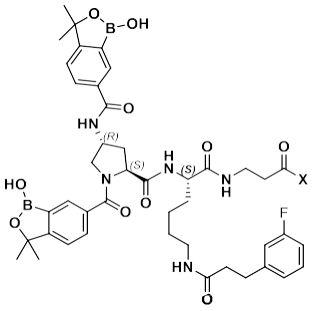

DSL-56


DSL-57

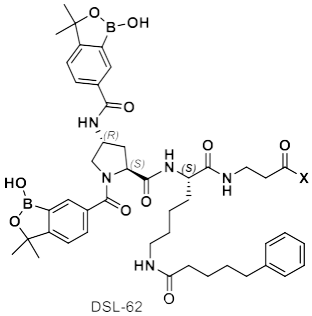

DSL-58


DSL-59

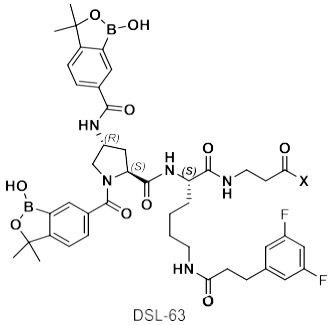

DSL-60



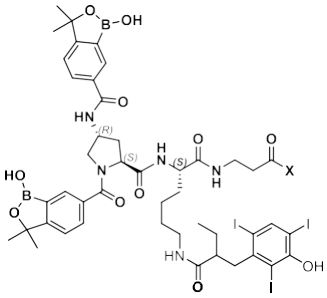
DSL-61



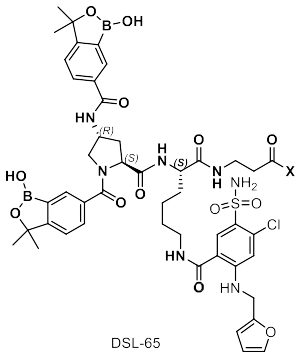
DSL-62



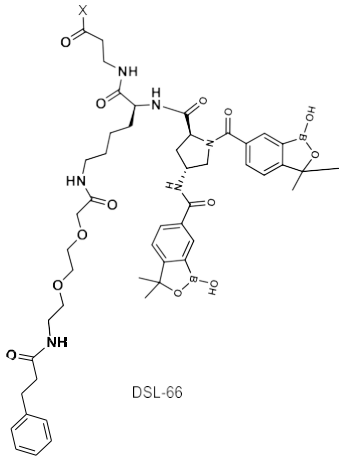
DSL-63



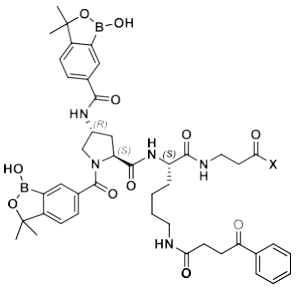
DSL-64



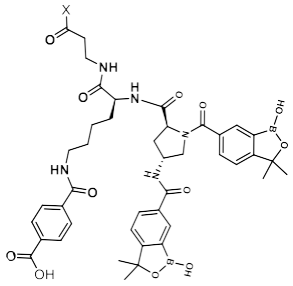
DSL-65



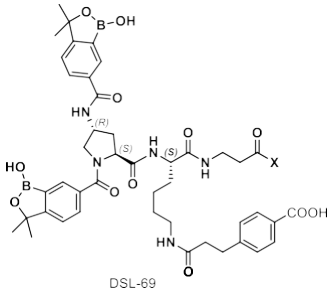
DSL-66



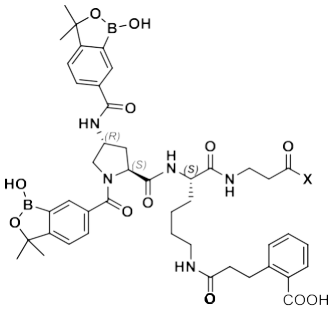
DSL-67



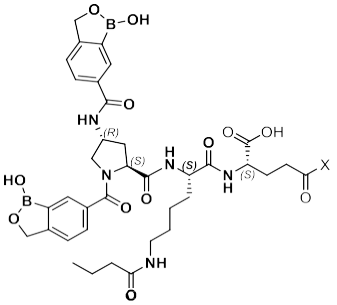
DSL-68



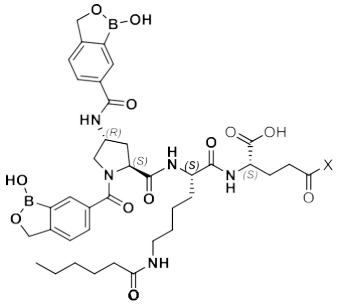
DSL-69



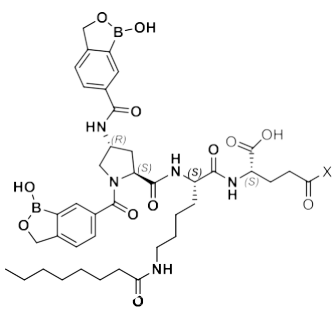
DSL-70



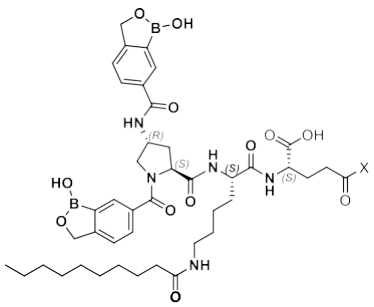
DSL-71



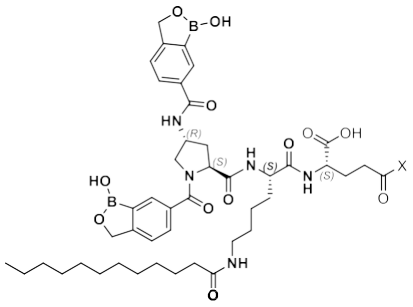
DSL-72



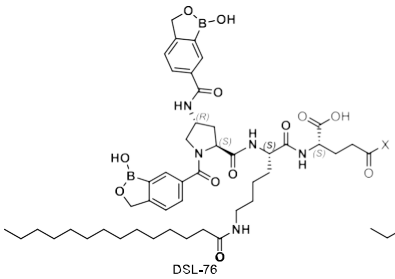
DSL-73



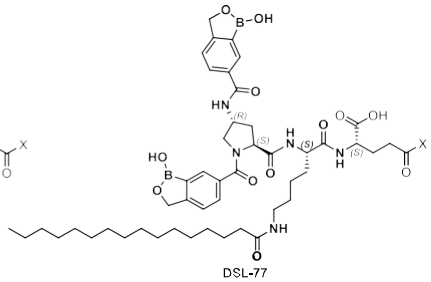
DSL-74



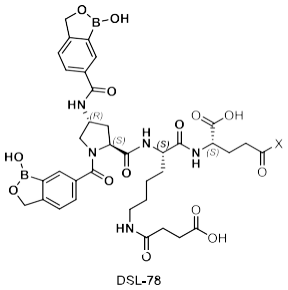
DSL-75



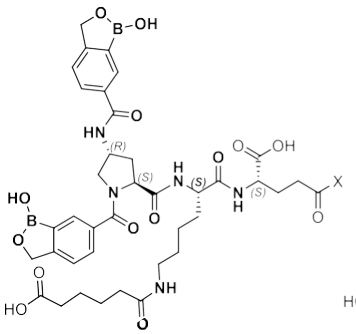
DSL-76



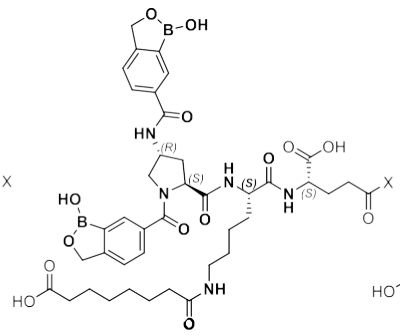
DSL-77



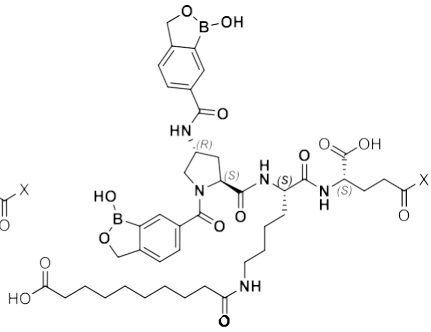
DSL-78



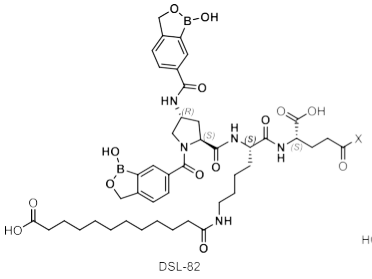
DSL-79



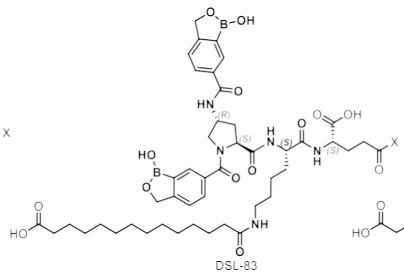
DSL-80



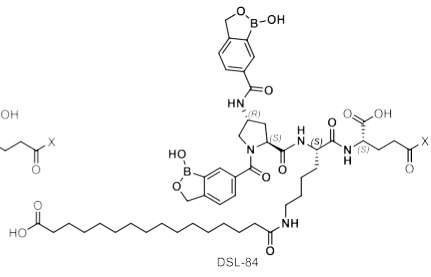
DSL-81



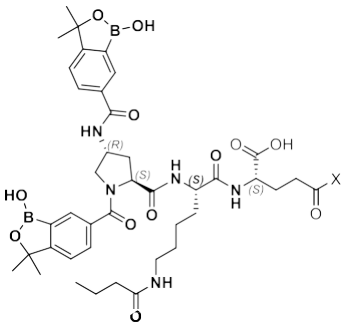
DSL-82



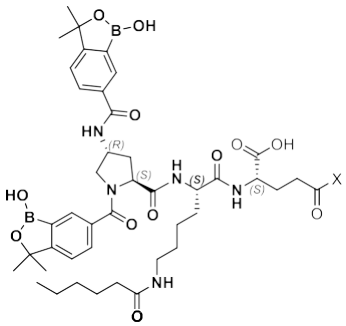
DSL-83



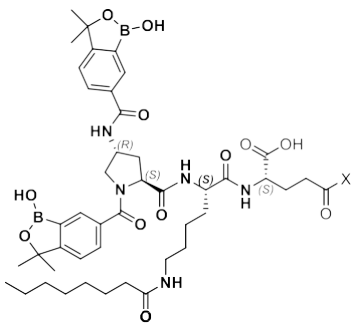
DSL-84



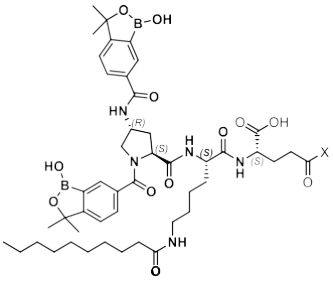
DSL-85



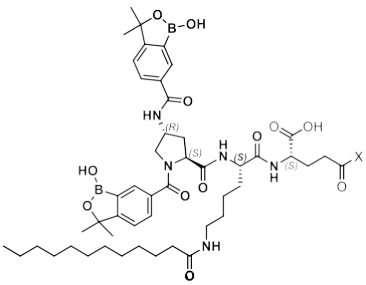
DSL-86



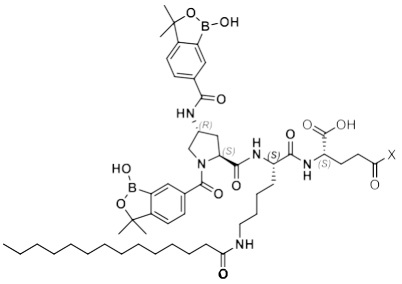
DSL-87



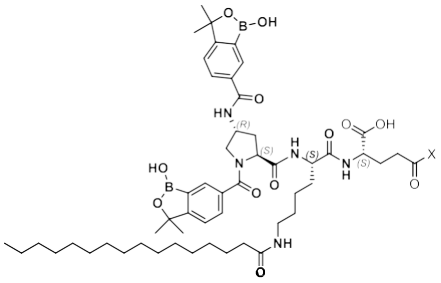
DSL-88



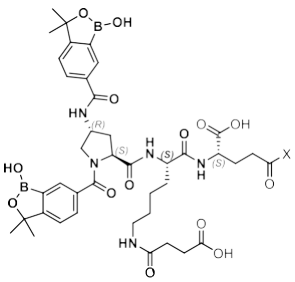
DSL-89



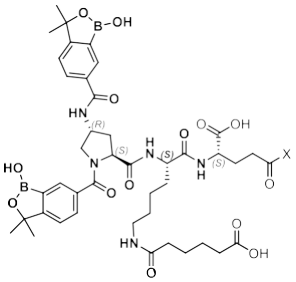
DSL-90



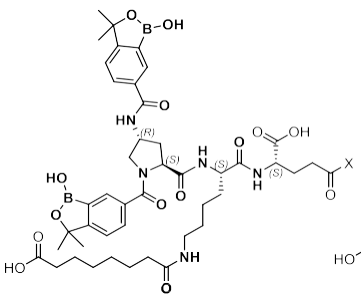
DSL-91



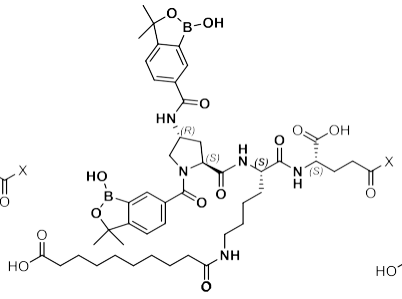
DSL-92



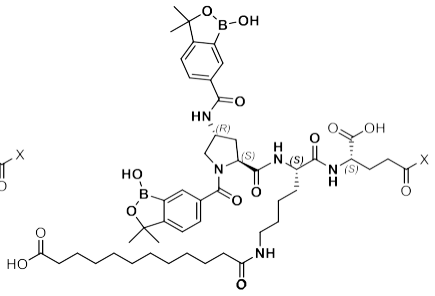
DSL-93



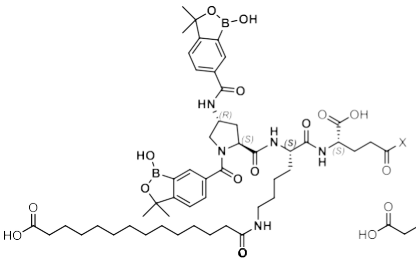
DSL-94



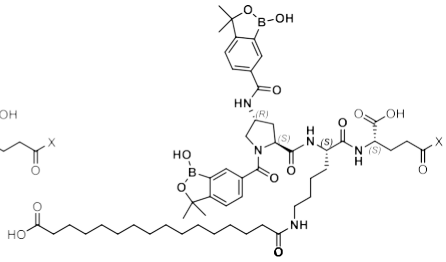
DSL-95



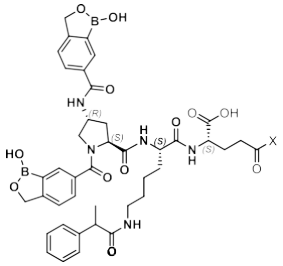
DSL-96



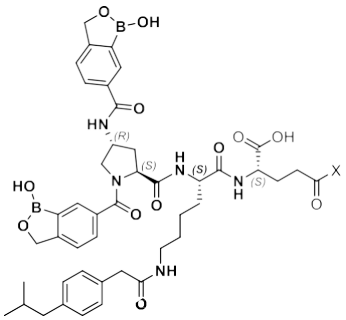
DSL-97



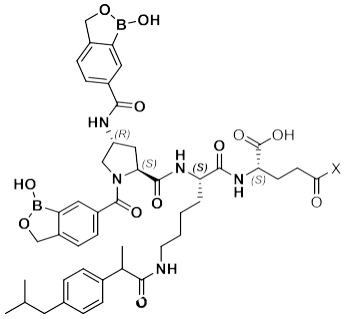
DSL-98



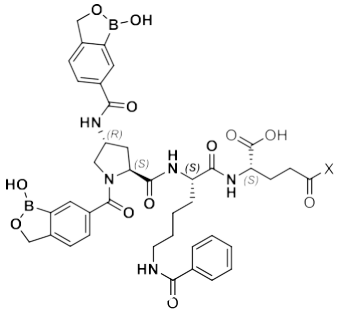
DSL-99



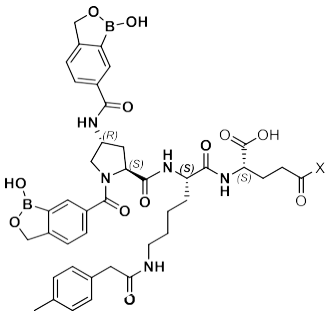
DSL-100



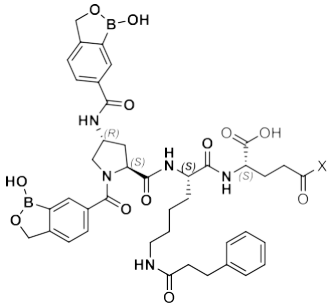
DSL-101



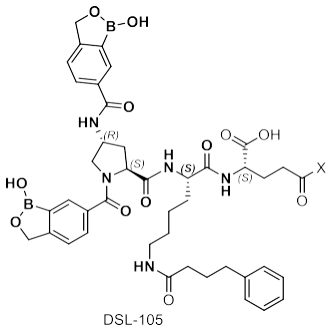
DSL102



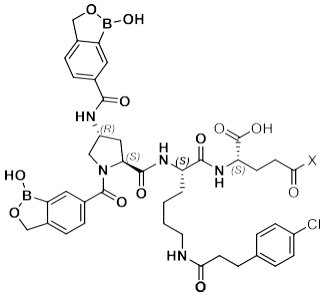
DSL-103



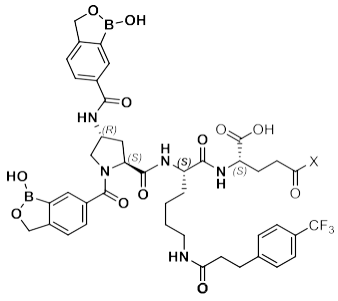
DSL-104



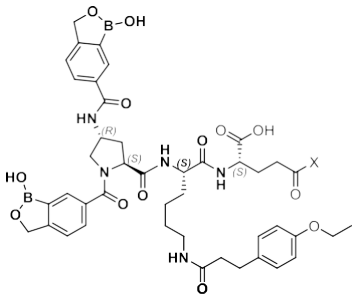
DSL-105



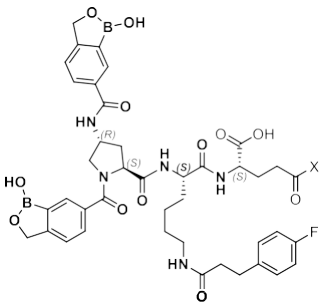
DSL-106



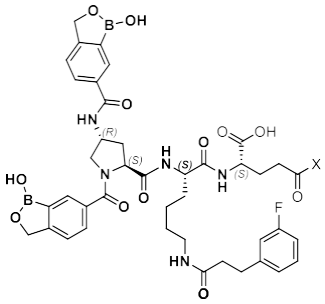
DSL-107



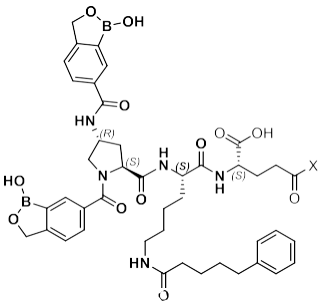
DSL-108



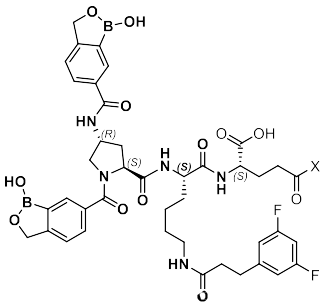
DSL-109



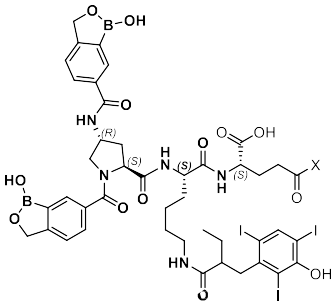
DSL-110



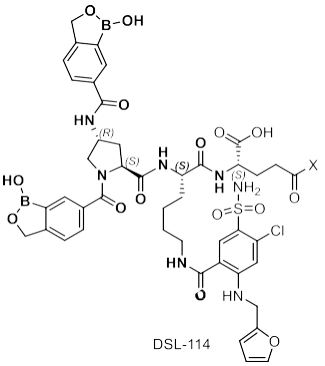
DSL-111



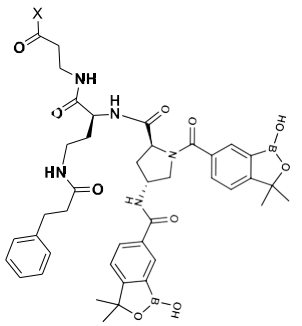
DSL-112



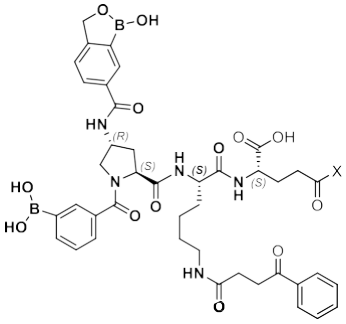
DSL-113



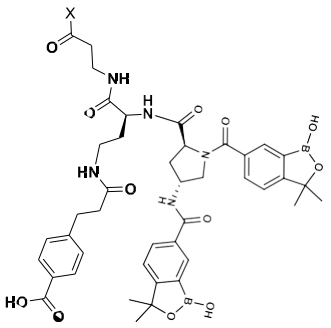
DSL-114



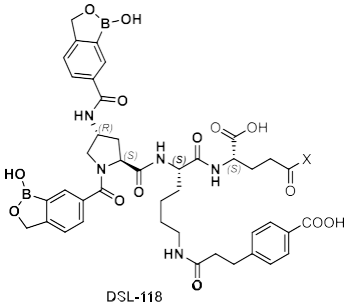
DSL-115



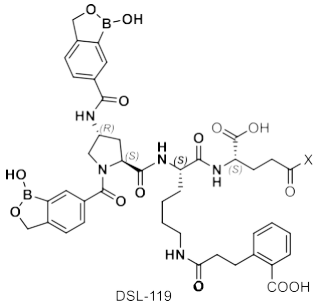
DSL-116



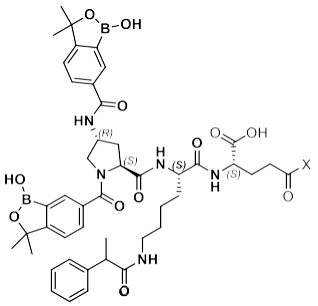
DSL-117



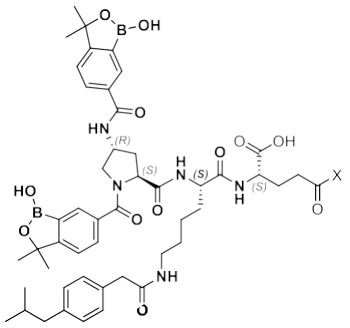
DSL-118



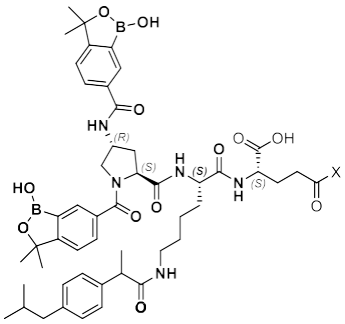
DSL-119



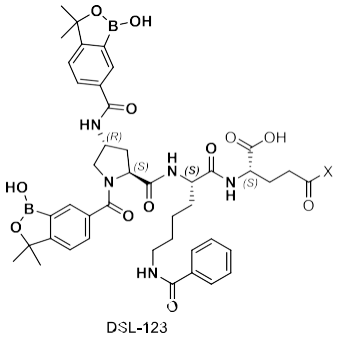
DSL-120



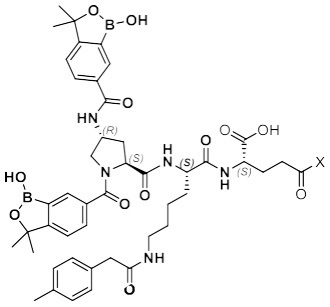
DSL-121



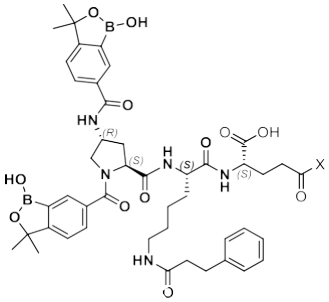
DSL-122



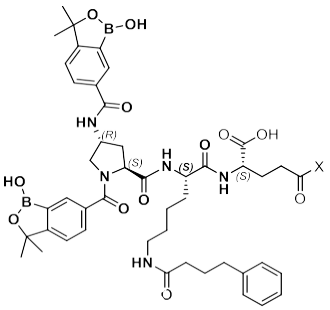
DSL-123



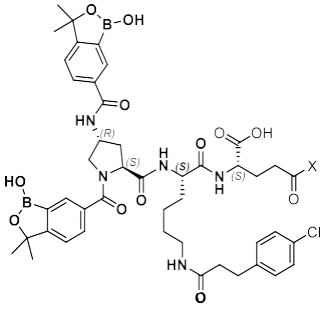
DSL-124



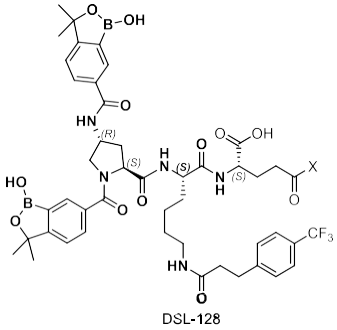
DSL-125



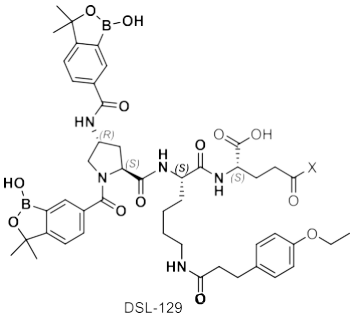
DSL-126



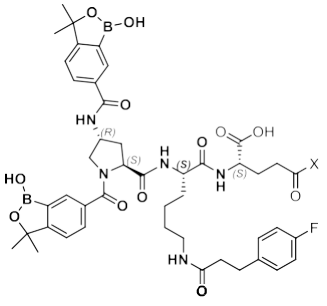
DSL-127



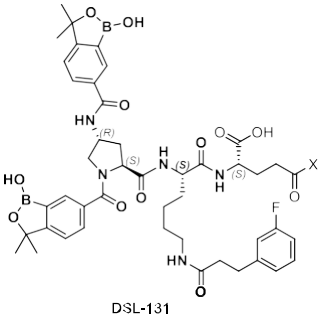
DSL-128



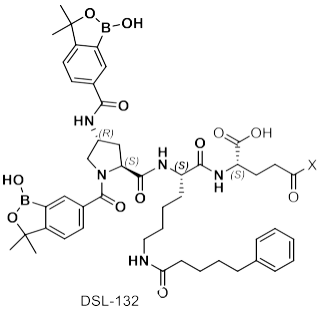
DSL-129



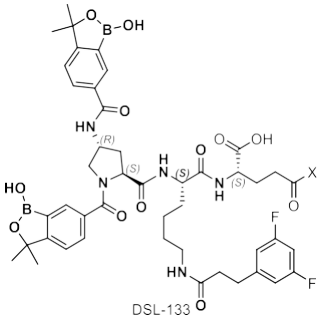
DSL-130



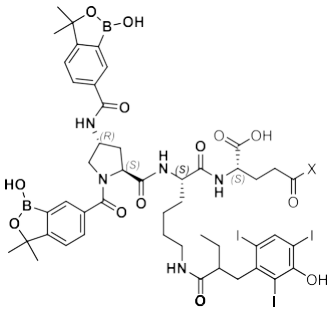
DSL-131



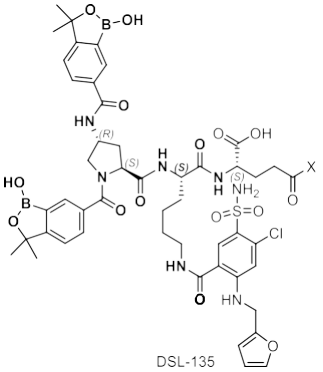
DSL-132



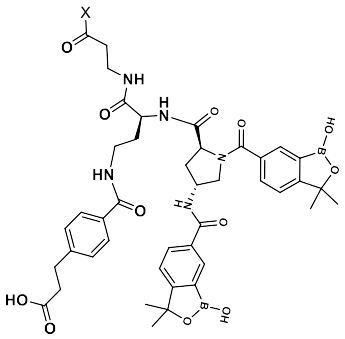
DSL-133



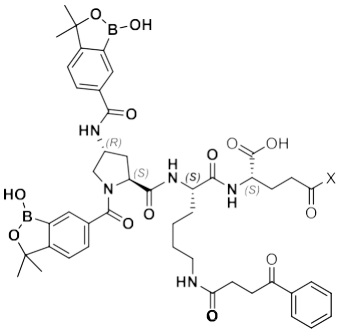
DSL-134



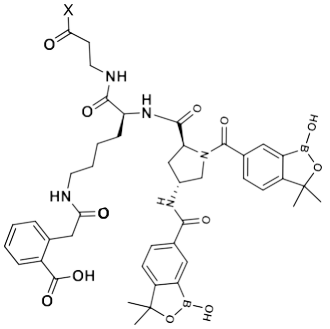
DSL-135



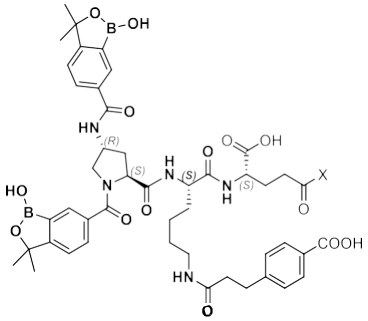
DSL-136



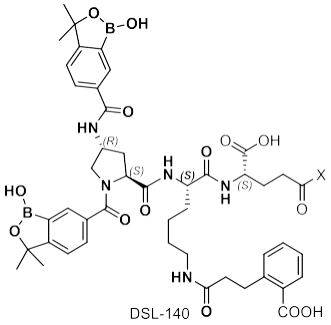
DSL-137



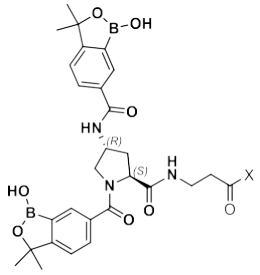
DSL-138



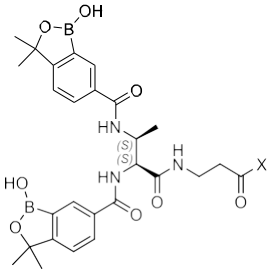
DSL-139



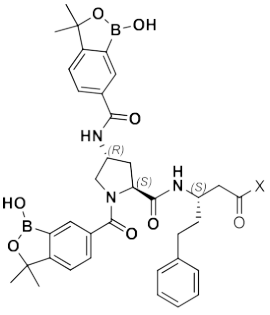
DSL-140



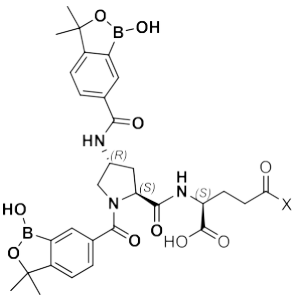
DSL-141



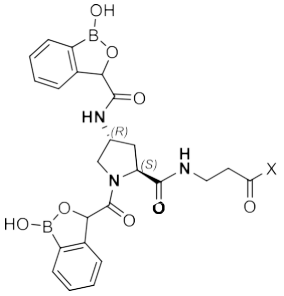
DSL-142



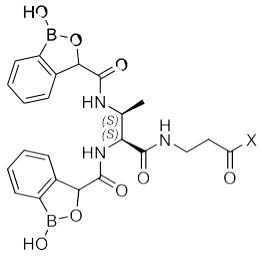
DSL-143



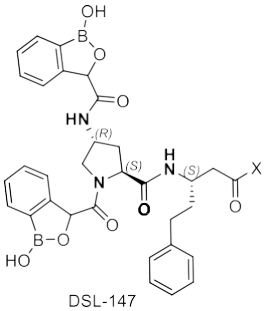
DSL-144



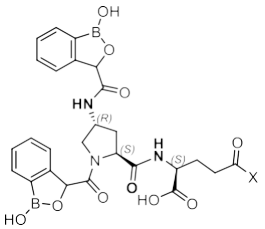
DSL-145



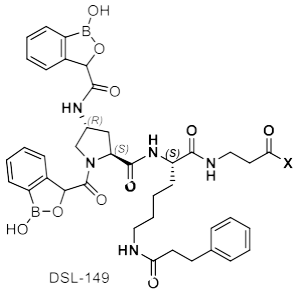
DSL-146



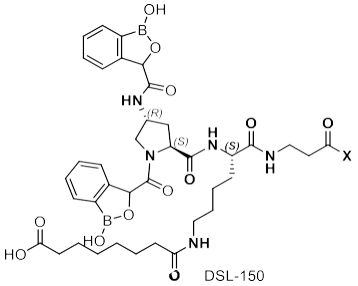
DSL-147



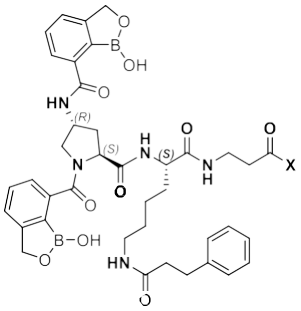
DSL-148



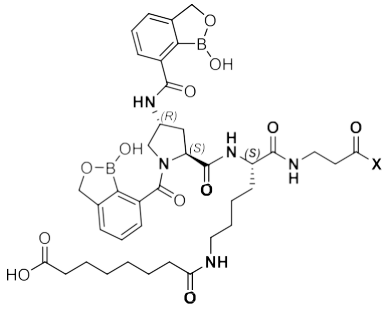
DSL-149



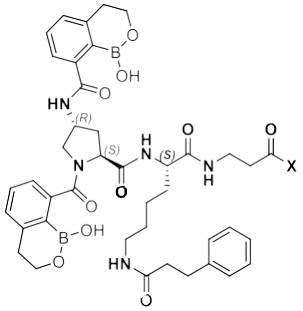
DSL-150



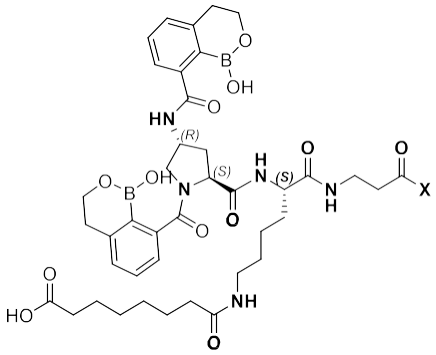
DSL-151



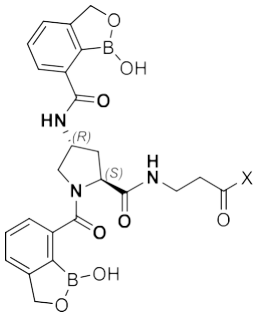
DSL-152



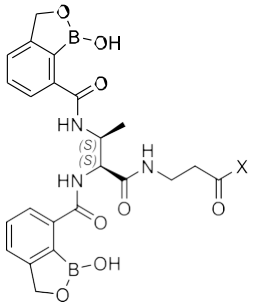
DSL-153



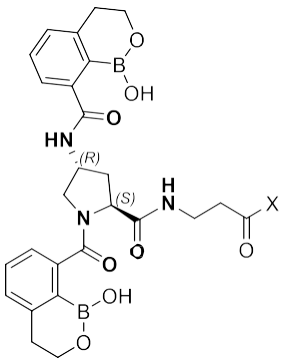
DSL-154



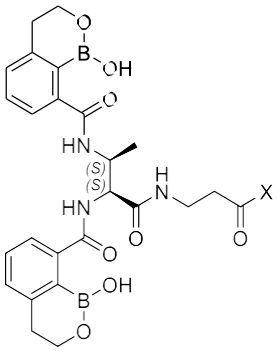
DSL-155



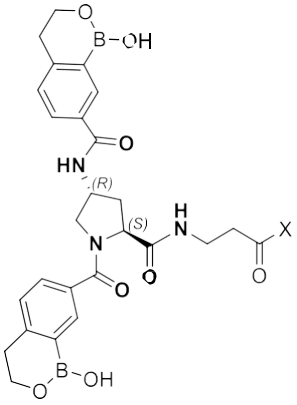
DSL-156



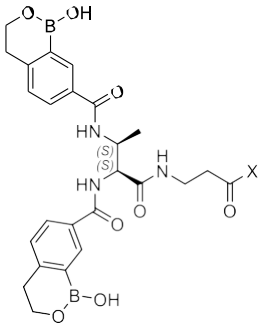
DSL-157



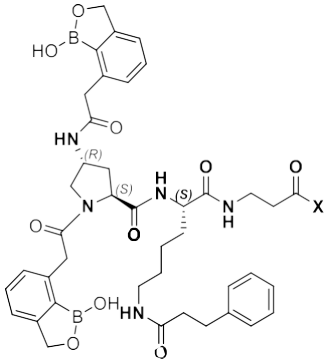
DSL-158



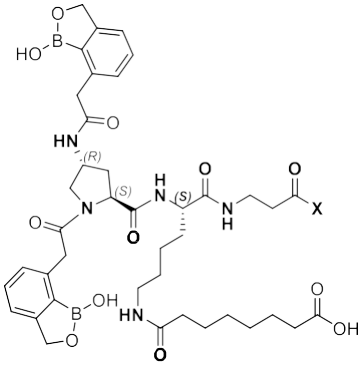
DSL-159



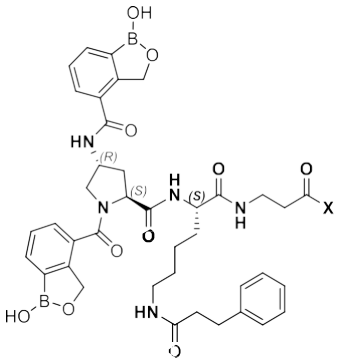
DSL-160



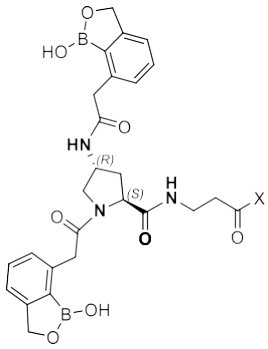
DSL-161



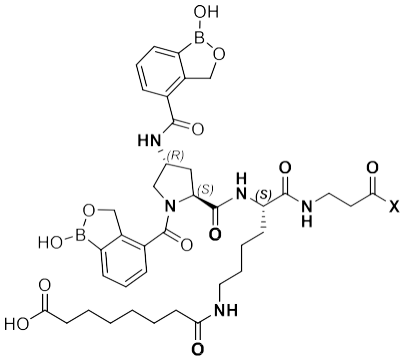
DSL-162



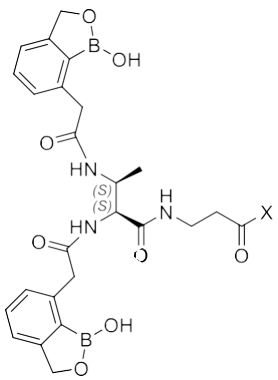
DSL-163



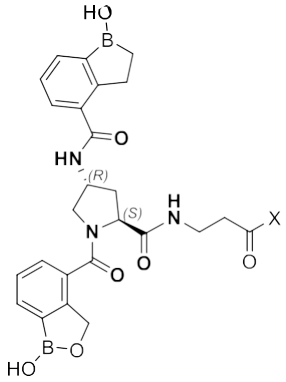
DSL-164



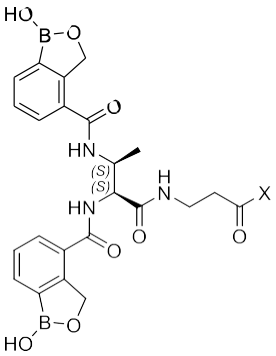
DSL-165



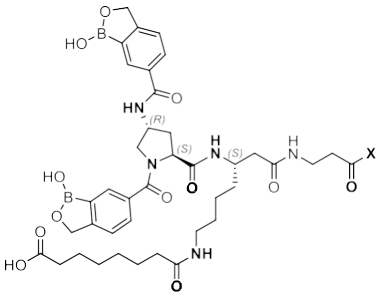
DSL-166



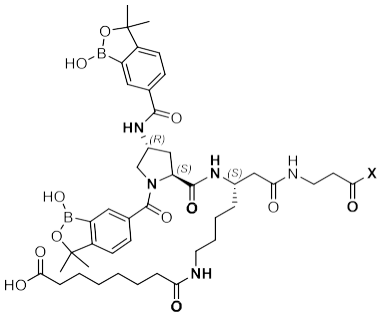
DSL-167



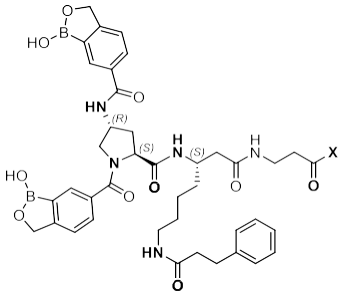
DSL-168



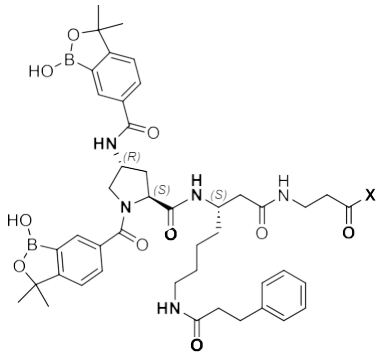
DSL-169



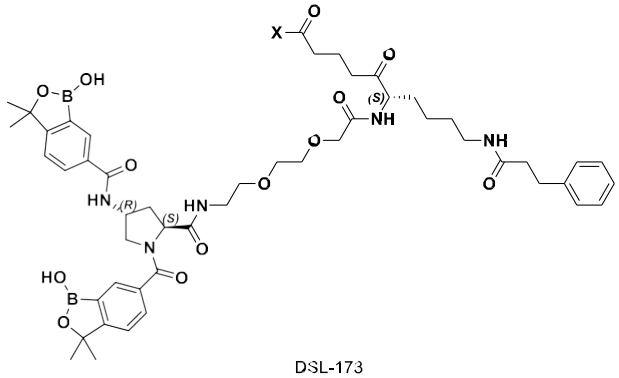
DSL-170



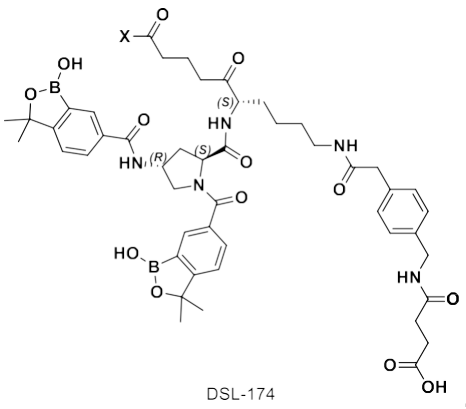
DSL-171



DSL-172 ,

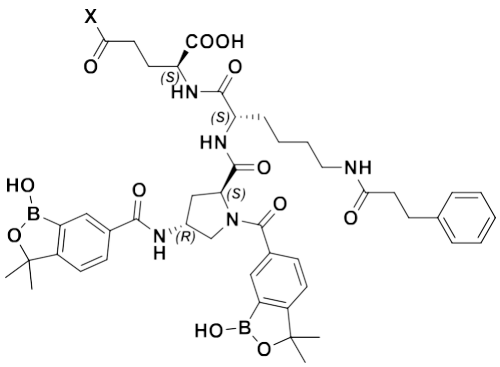


DSL-173 ,



DSL-174

, y



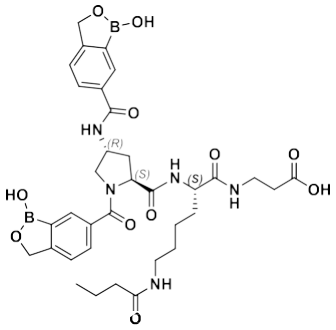
DSL-175

, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, una sal farmacéuticamente aceptable de este, y combinaciones de estos;

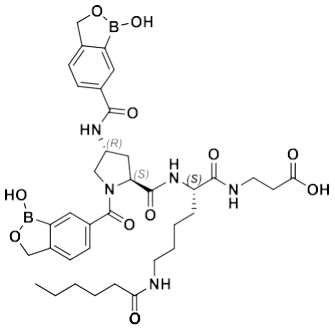
en donde X es un grupo saliente.

42. El compuesto de la reivindicación 41, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde X se selecciona de N-oxisuccinimida, 2,3,5,6-tetrafluorofenoxi (TFP), pentafluorofenoxi (Pfp), OH, halógeno, maleimida alquil amino, maleimida amido polietilenglicol amino, y maleimida polietilenglicol amino.

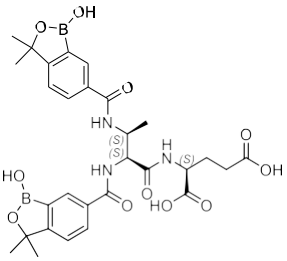
43. El compuesto de la reivindicación 42, en donde el compuesto se selecciona de:



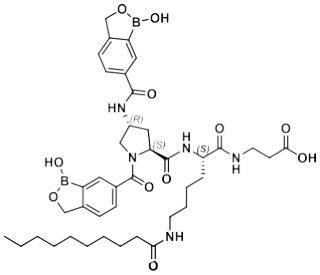
DSL-1A



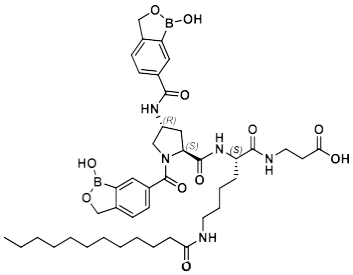
DSL-2A



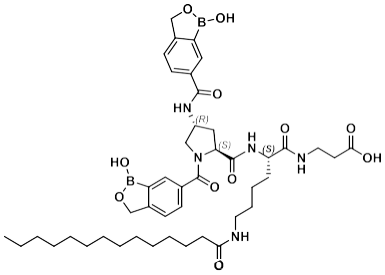
DSL-3A



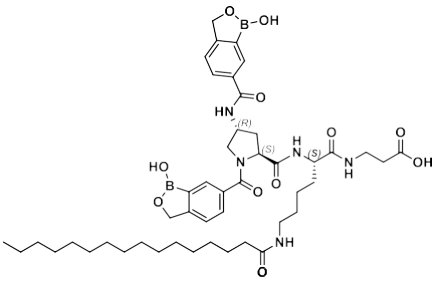
DSL-4A



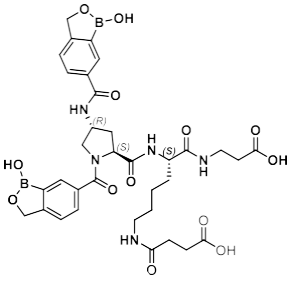
DSL-5A



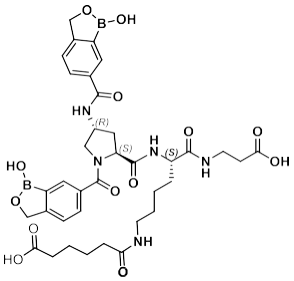
DSL-6A



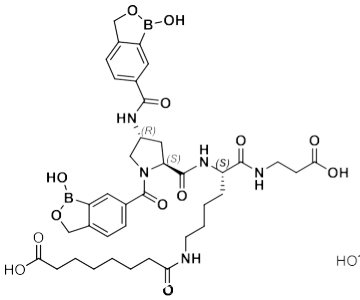
DSL-7A



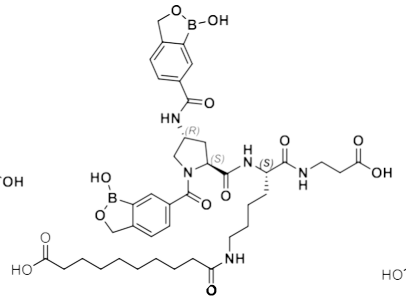
DSL-8A



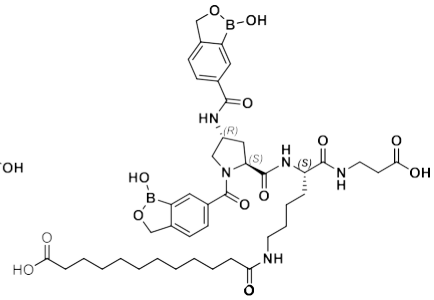
DSL-9A



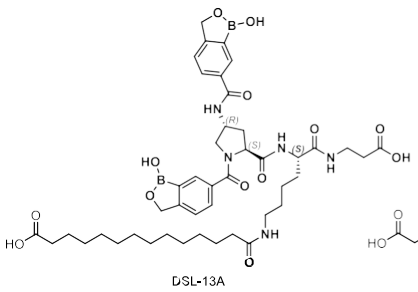
DSL-10A



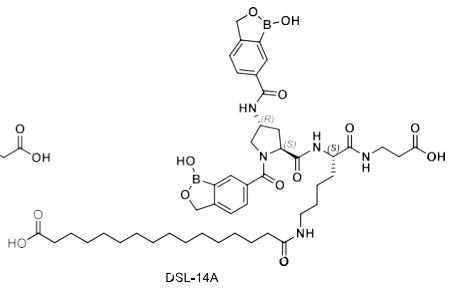
DSL-11A



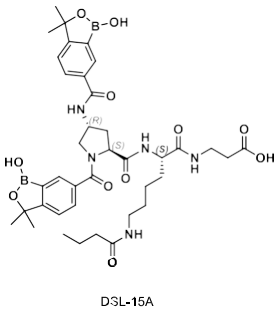
DSL-12A



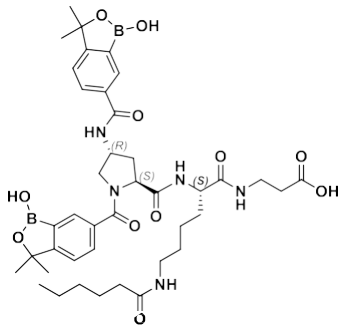
DSL-13A



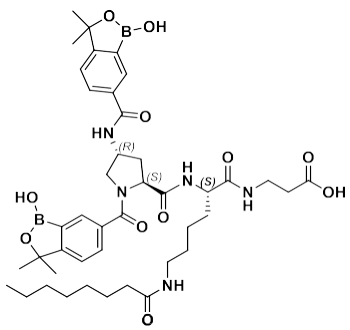
DSL-14A



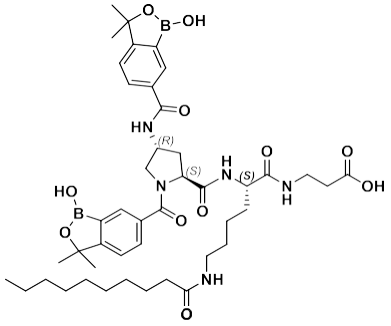
DSL-15A



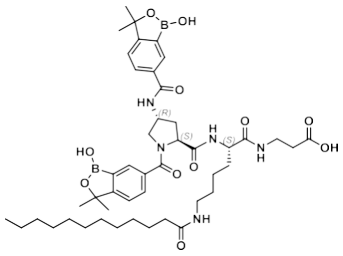
DSL-16A



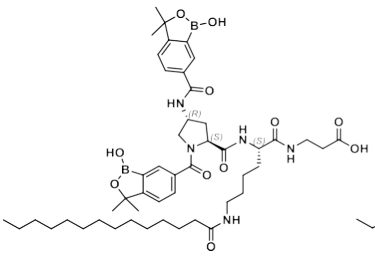
DSL-17A



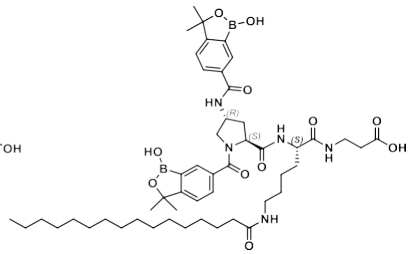
DSL-18A



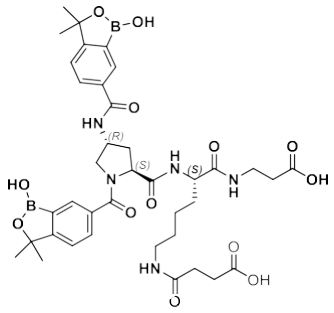
DSL-19A



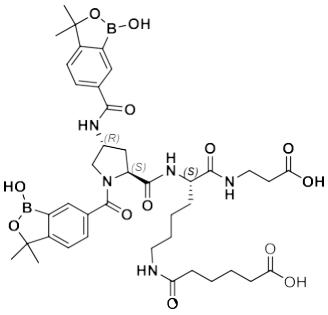
DSL-20A



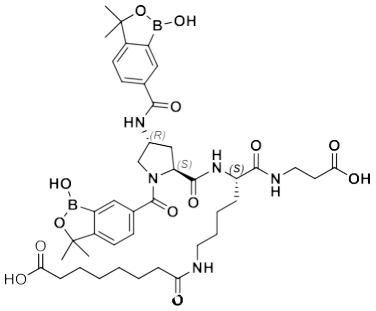
DSL-21A



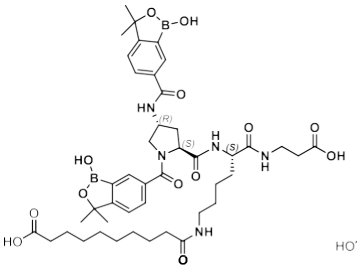
DSL-22A



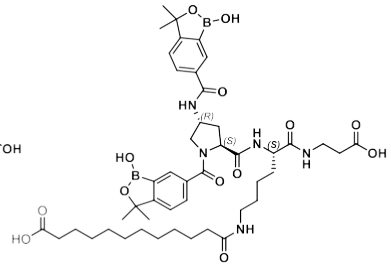
DSL-23A



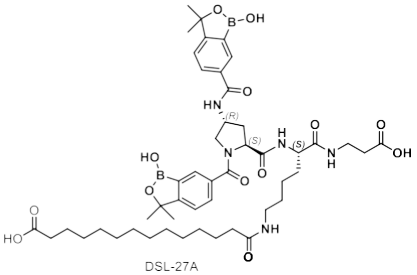
DSL-24A



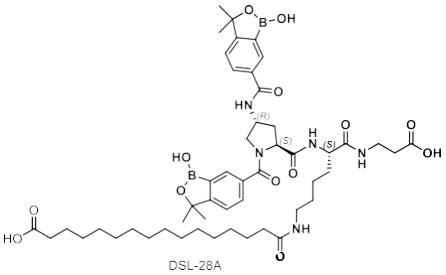
DSL-25A



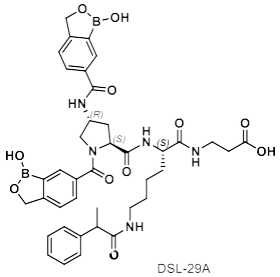
DSL-26A



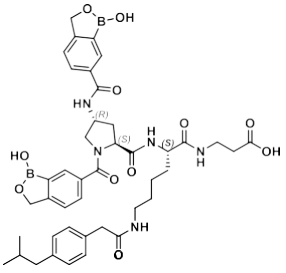
DSL-27A



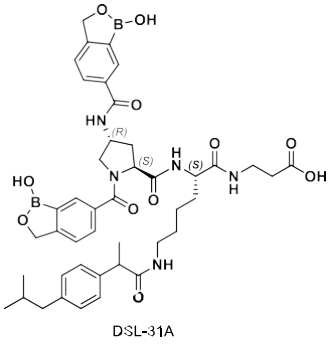
DSL-28A



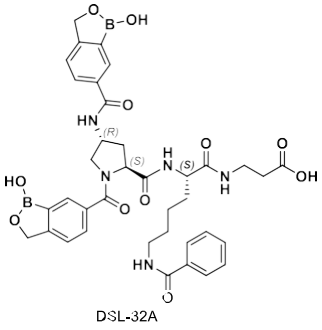
DSL-29A



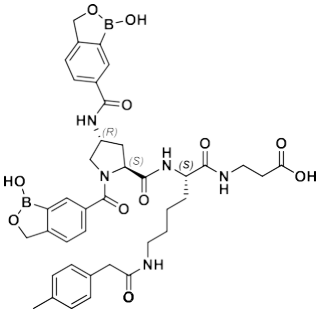
DSL-30A



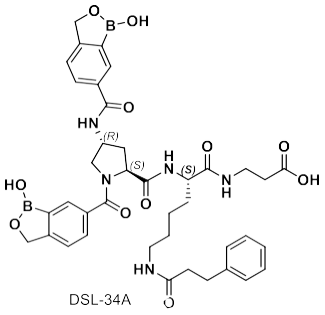
DSL-31A



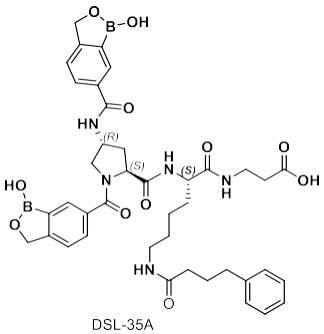
DSL-32A



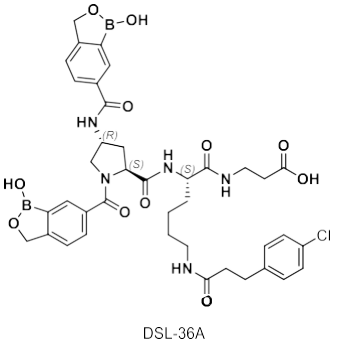
DSL-33A



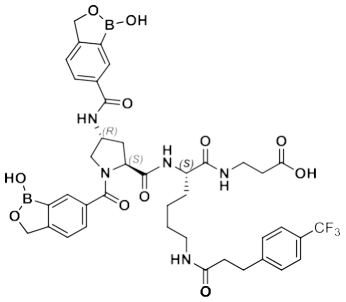
DSL-34A



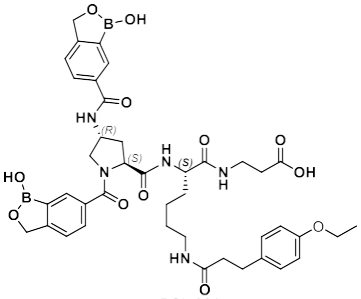
DSL-35A



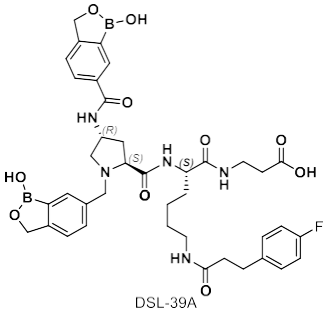
DSL-36A



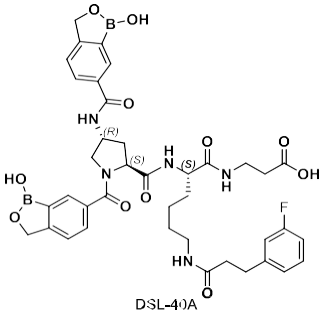
DSL-37A



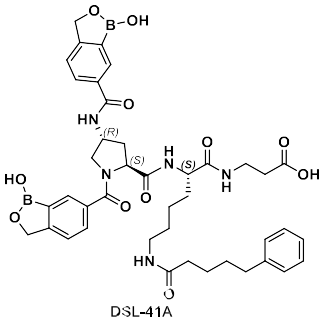
DSL-38A



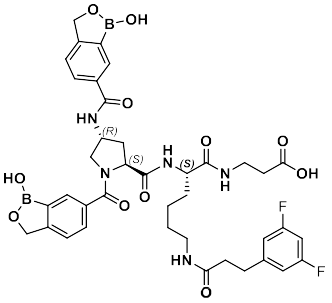
DSL-39A



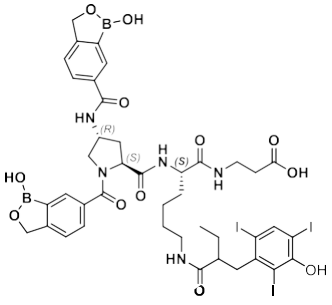
DSL-40A



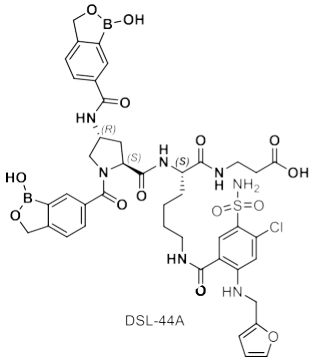
DSL-41A



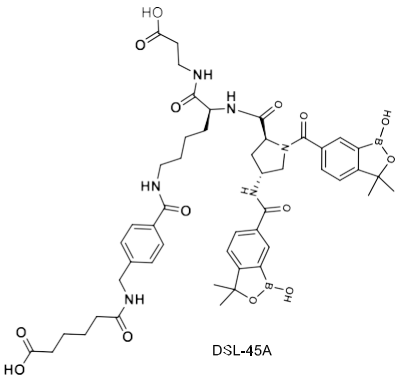
DSL-42A



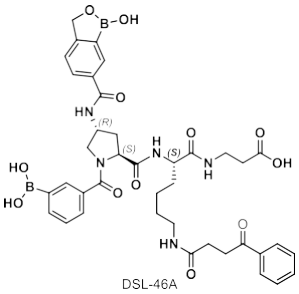
DSL-43A



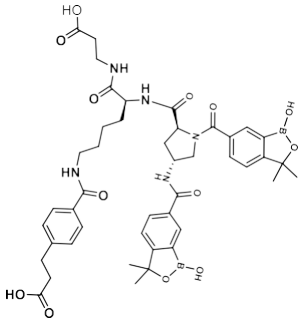
DSL-44A



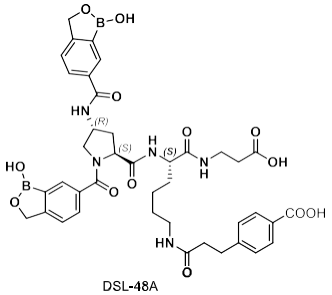
DSL-45A



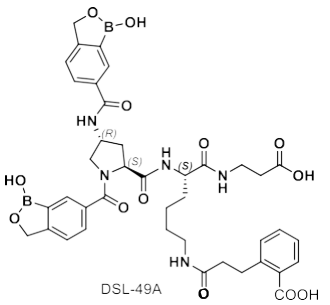
DSL-46A



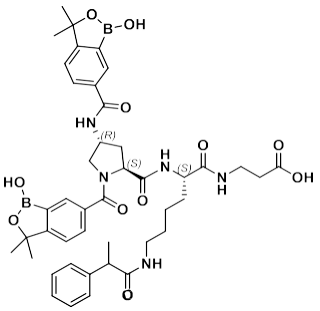
DSL-47A



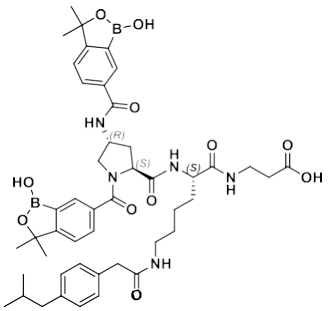
DSL-48A



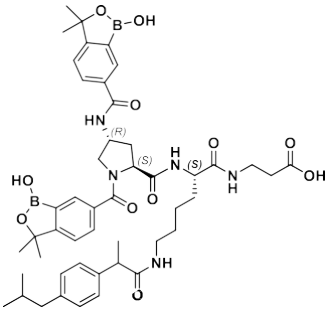
DSL-49A



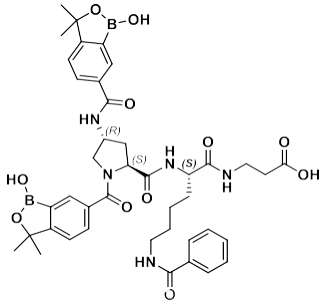
DSL-50A



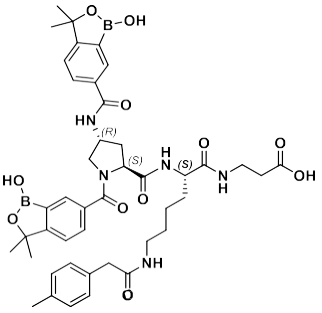
DSL-51A



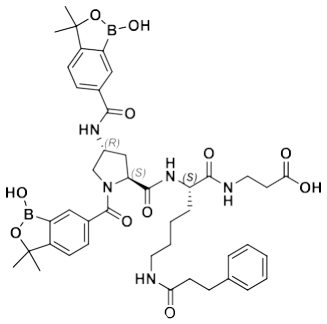
DSL-52A



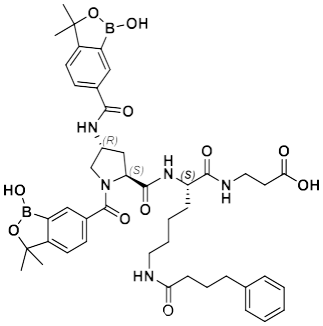
DSL-53A



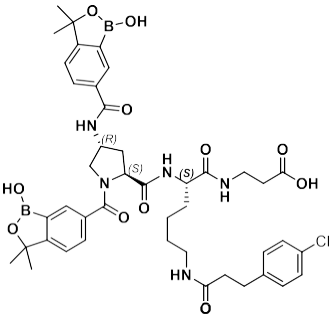
DSL-54A



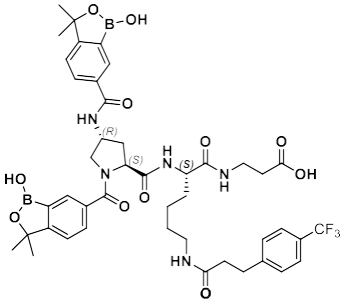
DSL-55A



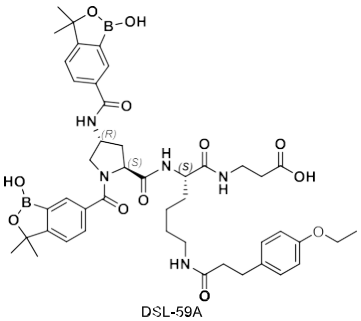
DSL-56A



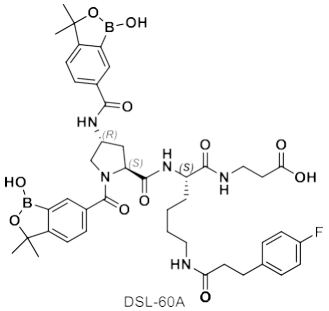
DSL-57A



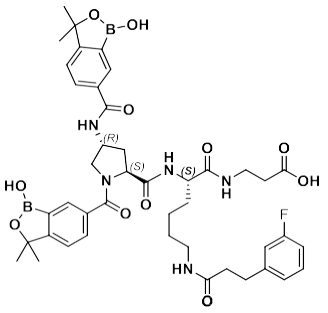
DSL-58A



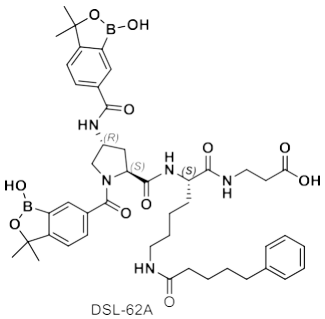
DSL-59A



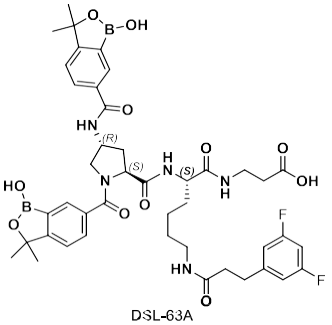
DSL-60A



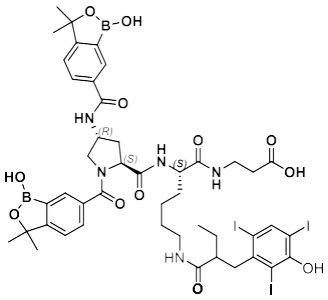
DSL-61A



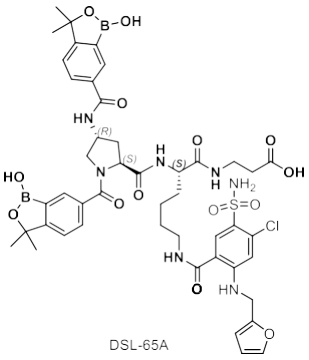
DSL-62A



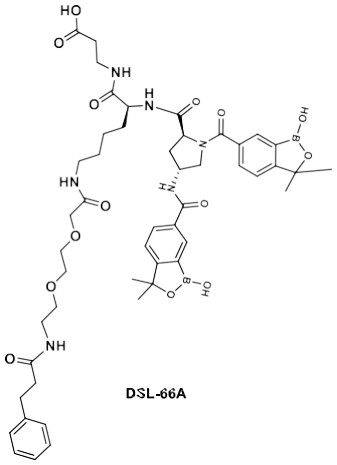
DSL-63A



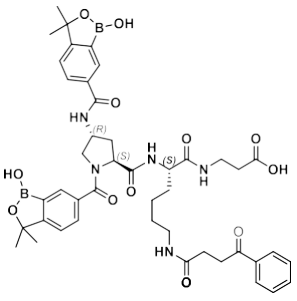
DSL-64A



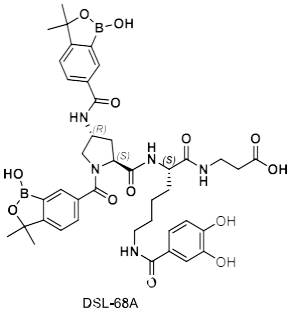
DSL-65A



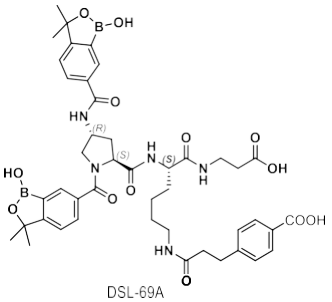
DSL-66A



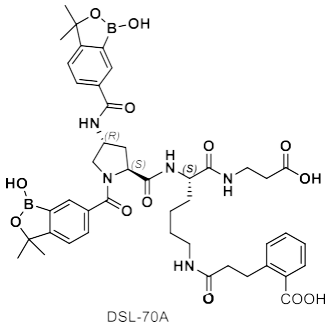
DSL-67A



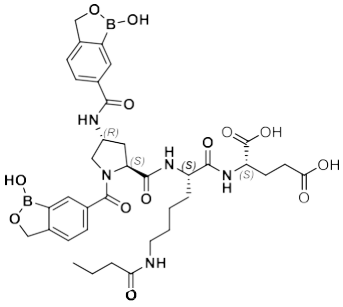
DSL-68A



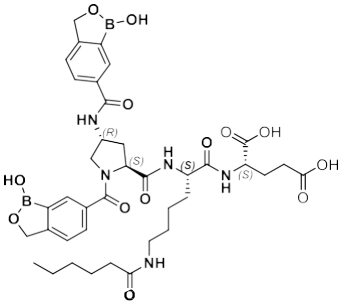
DSL-69A



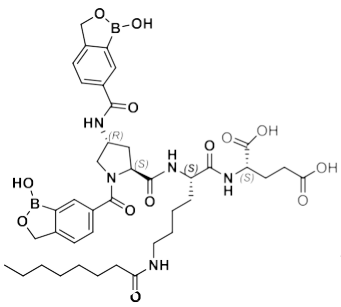
DSL-70A



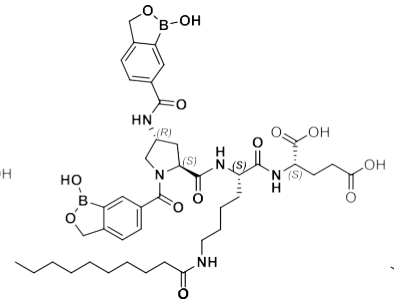
DSL-71A



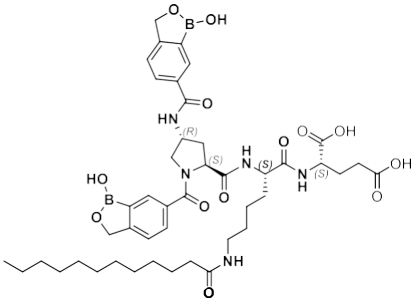
DSL-72A



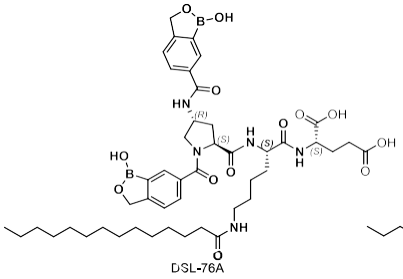
DSL-73A



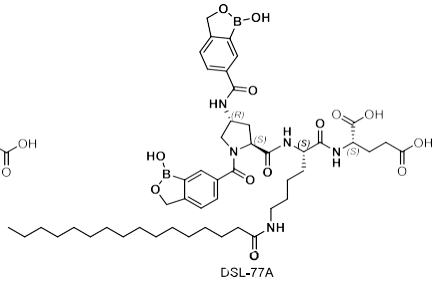
DSL-74A



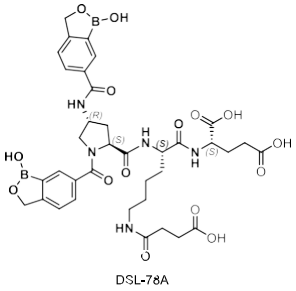
DSL-75A



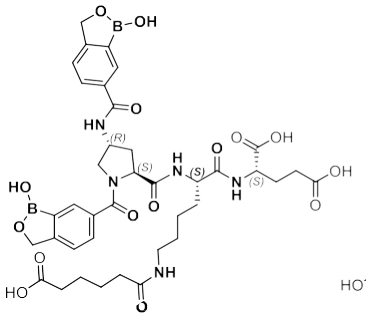
DSL-76A



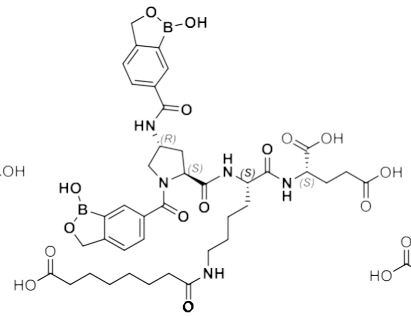
DSL-77A



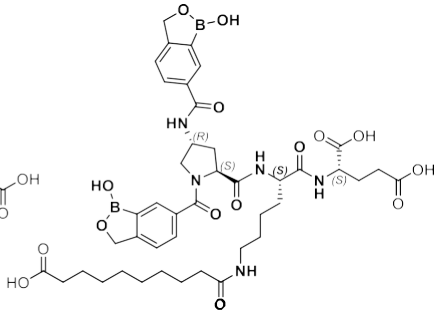
DSL-78A



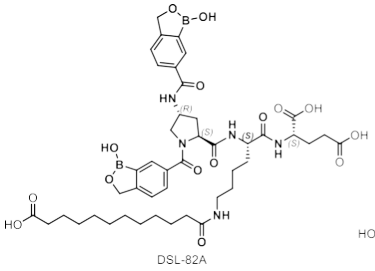
DSL-79A



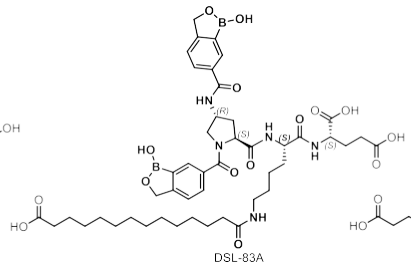
DSL-80A



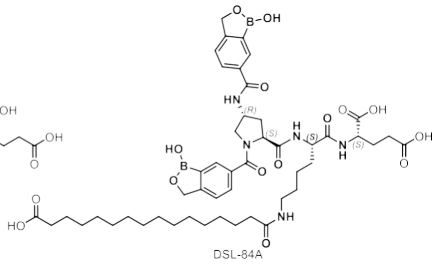
DSL-81A



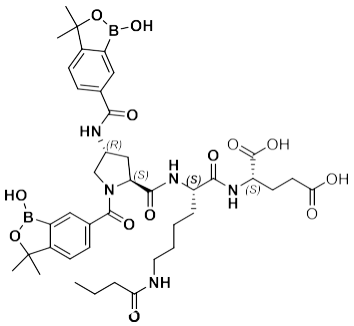
DSL-82A



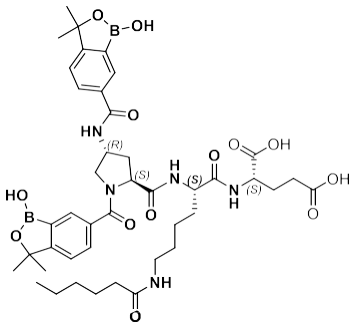
DSL-83A



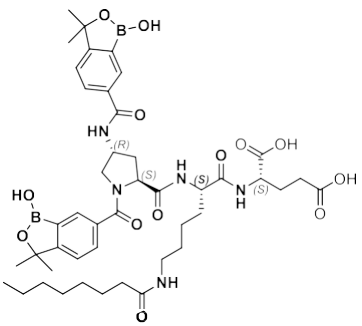
DSL-84A



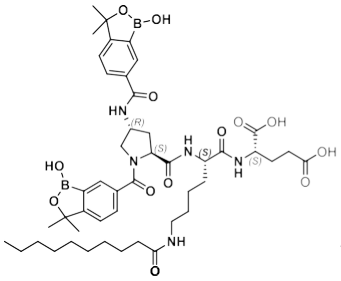
DSL-85A



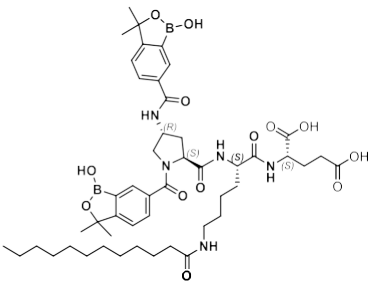
DSL-86A



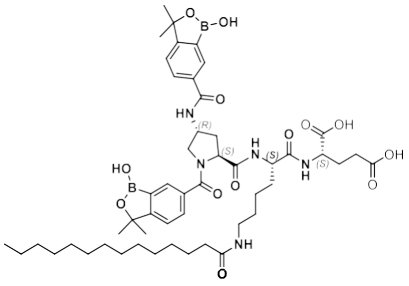
DSL-87A



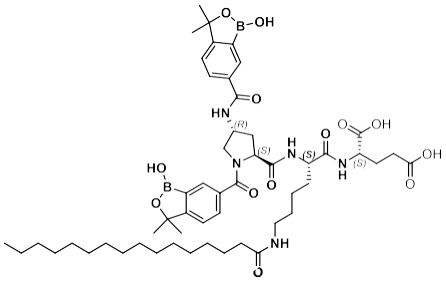
DSL-88A



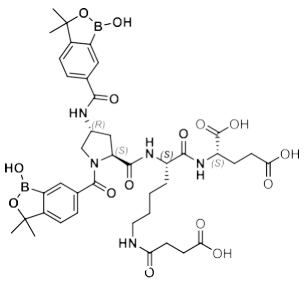
DSL-89A



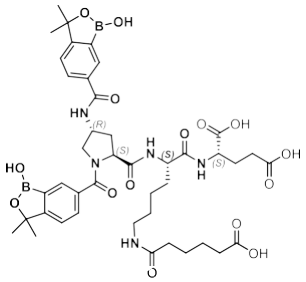
DSL-90A



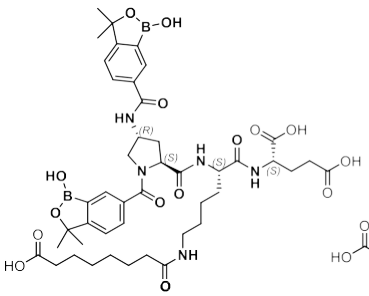
DSL-91A



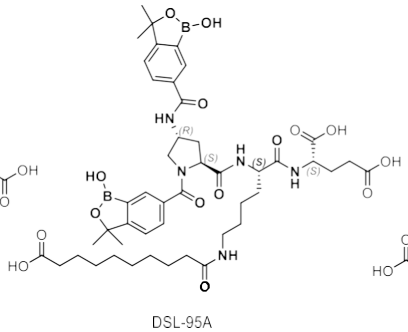
DSL-92A



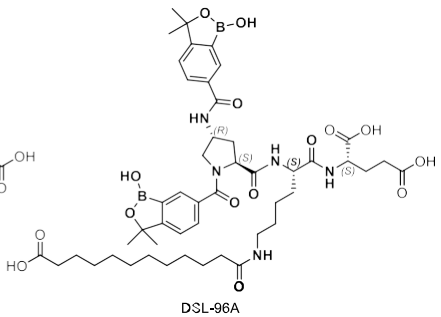
DSL-93A



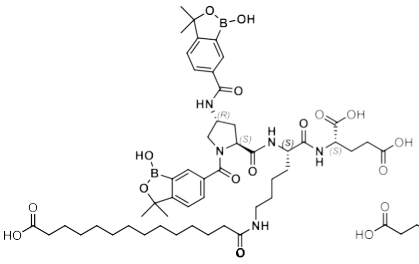
DSL-94A



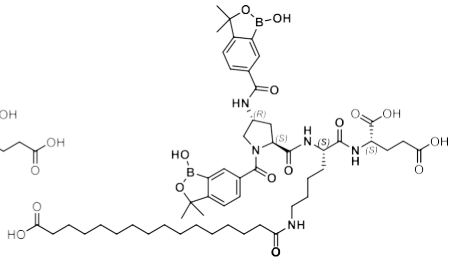
DSL-95A



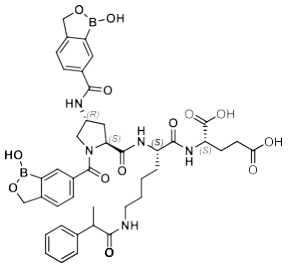
DSL-96A



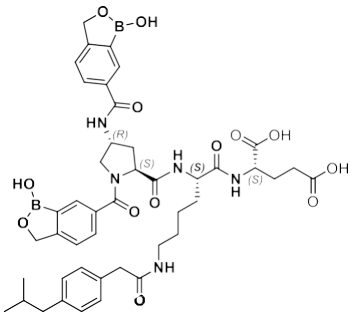
DSL-97A



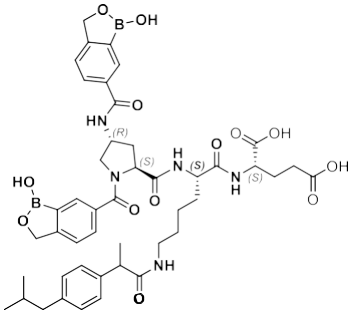
DSL-98A



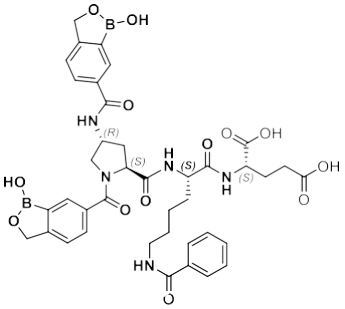
DSL-99A



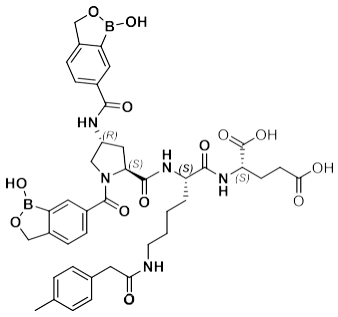
DSL-100A



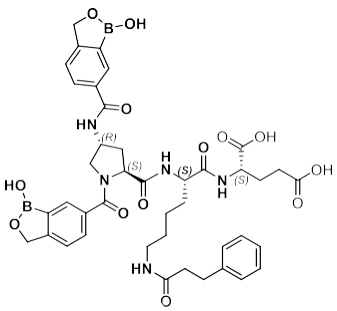
DSL-101A



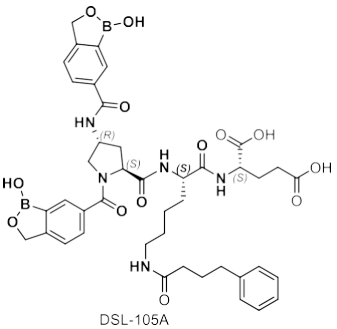
DSL102A



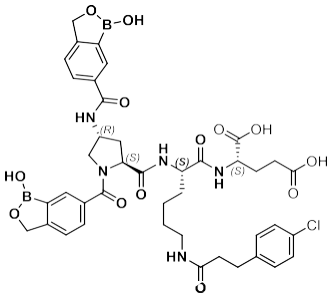
DSL-103A



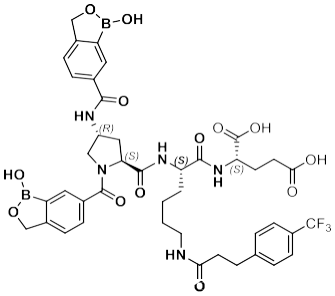
DSL-104A



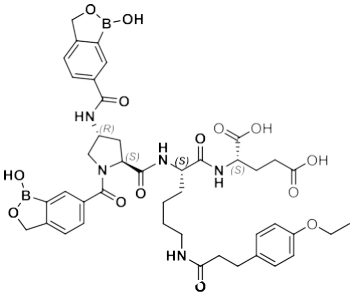
DSL-105A



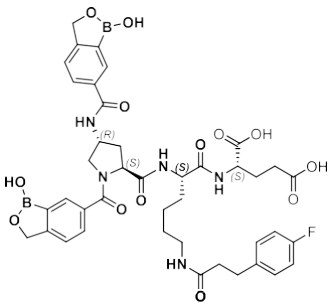
DSL-106A



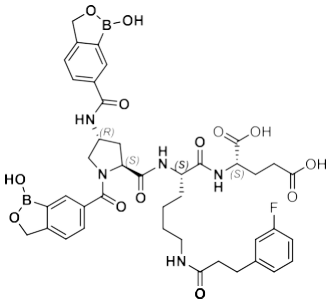
DSL-107A



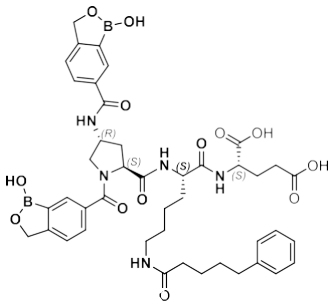
DSL-108A



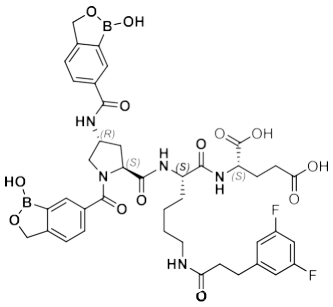
DSL-109A



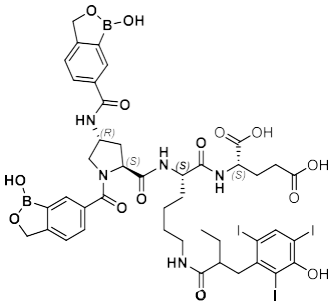
DSL-110A



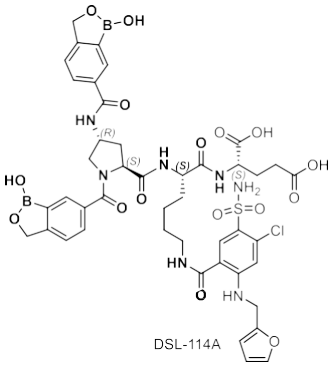
DSL-111A



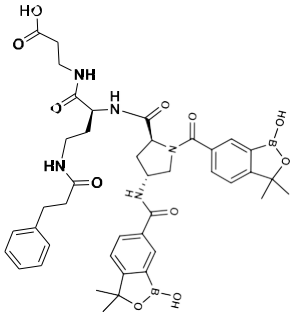
DSL-112A



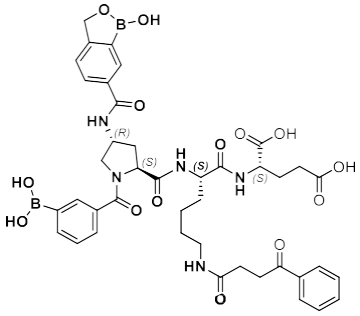
DSL-113A



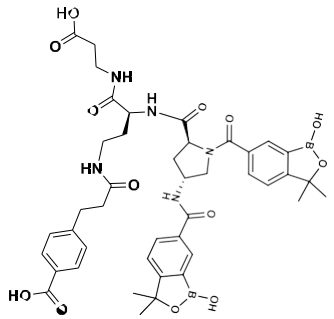
DSL-114A



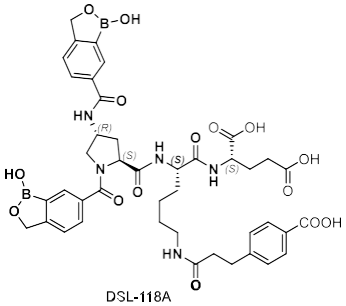
DSL-115A



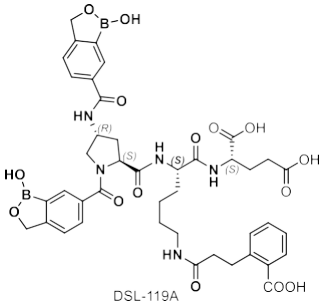
DSL-116A



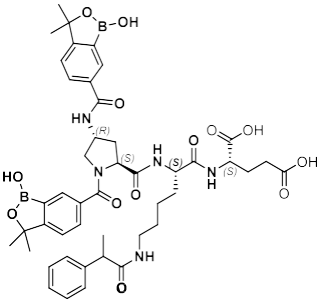
DSL-117A



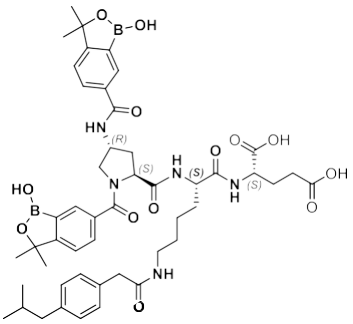
DSL-118A



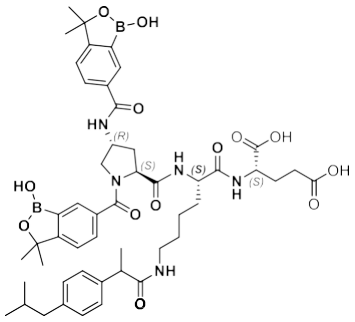
DSL-119A



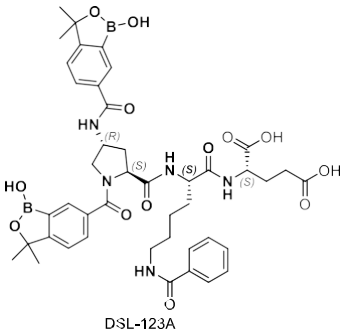
DSL-120A



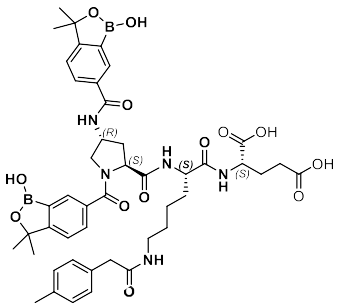
DSL-121A



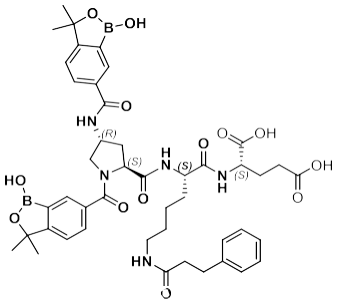
DSL-122A



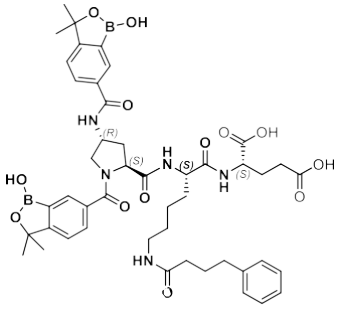
DSL-123A



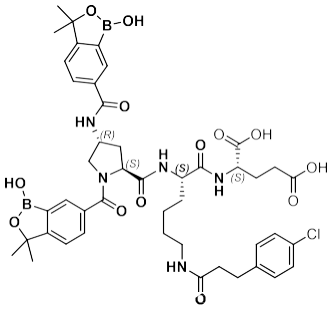
DSL-124A



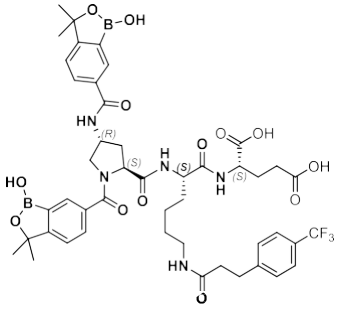
DSL-125A



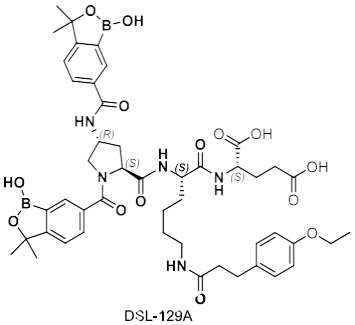
DSL-126A



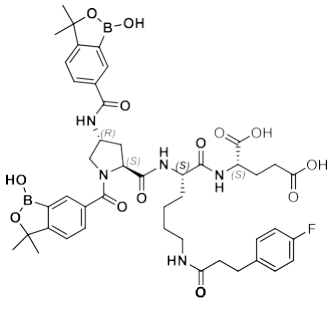
DSL-127A



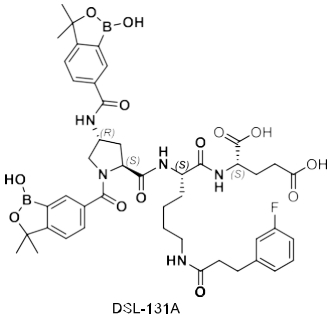
DSL-128A



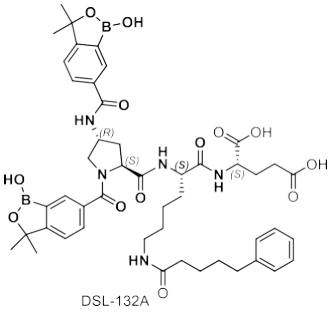
DSL-129A



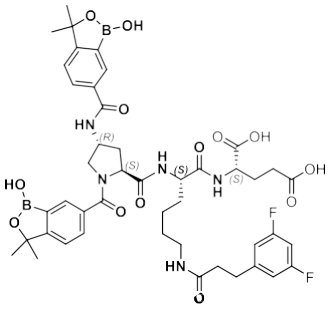
DSL-130A



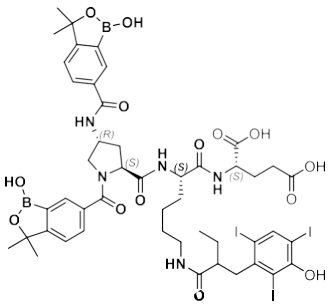
DSL-131A



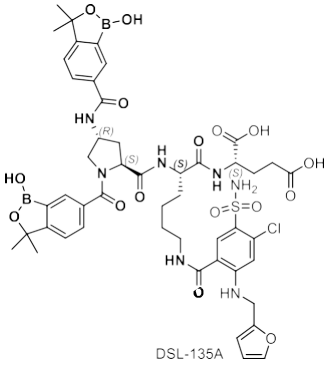
DSL-132A



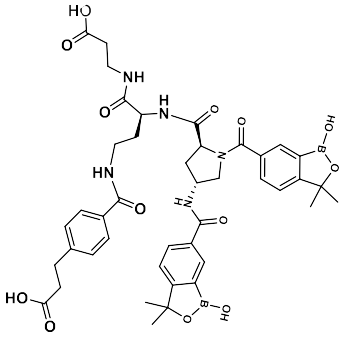
DSL-133A



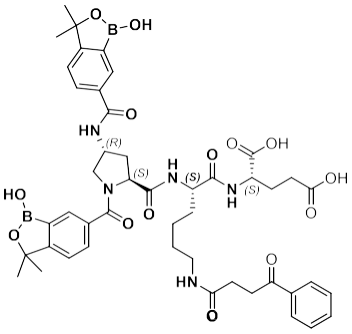
DSL-134A



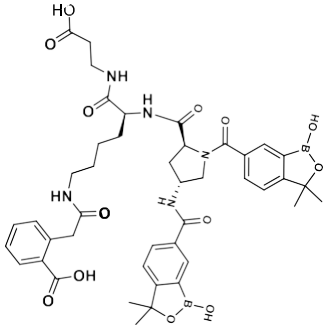
DSL-135A



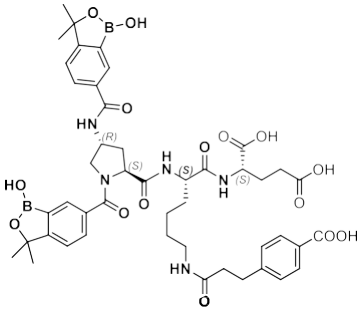
DSL-136A



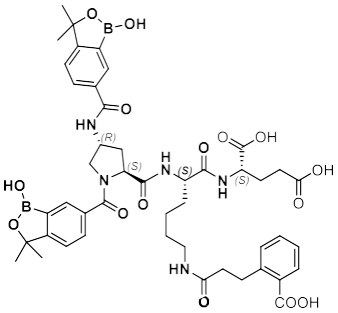
DSL-137A



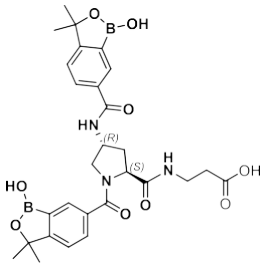
DSL-138A



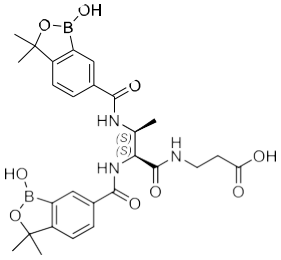
DSL-139A



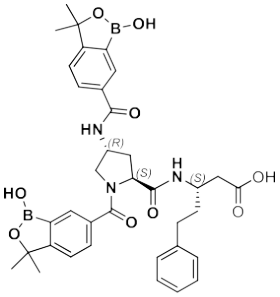
DSL-140A



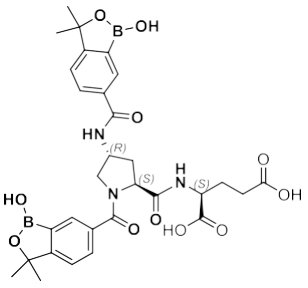
DSL-141A



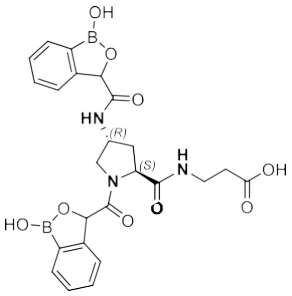
DSL-142A



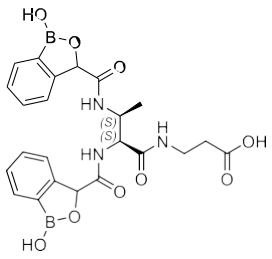
DSL-143A



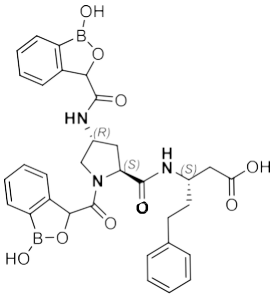
DSL-144A



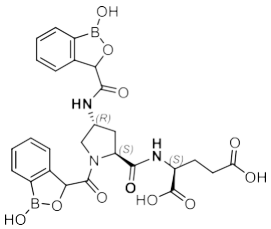
DSL-145A



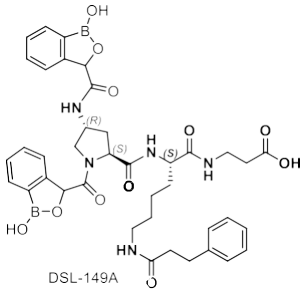
DSL-146A



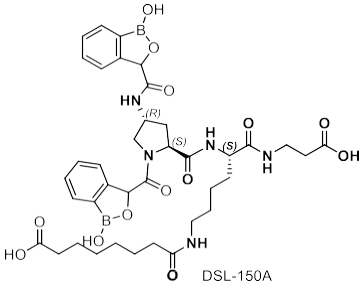
DSL-147A



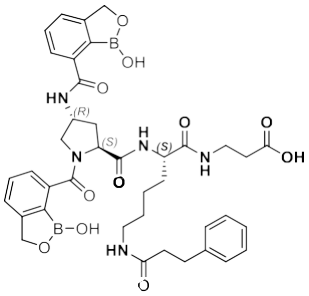
DSL-148A



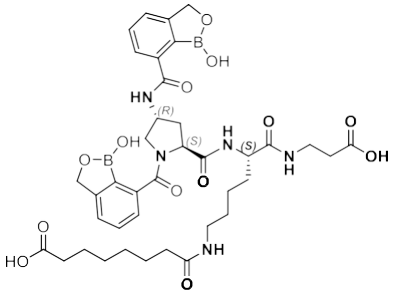
DSL-149A



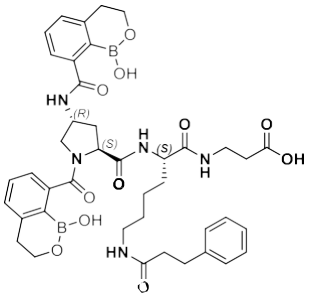
DSL-150A



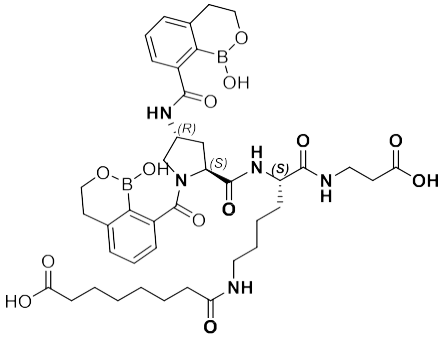
DSL-151A



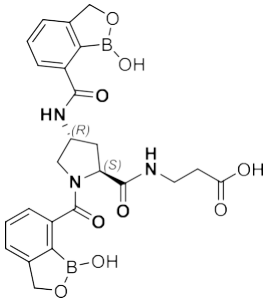
DSL-152A



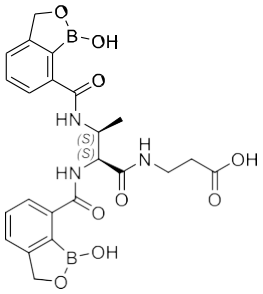
DSL-153A



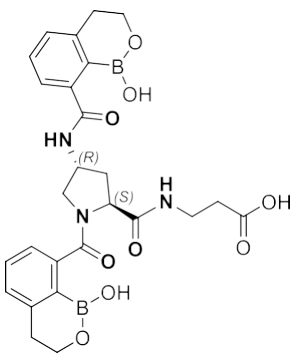
DSL-154A



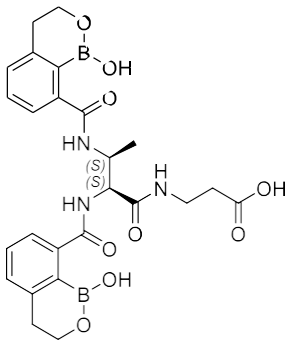
DSL-155A



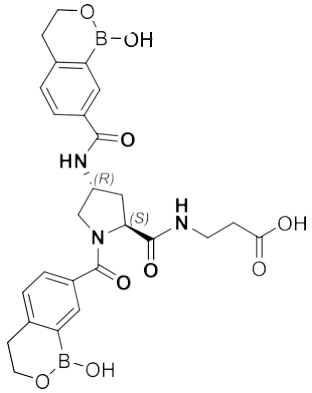
DSL-156A



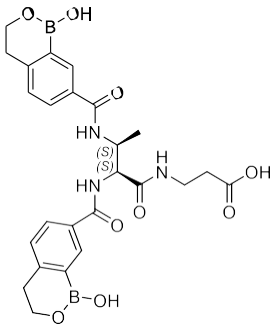
DSL-157A



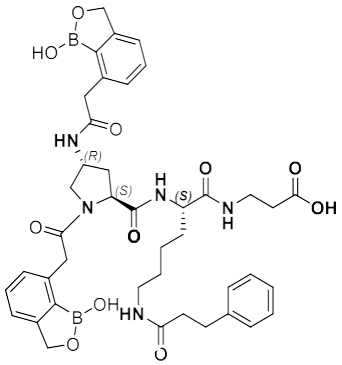
DSL-158A



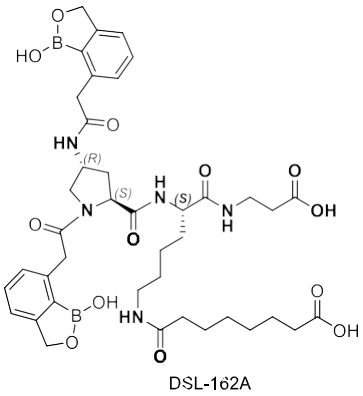
DSL-159A



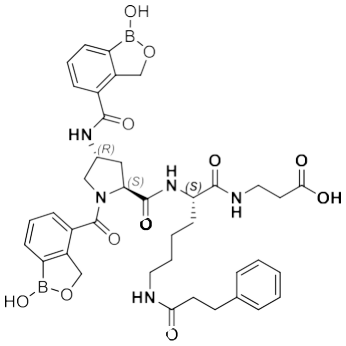
DSL-160A



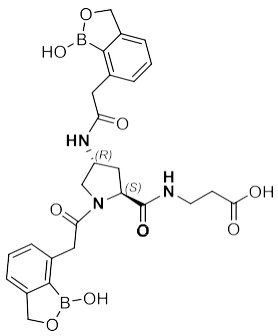
DSL-161A



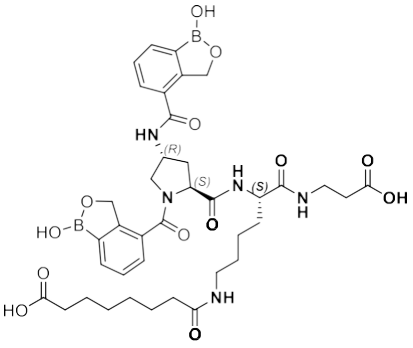
DSL-162A



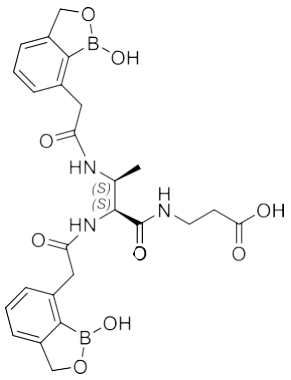
DSL-163A



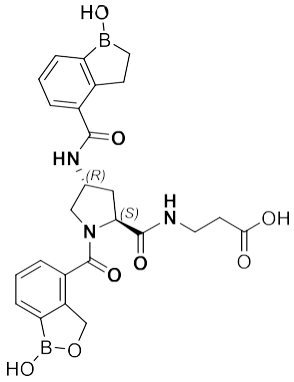
DSL-164A



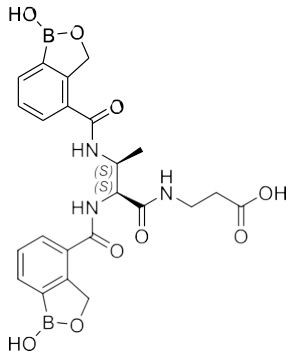
DSL-165A



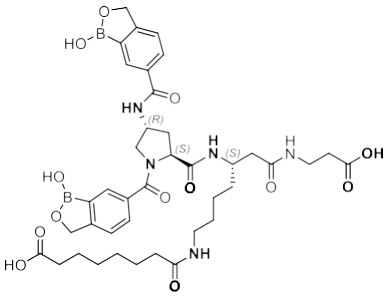
DSL-166A



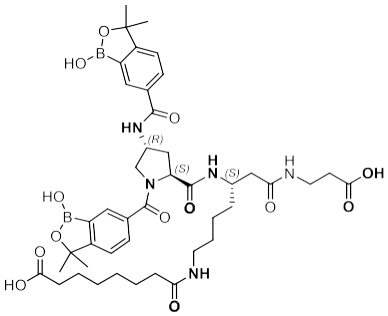
DSL-167A



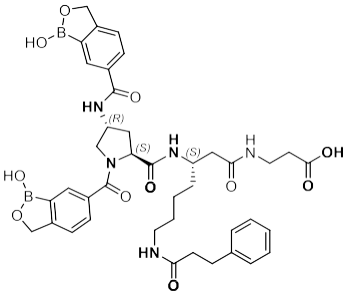
DSL-168A



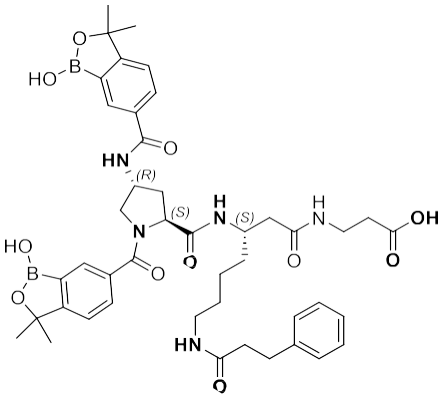
DSL-169A



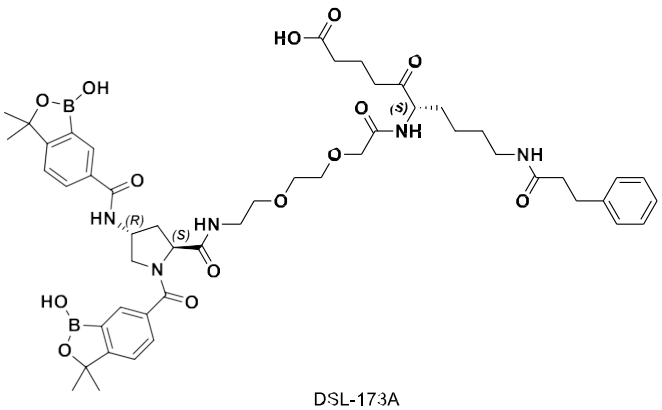
DSL-170A



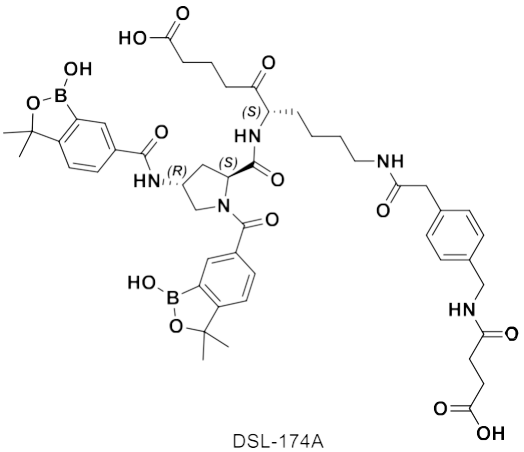
DSL-171A



DSL-172A ,

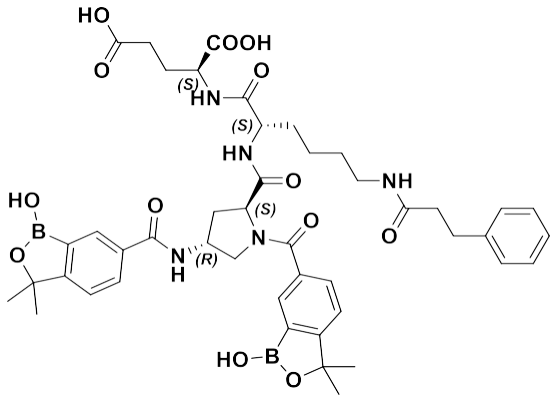


DSL-173A ,



DSL-174A

, y



DSL-175A

,

o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, una sal farmacéuticamente aceptable de este, y combinaciones de estos.

44. Un polipéptido que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de 1, 24051, y 24052; y en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de 25000 – 25397.

45. El polipéptido de la reivindicación 44, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de 1, 24051, y 24052; y en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de 24,063, 25,228, 25,229, 25,000, 25,001, 25,006-25,009, 25,076, 25,077, 25,082-25,085, 25,228, 25,229, 25,232, 25,234-25,237, 25,304, 25,305, 25,308, y 25,310-25,313.

46. El polipéptido de la reivindicación 44, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de 1 y 24051; y en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de 24063, 25228, 25229, 25011, 25012, 25017-25020, 25087,

25088, 25093-25096, 25229, 25239, 25232, 25240, 25245-25248, 25305, 25308, 25315, 25316, y 25321-25324.

47. El polipéptido de la reivindicación 44, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de 1 y 24051; y en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de 24063, 25228, 25229, 25232, 25234-25237, 25304, 25305, 25308, y 25310-25313.

48. Un compuesto que tiene una potencia agonista para un receptor de insulina que comprende al menos un grupo aromático que contiene boro que tiene potencia agonista para un receptor de insulina, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, el compuesto que tiene una primera potencia de EC50 para activar el receptor de insulina a una primera concentración de glucosa y una segunda potencia de EC50 para activar el receptor de insulina a una segunda concentración de glucosa, en donde cuando la primera concentración de glucosa es 5,6 mm y la segunda concentración de glucosa es 16,7 mm, el compuesto tiene una relación de potencia agonista del receptor de insulina de la primera EC50 a la segunda EC50 de aproximadamente 1,2 a aproximadamente 20, aproximadamente 1,5 a aproximadamente 15, aproximadamente 2 a aproximadamente 14, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 13, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 12, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 11, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 10, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 9, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 8, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 7, aproximadamente 2,5 a aproximadamente

6, aproximadamente 2,5 a aproximadamente 5, o aproximadamente 2,5 a aproximadamente 4,5.

49. Un compuesto que tiene potencia agonista para la glucosa que comprende al menos un grupo aromático que contiene boro que tiene afinidad de unión por la glucosa, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde cuando se administra a una dosis de 30 nmol/kg a un primer grupo de ratas con una primera velocidad de infusión de glucosa para proporcionar una concentración de glucosa en sangre de 100 mg/dl y a un segundo grupo de ratas con una segunda velocidad de infusión de glucosa para proporcionar una concentración de glucosa en sangre de 200 mg/dl el compuesto proporciona una diferencia de velocidad de infusión de glucosa relativa (mg/kg/min.min) de aproximadamente 1 a aproximadamente 2500, aproximadamente 1 a aproximadamente 2000, de aproximadamente 1 a aproximadamente 1500, aproximadamente 100 a aproximadamente 1500, y aproximadamente 1000 a aproximadamente 1500, y una relación de velocidad de infusión de glucosa relativa de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5, aproximadamente 0,2 a aproximadamente 4,5, aproximadamente 0,5 a aproximadamente 4, aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3,5, aproximadamente 1 a aproximadamente 3,5, aproximadamente 1,5 a aproximadamente 3,5, o aproximadamente 2 a aproximadamente 3.

50. El compuesto de la reivindicación 48 o 49, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el al menos un grupo que contiene boro aromático se une

a un supercóntigo FF, en donde el supercóntigo FF se selecciona de las Fórmulas FF12A, FF12B, FF12C, FF12D, FF116A, FF116B, FF116C, FF116D, FF225, y FF227.

51. El compuesto de la reivindicación 48 o 49, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el al menos un grupo que contiene boro aromático comprende al menos un B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes.

52. El compuesto de la reivindicación 51, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde al menos uno de B_1 y B_2 es la Fórmula F2 o la Fórmula F7.

53. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el compuesto comprende un diboronato conjugado covalentemente a una amina en X1, y una porción que contiene poliol o poliol conjugado con una amina en X1.

54. El compuesto de la reivindicación 53, o sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde el X1 es una insulina o análogo de este que comprende una cadena A y una cadena B.

55. El compuesto de la reivindicación 54, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde la amina a la que el diboronato se conjuga covalentemente está en o cerca del terminal C de la cadena B, preferentemente a una amina de una lisina B29 o

una lisina B21, y la amina a la que se conjuga el poliol está en o cerca del terminal N de la cadena A o la cadena B.

56. El compuesto de la reivindicación 54, o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde la amina a la que el poliol se conjuga covalentemente está en o cerca del terminal C de la cadena B, preferentemente a una amina de una lisina B29 o una lisina B21, y la amina a la que se conjuga el poliol está en o cerca del terminal N de la cadena A o la cadena B.

57. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-35 y 48-56, o la sal farmacéuticamente aceptable de este para usar como medicamento.

58. Un método de tratamiento o prevención de diabetes, intolerancia a la glucosa, hiperglucemia o síndrome metabólico, en donde el método comprende administrar a un sujeto que lo necesita el compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 36.

59. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56, o la composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 36 para usar en el tratamiento o prevención de la diabetes, intolerancia a la glucosa, hiperglucemia o síndrome metabólico.

60. Uso del compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56, o la composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 36 en la elaboración de un medicamento.

61. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56, o la composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 36 para usar como agente terapéutico para el tratamiento de la diabetes u obesidad, para el control de los niveles de azúcar en la sangre, o para el control de la liberación de un fármaco.

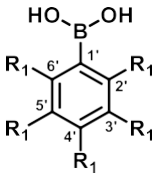
62. Un método para administrar el compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 36 a un sujeto, en donde el método comprende administrar al sujeto el compuesto como agente terapéutico o profiláctico.

63. Un método para tratar a un sujeto mediante la administración de un dispositivo o formulación que comprende un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56.

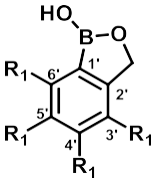
64. Uso del compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56 como un intermedio en la síntesis de una sustancia farmacológica o un terapéutico de un compuesto profiláctico.

65. Un dispositivo o formulación que comprende el compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-35, 37-43, y 48-56, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 36.

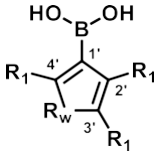
66. Un compuesto que comprende al menos un diboronato, en donde el diboronato comprende al menos dos grupos aromáticos que contienen boro, en donde al menos un grupo aromático que contiene boro se une covalentemente al compuesto y se selecciona de F3-F11, y el otro grupo aromático que contiene boro se une covalentemente al compuesto y se selecciona opcionalmente de F1-F11 o un ácido borónico,



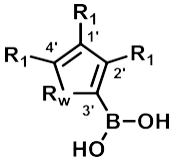
(F1)



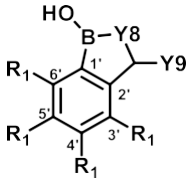
(F2)



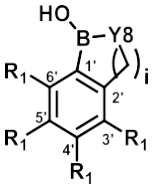
(F3)



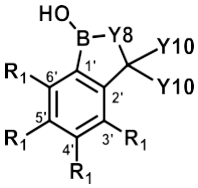
(F4)



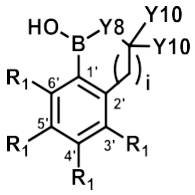
(F5)



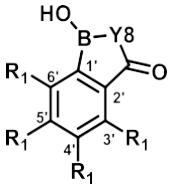
(F6)



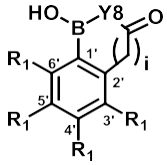
(F7)



(F8)

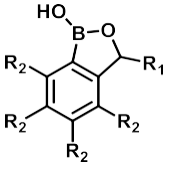


(F9)



(F10)

, y



(F11)

;

en donde al menos un R1 en cada uno de F1-F11 se une covalentemente al compuesto, y cada R_1 y R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, I, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, $(SO_2)NH$-CH_3, $(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7, en donde para las Fórmulas F3-F4:

R_w es O o S;

para la Fórmula F6:

cuando Y8 es O, i es 1, 2, 3, 4, o 5; o i es 2, 3, 4, o 5; y ninguno, uno, o dos R_1 representa F, Cl, CF_2, CF_3, SF_5, OCF_3, SO_2CH_3 y/o SO_2CF_3; o

cuando Y8 es NR, R es un grupo alquilo o H, e i es 1, 2, 3, 4, o 5;

para las Fórmulas F5 y F7-F10:

cuando Y8 es O, i es 1, 2, 3, 4, o 5; o

cuando Y8 es NR, R es un grupo alquilo o H, e i es 1, 2, 3, 4, o 5;

Y9 es CH_3, F, CF_3, CHF_2, o OCH_3; y cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, CF_3, CHF_2, y OCH_3 con la condición de que al menos un Y10 no sea H.

67. El compuesto de la reivindicación 66, en donde el compuesto es un compuesto que contiene diboro.

68. El compuesto de la reivindicación 66, en donde el compuesto es un compuesto que contiene diboro.

69. El compuesto de la reivindicación 66, en donde el al menos un grupo aromático que contiene boro es F7.

70. El compuesto de la reivindicación 66, en donde el al menos un grupo aromático que contiene boro es F7, y en donde Y8 es O y cada Y10 es CH_3.

71. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 66-70 que comprende X1 y uno o más Z1c, o un tautómero, estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal o hidrato farmacéuticamente aceptable, o un derivado isotópico de estos,

en donde:

X1 comprende:

v. NH_2 u OH;

vi. una sustancia farmacológica que comprende una amina;

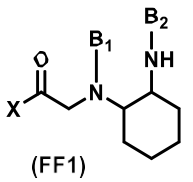
vii. una sustancia farmacológica que se conjuga covalentemente con un enlazador que contiene amina; o

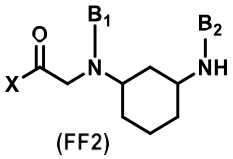
viii. una amina configurada para conjugarse covalentemente con una sustancia farmacológica;

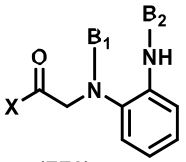
en donde cada Z1c se conjuga covalente, directa o indirectamente, con una amina en X1 o con OH cuando X1 es OH, y

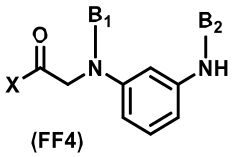
en donde cada Z1c se selecciona independientemente de:

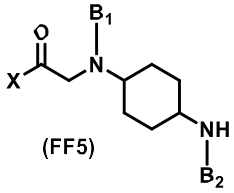
w) Fórmulas FF1-FF48, en donde las Fórmulas FF1-FF48 son:

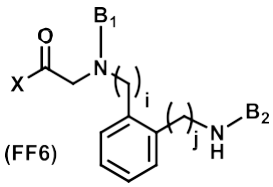

(FF1)

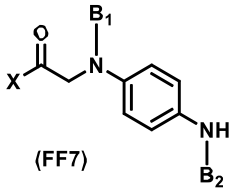

(FF2)

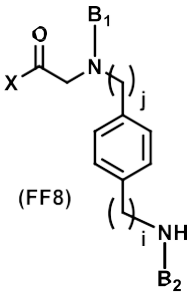

(FF3)

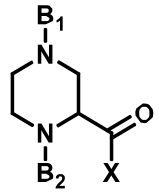

(FF4)

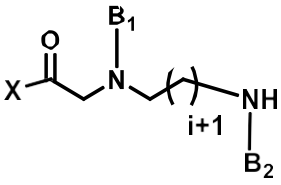

(FF5)

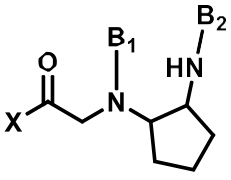

(FF6)

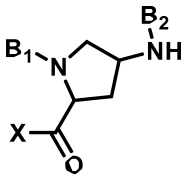

(FF7)

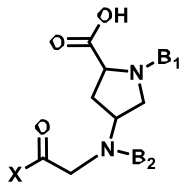

(FF8)

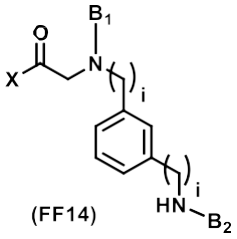

(FF9)

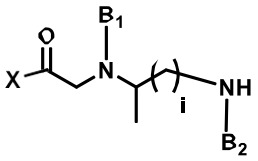

(FF10)

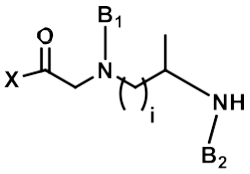

(FF11)

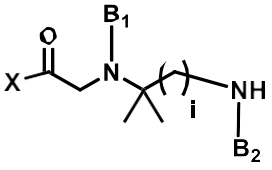

(FF12)

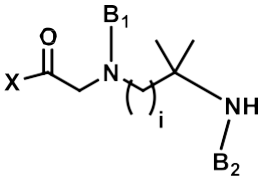

(FF13)

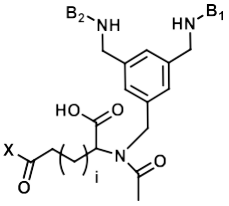

(FF14)

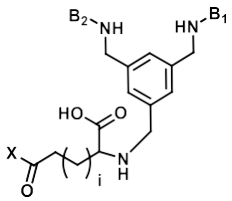

(FF15)

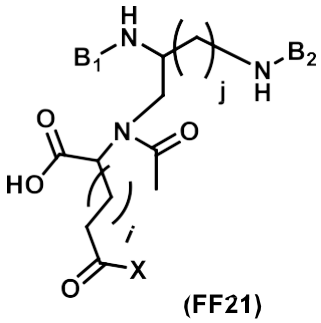

(FF16)


(FF17)

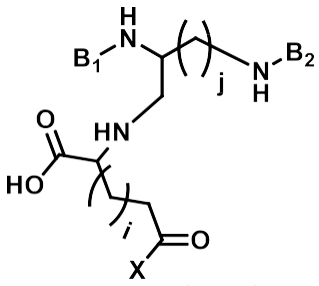

(FF18)


(FF19)

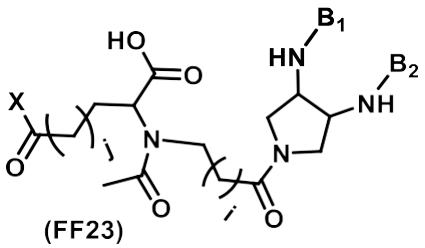

(FF20)



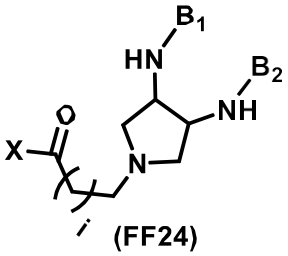
(FF21)



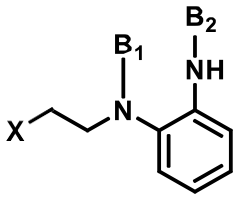
(FF22)



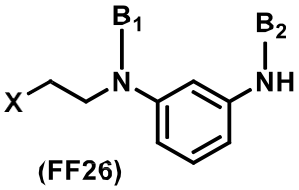
(FF23)



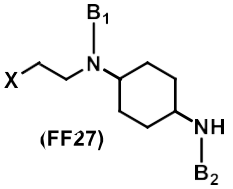
(FF24)



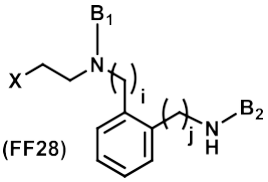
(FF25)



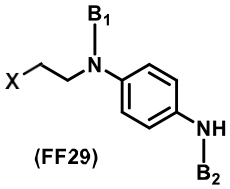
(FF26)



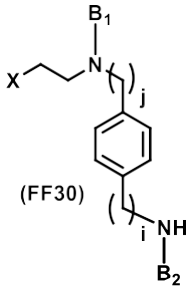
(FF27)



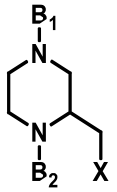
(FF28)



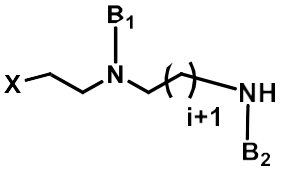
(FF29)



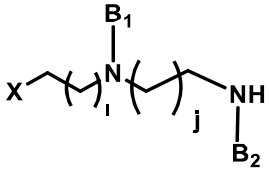
(FF30)



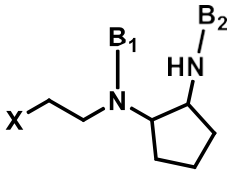
(FF31)



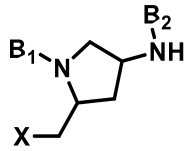
(FF32)



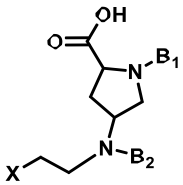
(FF33)



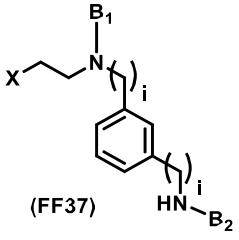
(FF34)



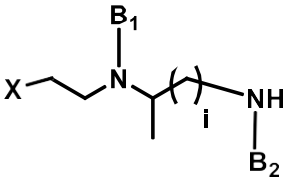
(FF35)



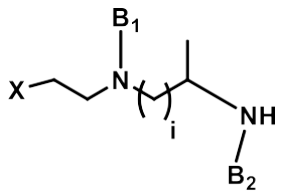
(FF36)

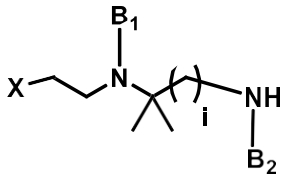


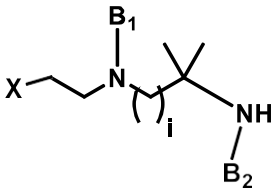
(FF37)

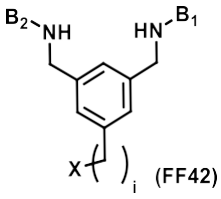


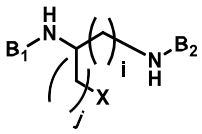
(FF38)

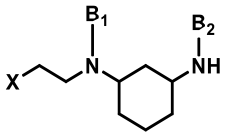

(FF39)

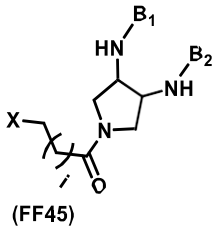

(FF40)

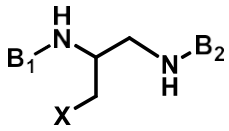

(FF41)

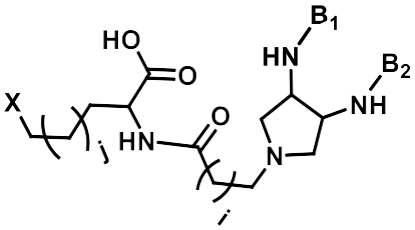

(FF42)


(FF43)

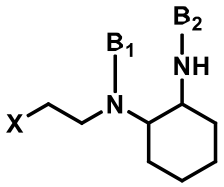

(FF44)


(FF45)


(FF46)


(FF47)

y


(FF48);

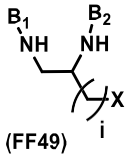
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

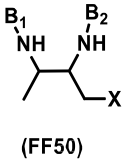
i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

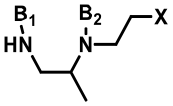
j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

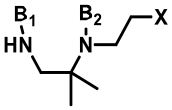
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

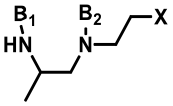
x) Fórmulas FF49-FF88, en donde las Fórmulas FF49-FF88 son:

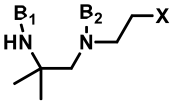

(FF49)

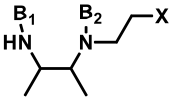

(FF50)

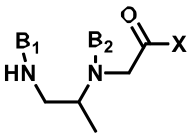

(FF51)

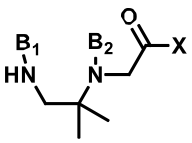

(FF52)

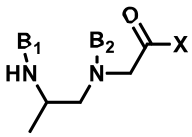

(FF53)

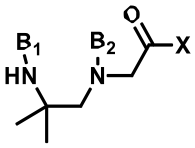

(FF54)

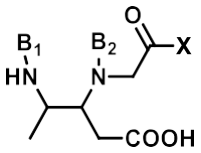

(FF55)

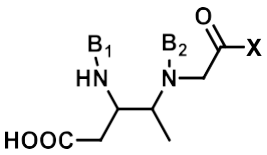

(FF56)

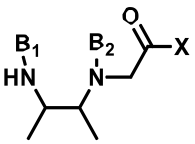

(FF57)

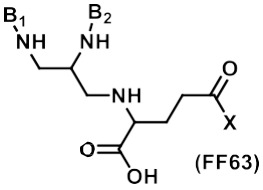

(FF58)

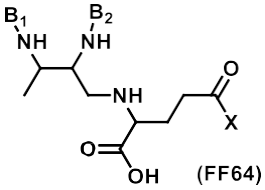

(FF59)

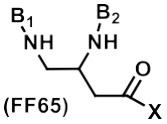

(FF60)

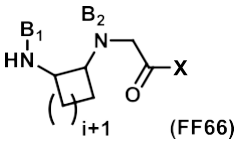

(FF61)

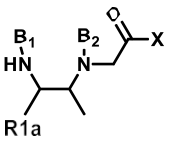

(FF62)

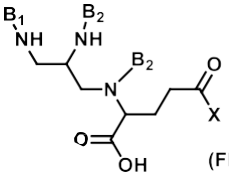

(FF63)

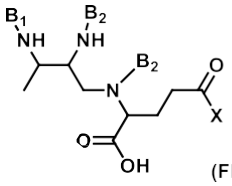

(FF64)

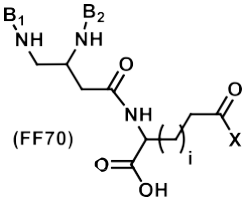

(FF65)

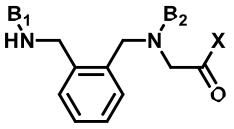

(FF66)

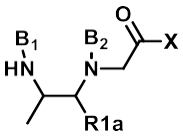

(FF67)

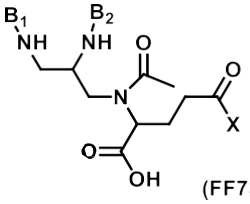

(FF68)

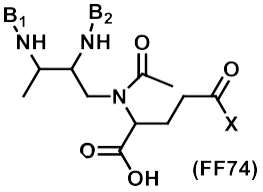

(FF69)

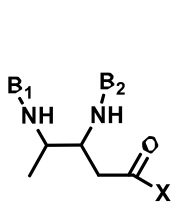

(FF70)

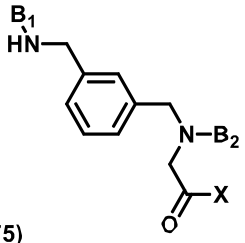

(FF71)

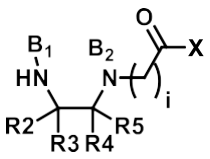

(FF72)

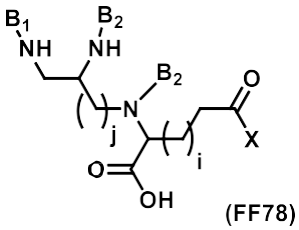

(FF73)

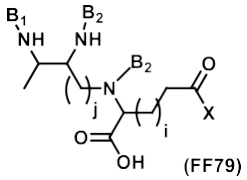

(FF74)

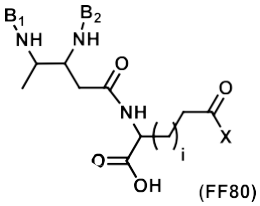

(FF75)

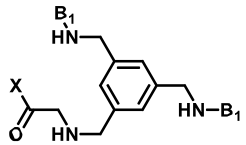

(FF76)

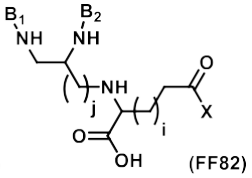

(FF77)

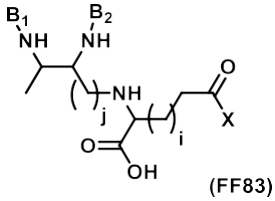

(FF78)

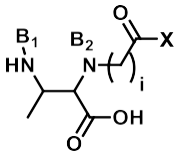

(FF79)

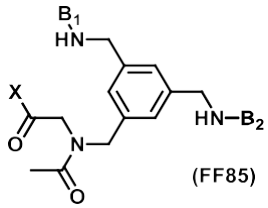

(FF80)

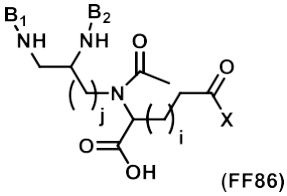

(FF81)

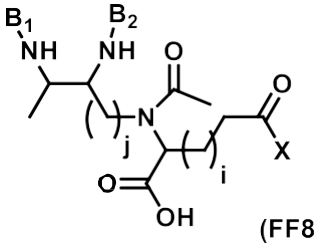

(FF82)

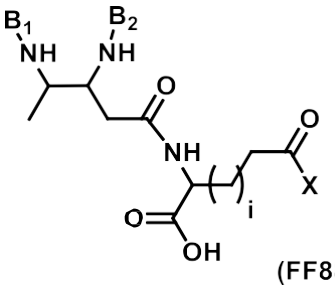

(FF83)


(FF84)


(FF85)


(FF86)


(FF87) y


(FF88);

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

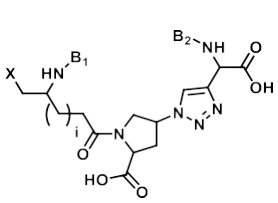
j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

R1a se selecciona de COOH, CH_3, H y OH;

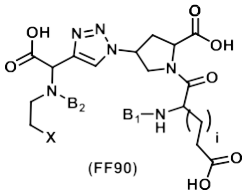
R2, R3, R4 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de CH_3, H, OH, y COOH, y al menos uno de R2, R3, R4 y R5 es CH_3 u OH; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, son cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

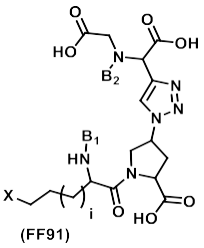
y) Fórmulas FF89-FF112, en donde las Fórmulas FF89-FF112 son:



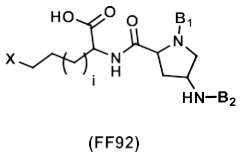
(FF89)



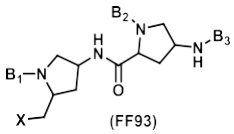
(FF90)



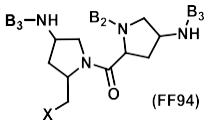
(FF91)



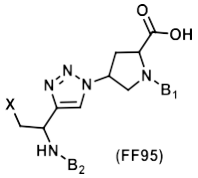
(FF92)



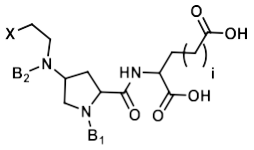
(FF93)



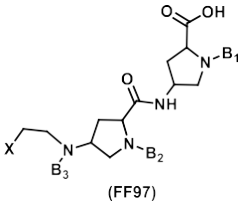
(FF94)



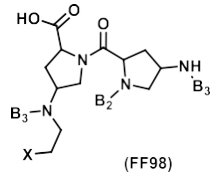
(FF95)



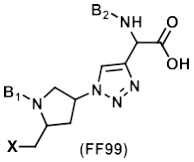
(FF96)



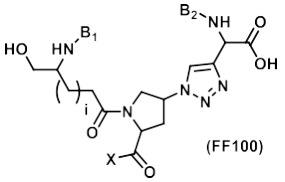
(FF97)



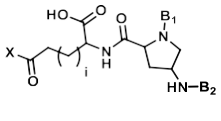
(FF98)



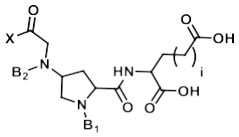
(FF99)



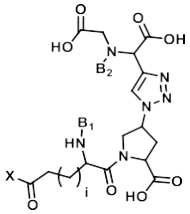
(FF100)



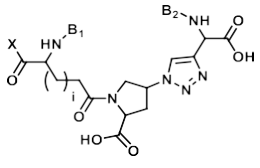
(FF101)



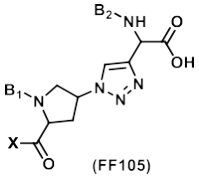
(FF102)



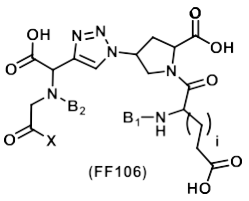
(FF103)



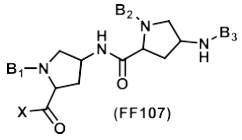
(FF104)



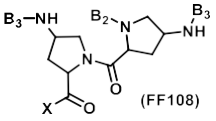
(FF105)



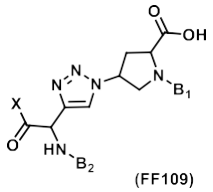
(FF106)

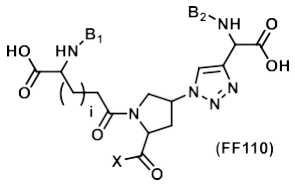


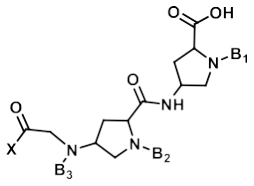
(FF107)



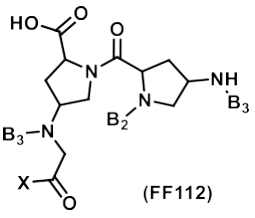
(FF108)


(FF109)


(FF110)


(FF111)

y


(FF112)

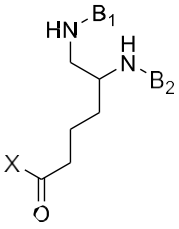
;

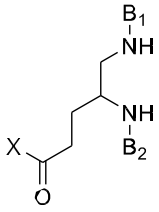
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

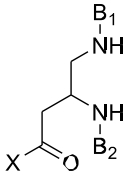
i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

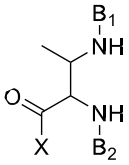
B_1, B_2 y B_3, que pueden ser idénticos o diferentes, son cada uno independientemente los grupos aromáticos que contienen boro, un derivado de ácido carboxílico, o un H, en donde en cada estructura FF89-FF112 que contiene grupos B1, B2 y B3, al menos dos de los grupos B1, B2 y B3 son independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

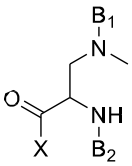
z) Fórmulas FF113-FF136, en donde las Fórmulas FF113-FF136 son:

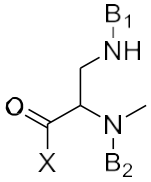

(FF113)

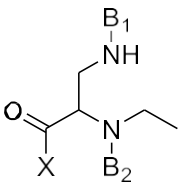

(FF114)

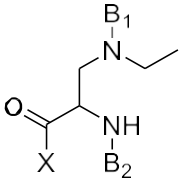

(FF115)

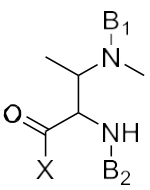

(FF116)

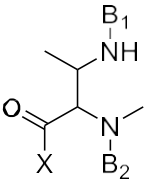

(FF117)

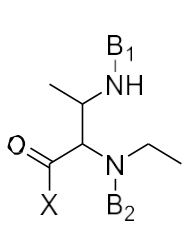

(FF118)


(FF119)

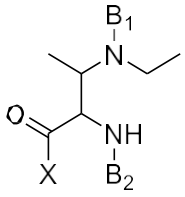

(FF120)


(FF121)

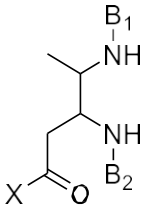

(FF122)



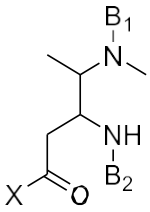
(FF123)



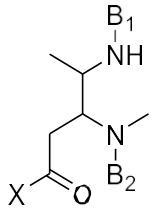
(FF124)



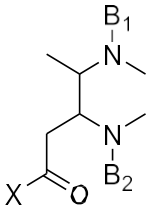
(FF125)



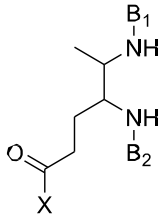
(FF126)



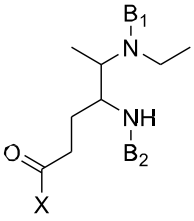
(FF127)



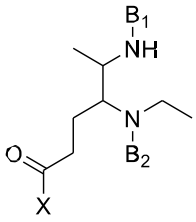
(FF128)



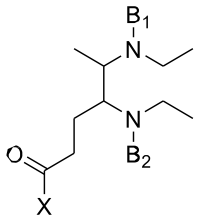
(FF129)



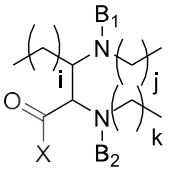
(FF130)



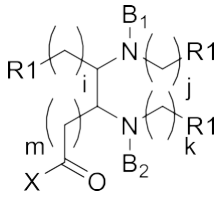
(FF131)



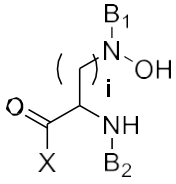
(FF132)



(FF133)

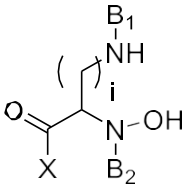


(FF134)



(FF135)

y



(FF136) ;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

k es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

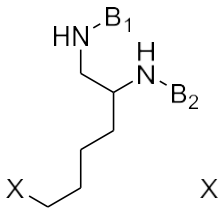
m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

cada R1 se selecciona independientemente de H, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo,

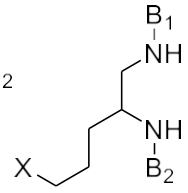
cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo, o arilo; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

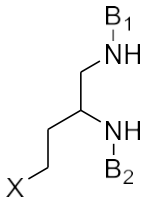
aa) Fórmulas FF137-FF160, en donde las Fórmulas FF137-FF160 son:



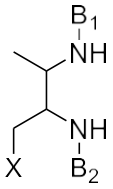
(FF137)



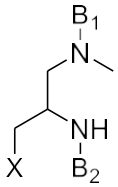
(FF138)



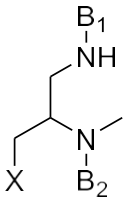
(FF139)



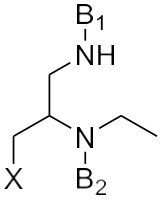
(FF140)



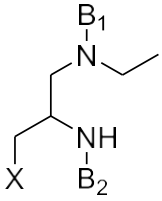
(FF141)



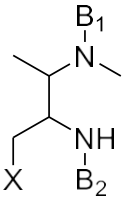
(FF142)



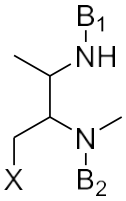
(FF143)



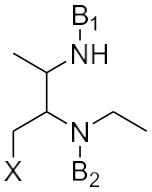
(FF144)



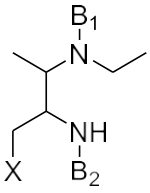
(FF145)



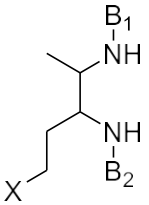
(FF146)



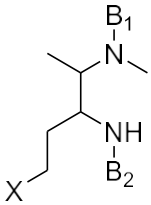
(FF147)



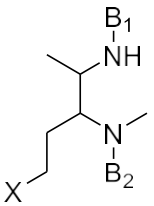
(FF148)



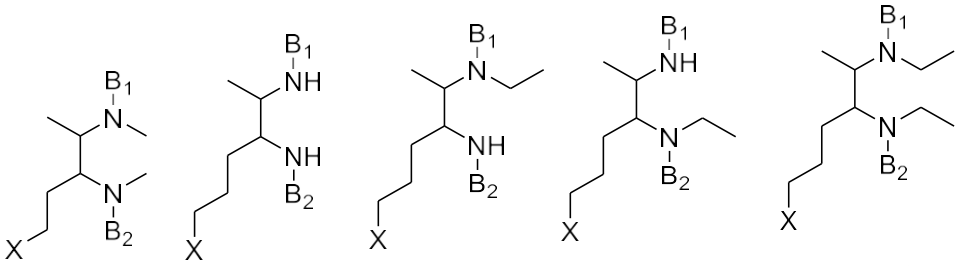
(FF149)



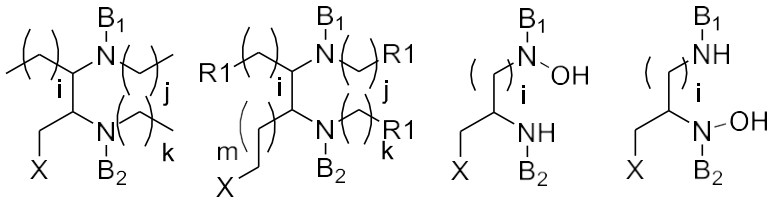
(FF150)



(FF151)



(FF152) (FF153) (FF154) (FF155) (FF156)



(FF157) (FF158) (FF159) y (FF160) ;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

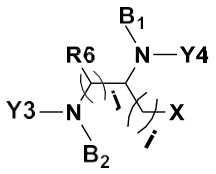
k es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

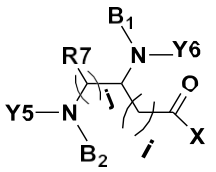
cada R1 se selecciona independientemente de H, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo, o arilo; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

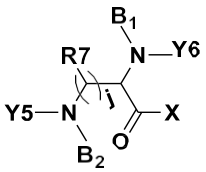
bb) Fórmulas FF161-FF164, en donde las Fórmulas FF161-FF164 son:



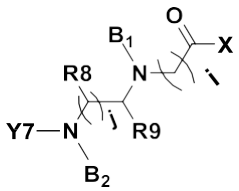
(FF161)



(FF162)



(FF163)



(FF164)

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

j es 1, 2, 3, 4, o 5;

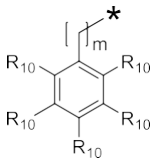
cada R6, R7, R8, y R9 para diferentes valores de j se selecciona independientemente de H, CF_3, CH_3, CHF_2 y $(CH_2)_mCH_3$, en donde m es 1, 2, 3, 4 o 5;

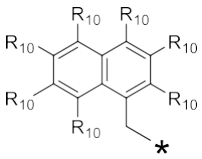
Y3, Y4, Y5, Y6 e Y7 se seleccionan cada uno independientemente de H, CH_2-X4 y las Fórmulas IV-1 a IV-135;

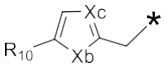
en donde X4 se selecciona de -COOH, $-(CH_2)_mCOOH$, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada X4 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo o arilo; en donde m es 1, 2, 3, 4, o 5;

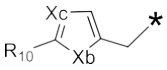
en donde al menos uno de Y5, Y6 e Y7 en las Fórmulas FF162 y FF163 no es H y al menos uno de Y7, R8 y R9 en FF164 no es H; y

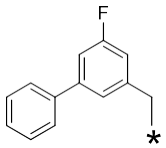
en donde las Fórmulas IV-1 a IV-135 son:

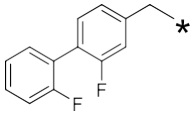

(IV-1)

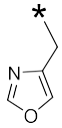

(IV-2)

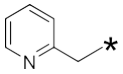

(IV-3)

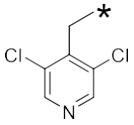

(IV-4)

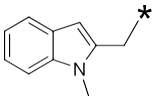

(IV-5)

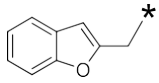

(IV-6)

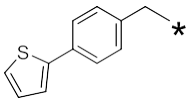

(IV-7)

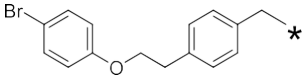

(IV-8)

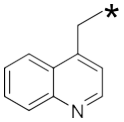

(IV-9)

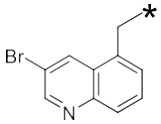

(IV-10)

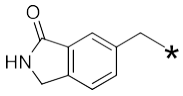

(IV-11)

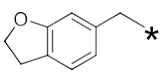

(IV-12)

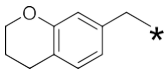

(IV-13)

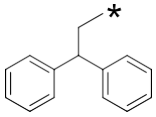

(IV-14)

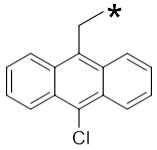

(IV-15)

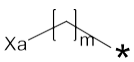

(IV-16)

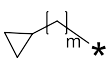

(IV-17)

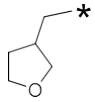

(IV-18)

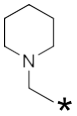

(IV-19)


(IV-20)


(IV-21)

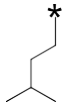

(IV-22)

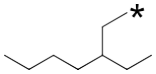

(IV-23)

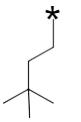

(IV-24)


(IV-25)

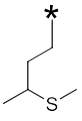

(IV-26)

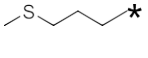

(IV-27)

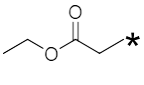

(IV-28)

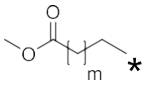

(IV-29)

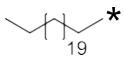

(IV-30)

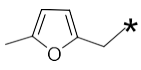

(IV-31)

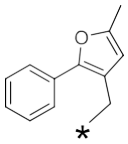

(IV-32)

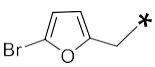

(IV-33)

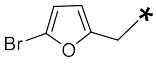

(IV-34)

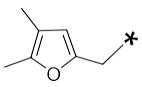

(IV-35)


(IV-36)


(IV-37)


(IV-38)


(IV-39)


(IV-40)

(IV-41)

(IV-42)

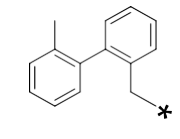
(IV-43)

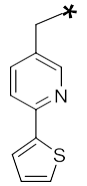
(IV-44)

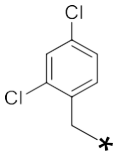
(IV-45)

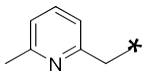
(IV-46)

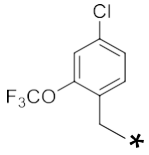
(IV-47)

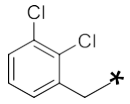

(IV-48)

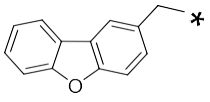

(IV-49)

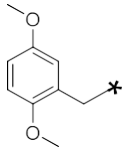

(IV-50)

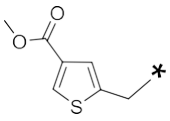

(IV-51)

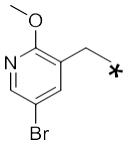

(IV-52)

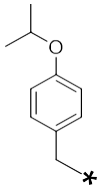

(IV-53)

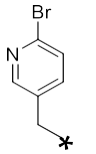

(IV-54)

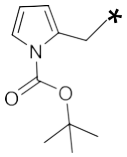

(IV-55)

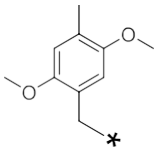

(IV-56)

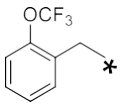

(IV-57)

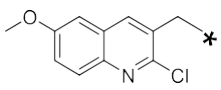

(IV-58)

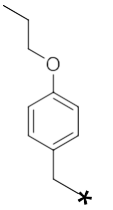

(IV-59)

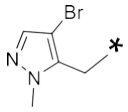

(IV-60)

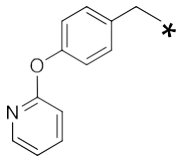

(IV-61)

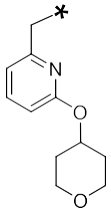

(IV-62)

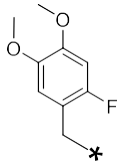

(IV-63)

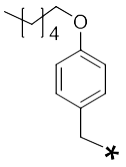

(IV-64)

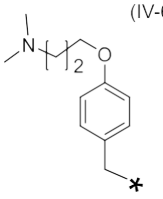

(IV-65)

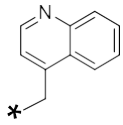

(IV-66)

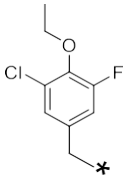

(IV-67)

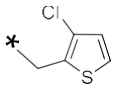

(IV-68)

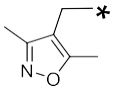

(IV-69)

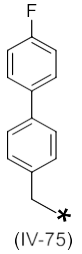

(IV-70)

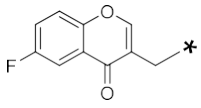

(IV-71)

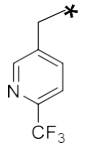

(IV-72)

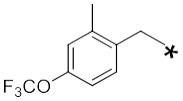

(IV-73)

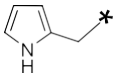

(IV-74)

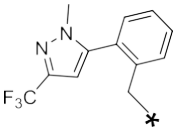

(IV-75)

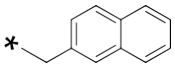

(IV-76)

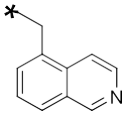

(IV-77)

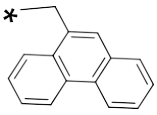

(IV-78)

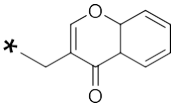

(IV-79)

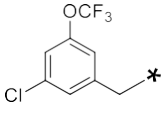

(IV-80)

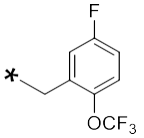

(IV-81)

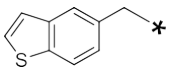

(IV-82)


(IV-83)


(IV-84)


(IV-85)

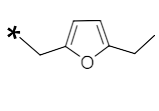

(IV-86)

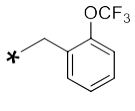

(IV-87)

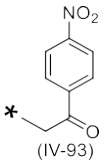
(IV-88)

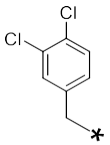
(IV-89)

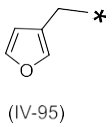
(IV-90)

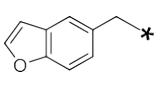

(IV-91)

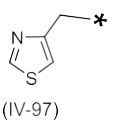

(IV-92)

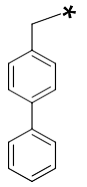

(IV-93)

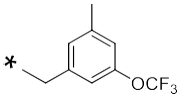

(IV-94)

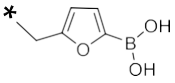

(IV-95)

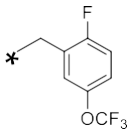

(IV-96)

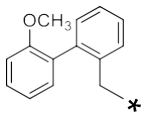

(IV-97)

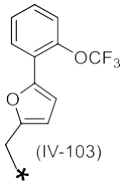

(IV-98)

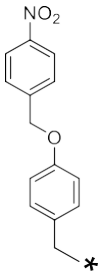

(IV-99)

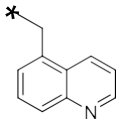

(IV-100)

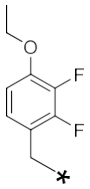

(IV-101)

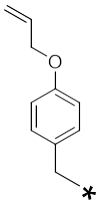

(IV-102)

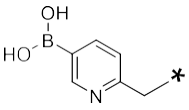

(IV-103)

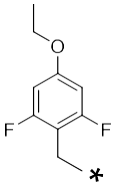

(IV-104)

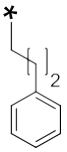

(IV-105)

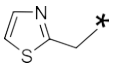

(IV-106)

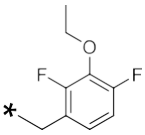

(IV-107)

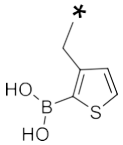

(IV-108)

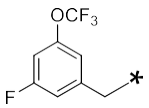

(IV-109)

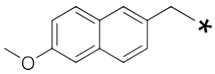

(IV-110)

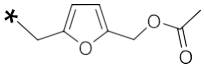

(IV-111)

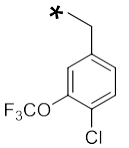

(IV-112)

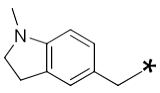

(IV-113)

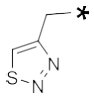

(IV-114)

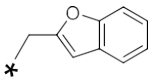

(IV-115)

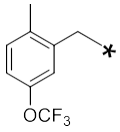

(IV-116)

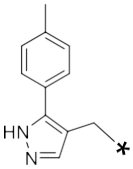

(IV-117)

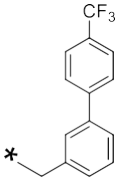

(IV-118)

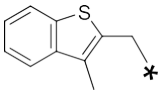

(IV-119)

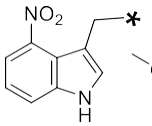

(IV-120)

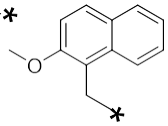

(IV-121)

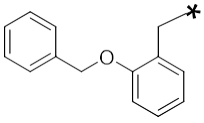

(IV-122)

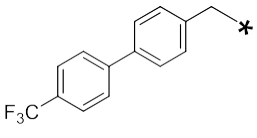

(IV-123)

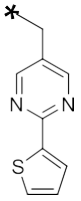

(IV-124)

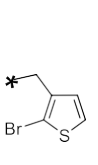

(IV-125)

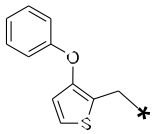

(IV-126)

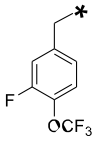

(IV-127)

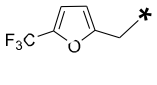

(IV-128)

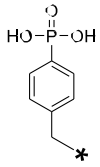

(IV-129)


(IV-130)

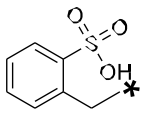

(IV-131)


(IV-132)


(IV-133)


(IV-134)

y


(IV-135)

;

en donde Xa representa CH=O, CHF_2, CF_3, CH_2SH, COOH, CH_2OH, CH_2NO_2, CH_2NH_2, CH_3, $C(CH_3)_3$, $CH(CH_3)_2$, $CH((CH_2)_3\text{-}CH_3)_2$ o $CH(CH_2\text{-}CH_3)_2$;

Xb representa O, NH, CH_2, o S;

Xc representa CH o N;

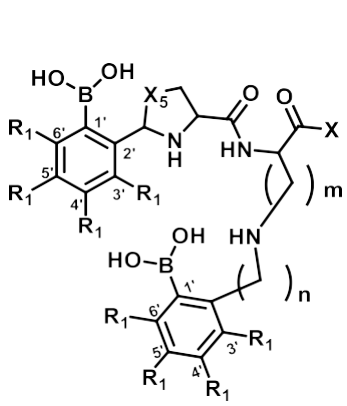
cada R_{10} se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, CH_3, CF_3, CH=O, OH, COOH, y $(CH_2)_nCH_3$,

m es 1, 2, 3, 4, o 5; y n es 1, 2, 3, 4, o 5;

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro; y

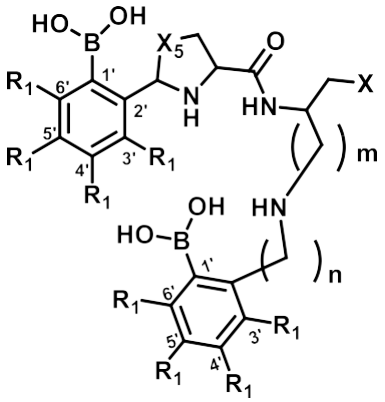
* en las Fórmulas IV-1 a IV-135 representa un punto de unión a las Fórmulas FF161-164 correspondientes;

cc) Fórmulas FF165-FF166, en donde las Fórmulas FF165-FF166 son:



(FF165)

y



(FF166)

;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

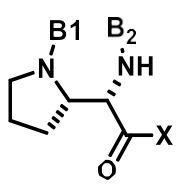
m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

n es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

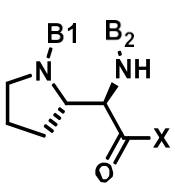
X5 es S, O, o NH; y

cada R_1 se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH$ CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

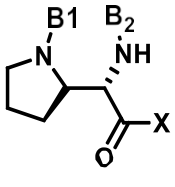
dd) Fórmulas FF167-FF192, en donde las Fórmulas FF167-FF192 son:



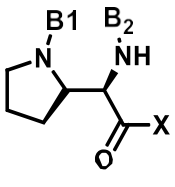
(FF167)



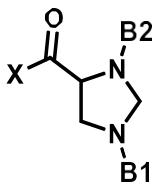
(FF168)



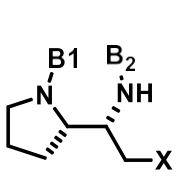
(FF169)

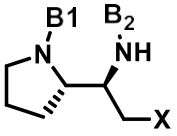


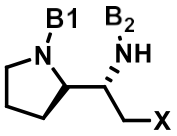
(FF170)

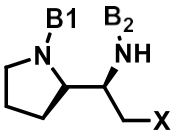


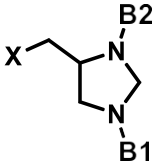
(FF171)

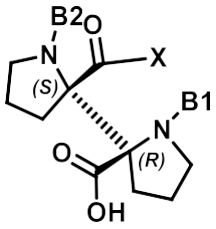

(FF172)

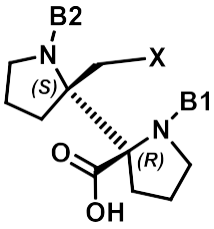

(FF173)

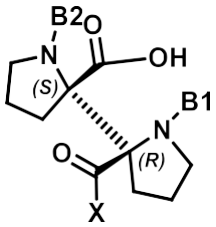

(FF174)

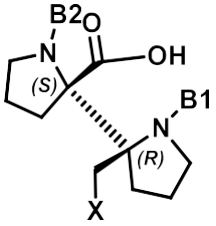

(FF175)

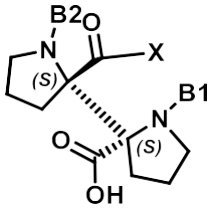

(FF176)

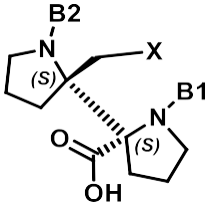

(FF177)

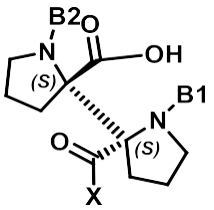

(FF178)

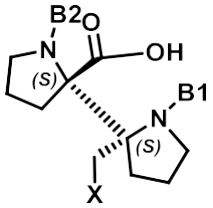

(FF179)

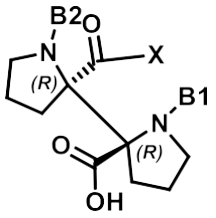

(FF180)

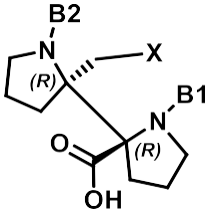

(FF181)

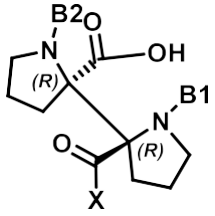

(FF182)

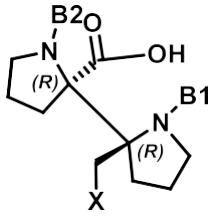

(FF183)

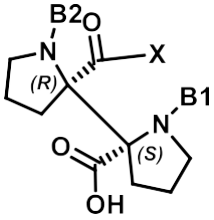

(FF184)

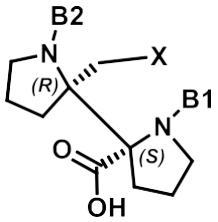

(FF185)

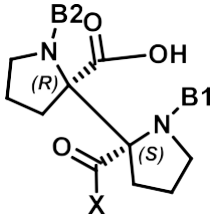

(FF186)

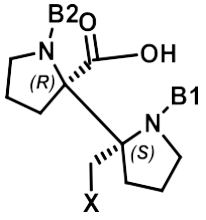

(FF187)


(FF188)


(FF189)


(FF190)


(FF191)

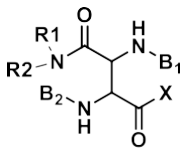

(FF192)

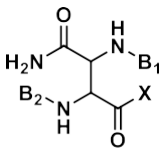
y ;

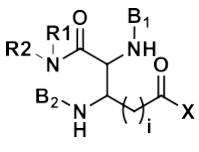
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

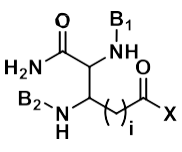
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

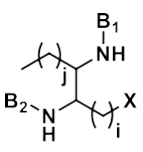
ee) Fórmulas FF193-FF209, en donde las Fórmulas FF193-FF209 son:

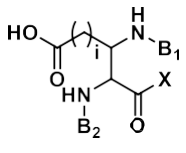

FF193

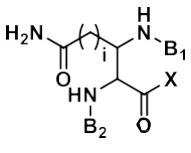

FF194

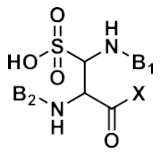

FF195

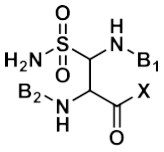

FF196

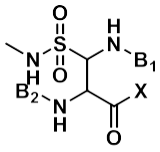

FF197

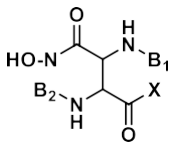

FF198

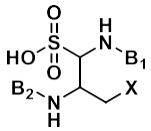

FF199

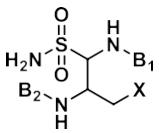

FF200

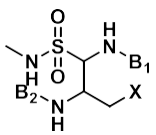

FF201

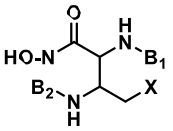

FF202

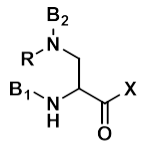

FF203

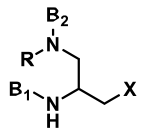

FF204


FF205


FF206


FF207


FF208


FF209

;

en donde R en FF208 y FF209 es un alquilo, arilo o haluro que se conjuga covalentemente a través de al menos un grupo CH_2 con el grupo amino en la cadena lateral de FF208 o FF209,

R1 y R2 se seleccionan independientemente de H, CH_3, alquilo y las Fórmulas IV-1 a IV-135;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

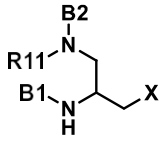
j es 1, 2, 3, 4, o 5; y

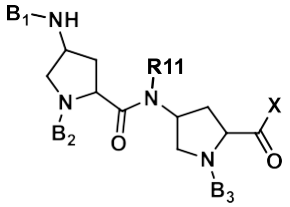
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH; y

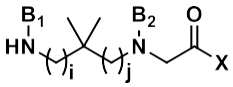
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro;

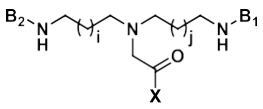
ff) Fórmulas FF210-FF224, en donde las Fórmulas FF210-FF224 son:

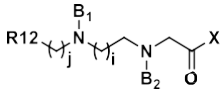

FF210

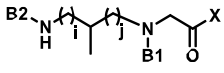

FF211

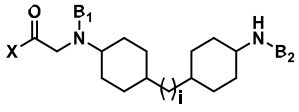

FF212

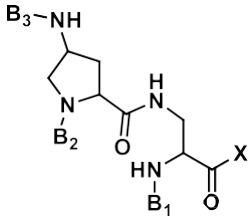

FF213

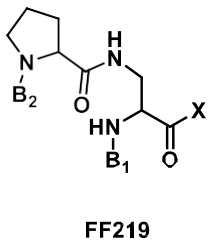

FF214

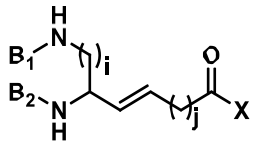

FF215

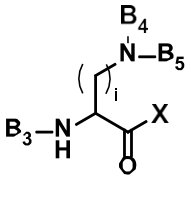

FF216

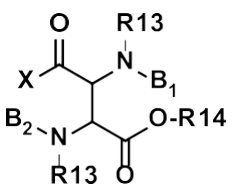

FF217


FF218

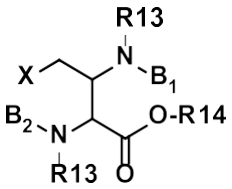

FF219


FF220


FF221



FF222



FF223



, y FF224;

en donde R11 en FF210 a FF212 se selecciona de las Fórmulas IV-1 a IV-135 y R12 se selecciona de una amina, un hidroxilo, un alquilo, y un grupo haluro;

en donde cada R13 se selecciona independientemente de H, CH_3, alquilo, arilo y las Fórmulas IV-1 a IV-135; R14 se selecciona de H, CH_3, alquilo, arilo y heteroarilo;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

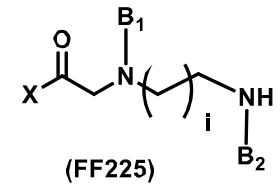
X'' representa un punto de unión covalente a una amina --N en el compuesto, en donde -- representa un enlace covalente único a un grupo CH_2 o CH en el compuesto;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

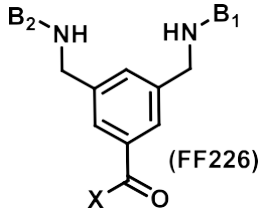
j es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cada uno de B_1, B_2, B_3, B_4, B_5, y B_6 representa independientemente los grupos aromáticos que contienen boro, en donde en cada estructura FF que contiene grupos B_1, B_2 y B_3, al menos dos de los grupos B1, B2 y B3 son independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

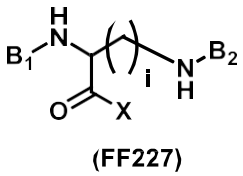
gg) Fórmulas FF225-FF231, en donde las Fórmulas FF225-FF231 son:



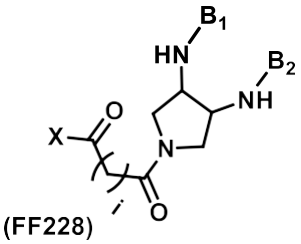
(FF225)



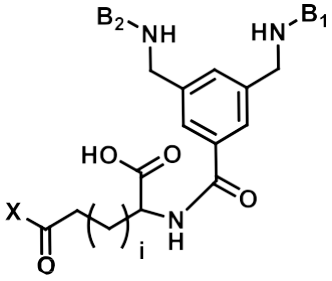
(FF226)



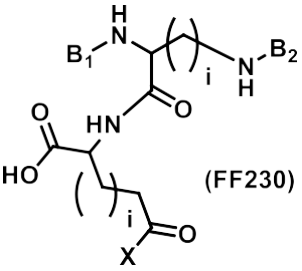
(FF227)



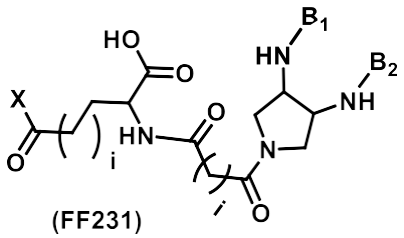
(FF228)



(FF229)



(FF230)



(FF231)

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente grupos aromáticos que contienen boro; y

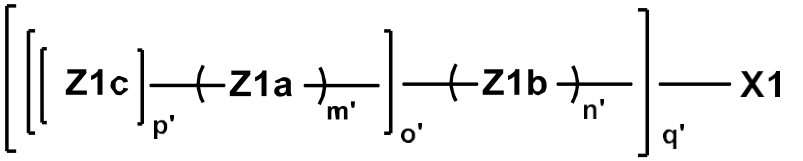
en donde al menos una amina primaria o secundaria en FF1-FF223 y FF225-231 se conjuga covalentemente con B_6.

72. El compuesto de la reivindicación 71, en donde al menos un Z1c es FF227.

73. El compuesto de la reivindicación 72, en donde al menos un Z1c es FF227 e i es 1.

74. El compuesto de la reivindicación 71, en donde el al menos un Z1c se selecciona de FF12-FF35, FF104-FF117, FF180-FF193, y FF196-FF205.

75. El compuesto de la reivindicación 71, en donde el compuesto es un conjugado molecular representado por la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:



,

en donde

X1 comprende:

(v) NH_2 u OH,

(vi) una sustancia farmacológica polipeptídica que comprende una amina,

(vii) una sustancia farmacológica polipeptídica que se conjuga covalentemente con un enlazador que contiene amina, o

(viii) una amina configurada para conjugarse covalentemente con una sustancia farmacológica polipeptídica;

cada Z1c se selecciona independientemente de las Fórmulas FF1-FF231;

cada Z1a comprende independientemente de 1 a 50 aminoácidos conectados entre sí mediante enlaces amida o peptídicos;

cada Z1b es independientemente un enlazador de molécula pequeña;

cada m' es independientemente 0 o 1;

cada n' es independientemente 0 o un número entero positivo;

cada o' es independientemente un número entero mayor o igual a 1;

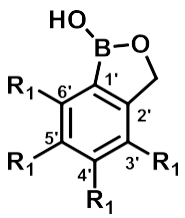
cada p' es un número entero positivo; y

q' es un número entero positivo de al menos 1 y no más de dos veces la cantidad total de grupos amina en X1, en donde, cuando cualquiera de n', o', p' o q' es 2 o más, los grupos correspondientes Z1a, Z1b y Z1c se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

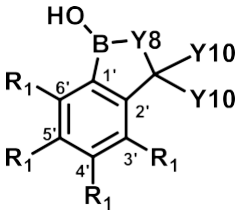
en donde cada Z1c se conjuga independientemente de manera covalente, directa o indirectamente, con una amina de Z1a, con una amina de Z1b, o con X1; y

en donde opcionalmente el conjugado molecular puede comprender uno o más isótopos en cualquier posición del conjugado molecular.

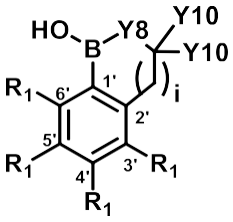
76. El compuesto de la reivindicación 71, en donde el compuesto comprende al menos un grupo seleccionado de B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6, cada uno independientemente seleccionado de:



(F2)

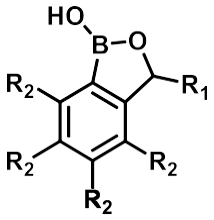


(F7)



(F8)

, y



(F11)

;

en donde para B_1, B_2 y B_3:

un R_1 representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para la Fórmula F7:

Y8 es O; y

cada Y10 se selecciona independientemente de CH_3, F, y CF_3;

en donde para la Fórmula F8:

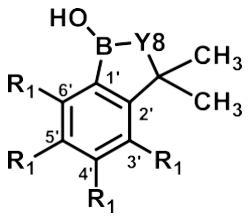
Y8 es O;

i es 2, 3, 4, o 5; y

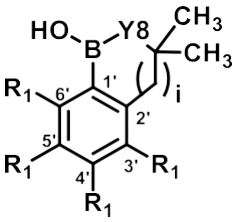
cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, y CF_3, con la condición de que al menos un Y10 no sea H; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

77. El compuesto de la reivindicación 71, en donde el compuesto comprende al menos un grupo seleccionado de B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6, cada uno independientemente seleccionado de:

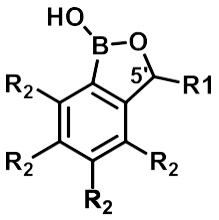


(F7A)



(F8A)

, y



(F11)

;

en donde para B_1, B_2 y B_3:

R_1 en la posición 5' representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para la Fórmula F7A:

Y8 es O; y

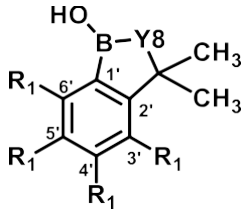
en donde para la Fórmula F8A:

Y8 es O; y

i es 2, 3, 4, o 5; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

78. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 71-77, en donde B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6 son cada una independientemente la Fórmula F7A,



(F7A) ,

en donde para B_1, B_2 y B_3:

R_1 en la posición 5’ representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

Y8 es O; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

79. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 71-75, en donde al menos un Z1c se conjuga covalentemente indirectamente mediante un enlazador a una amina de X1 o a NH_2 cuando X1 es NH_2 o a OH cuando X1 es OH o a una amina de Z1a,

en donde el enlazador se representa por la Fórmula $(X")_{n1}$, en donde

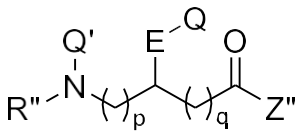
cada n1 se selecciona independientemente de 1, 2, 3, 4, y 5, y

cada X" se selecciona independientemente de:

v. un aminoácido L o D, en donde un grupo funcional amina del aminoácido L o D se conjuga covalentemente, directa o indirectamente, con Z1c y un grupo funcional ácido del aminoácido L o D se conjuga, directa o indirectamente, a X1 o a Z1a; y

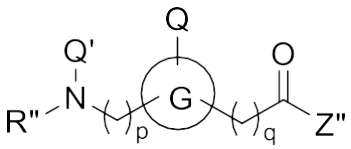
vi. las Fórmulas FL(IA), FL(IB), FL69 y FL70;

en donde las Fórmulas FL(IA) y FL(IB) son:



FL(IA)

,



FL(IB)

, y estereoisómeros de este;

en donde:

G se selecciona de un grupo cicloalquilo de 3 a 6 miembros, un grupo heterociclilo de 3 a 10 miembros, un grupo heteroarilo, y un grupo arilo, en donde cada grupo se sustituye opcionalmente con 1-3 grupos seleccionados independientemente de hidroxi, amino, halógeno, cicloalquilo, alcoxi, y alquilo;

E está ausente o es un grupo alquileno opcionalmente sustituido con 1-3 grupos seleccionados independientemente de halógeno, hidroxi, y amino;

Q está ausente o se selecciona de hidrógeno, alquilo, halo, ciano, alcoxi, ácido carboxílico, amino, hidroxi, amida, haloalquilo, cicloalquilo, heterociclo, heteroarilo y arilo, en donde el alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterociclo, heteroarilo, y cada arilo está opcionalmente sustituido con 1-5 grupos seleccionados independientemente de alquilo, amino, amida, halo, hidroxi, ciano, haloalquilo y alcoxi;

Q' se selecciona de hidrógeno, alquilo y un grupo acilo;

Q y Q', junto con el átomo de carbono y nitrógeno al que están unidos, forman opcionalmente un heterociclilo de 4 miembros, un heterociclilo de 5 miembros, un heterociclilo de 6 miembros, un heterociclilo bicíclico de 9 miembros o un heterociclilo de 10 miembros. heterociclilo bicíclico, en donde el heterociclilo de 4 miembros, el heterociclilo de 5 miembros, el heterociclilo de 6 miembros, el heterociclilo bicíclico de 9 miembros y el heterociclilo bicíclico de 10 miembros están opcionalmente sustituidos con 1-5 grupos seleccionados independientemente de alquilo, amino, halo, hidroxi, ciano, amida, haloalquilo y alcoxi;

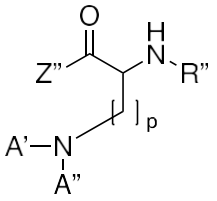
p es 0, 1, 2, 3, 4, o 5;

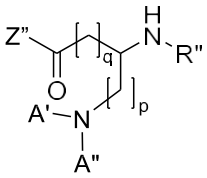
q es 0, 1, 2, 3, 4, o 5;

R" representa un enlace covalente, directo o indirecto, a Z1c;

Z'' representa un enlace covalente, directa o indirectamente, con X1 o con Z1a; y cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada;

en donde las Fórmulas FL69 y FL70 son:



FL69 ,  FL70 , y estereoisómeros de este;

en donde:

R'' representa un enlace covalente, directo o indirecto, a Z1c;

Z'' representa un enlace covalente, directo o indirecto, con X1 o con Z1a;

A' se selecciona de H, un alquilo, un ácido graso saturado, un ácido graso insaturado, un cicloalquilo, un haloalquilo, un arilo, y un heteroarilo; y

A" es

(i) un ácido biliar conjugado, directa o indirectamente, a través de su grupo ácido a la amina en FL69 o FL70; o

(ii) un grupo acilo C_2-C_{20} termina opcionalmente en un grupo ácido, en donde uno o más átomos de carbono del grupo acilo C_2-C_{20} se reemplazan opcional e independientemente con un grupo seleccionado de C(=O), O, NH, NH_2, S, S(O), SO_2, fenilo, heterociclilo de 5 miembros, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, y en donde el uno o más átomos de carbono del grupo acilo C_2-C_{20}, NH, NH_2, SO_2, fenilo, heterociclilo de 5 miembros, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, y heteroarilo de 6 miembros se sustituye cada uno independientemente con 0, 1, 2, 3, o 4 R_x,

en donde R_x se selecciona de alquilo C_1-C_5, halógeno, haloalquilo C_1-C_5, ácido carboxílico, hidroxilo, -O-alquilo C_1-C_5, NH_2, y un heterociclilo de 5 miembros sustituido

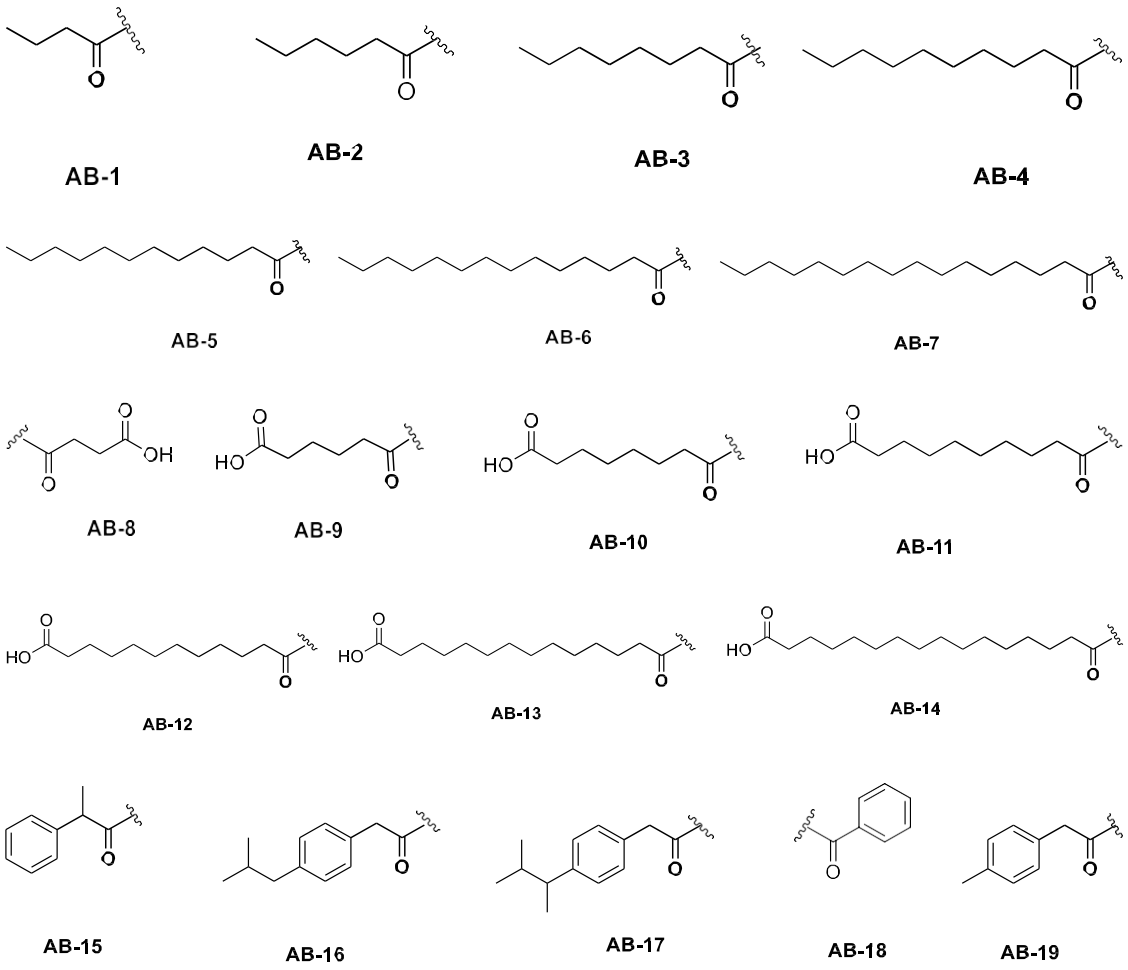
o no sustituido, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, y heteroarilo de 6 miembros;

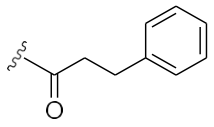
p es 1, 2, 3, 4, o 5,

q es 1, 2, 3, 4, o 5, y

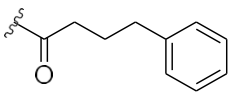
cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada.

80. El compuesto de la reivindicación 79, en donde cada A" se selecciona independientemente de:

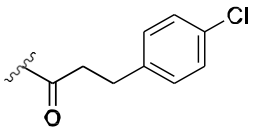




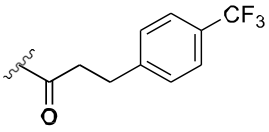
AB-20



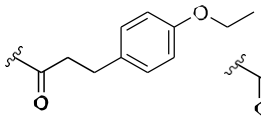
AB-21



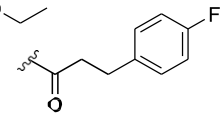
AB-22



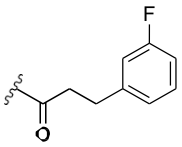
AB-23



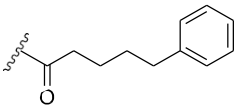
AB-24



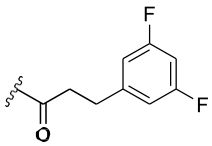
AB-25



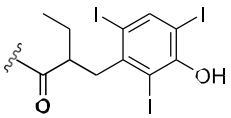
AB-26



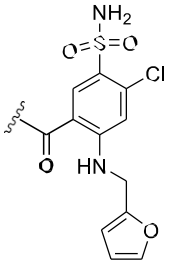
AB-27



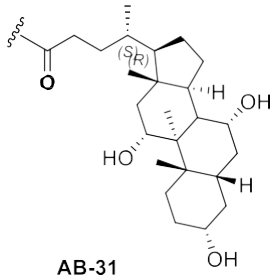
AB-28



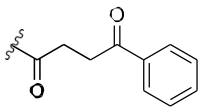
AB-29



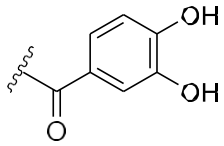
AB-30



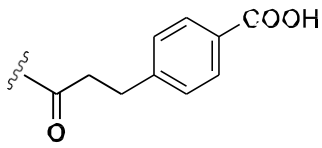
AB-31



AB-32

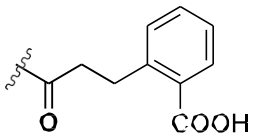


AB-33



AB-34

, y



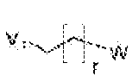
AB-35

.

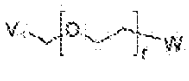
5

81. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde el compuesto comprende al menos un Z1b seleccionado de las Fórmulas IIa-IIai y las Fórmulas IIIa-IIIai,

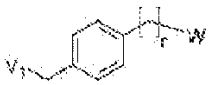
en donde las Fórmulas IIa-IIai son:



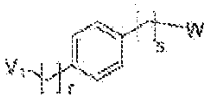
Fórmula IIa



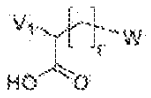
Fórmula IIb



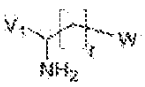
Fórmula IIc



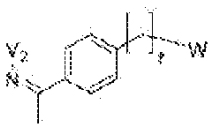
Fórmula IId



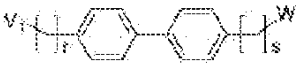
Fórmula IIe



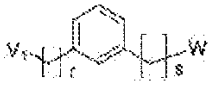
Fórmula IIf



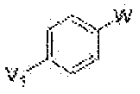
Fórmula IIg



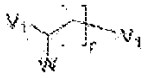
Fórmula IIh



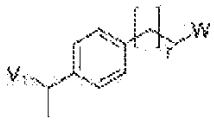
Fórmula IIi



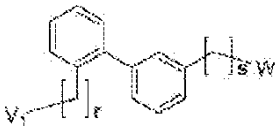
Fórmula IIj



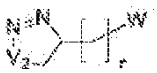
Fórmula IIk



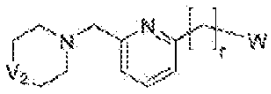
Fórmula III



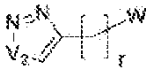
Fórmula IIm



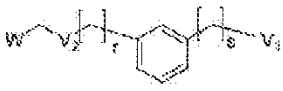
Fórmula IIn



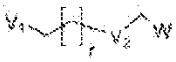
Fórmula IIo



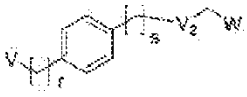
Fórmula IIp



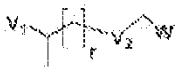
Fórmula IIq



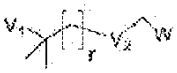
Fórmula IIr



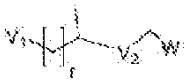
Fórmula IIs



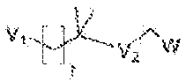
Fórmula IIt



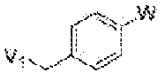
Fórmula IIu



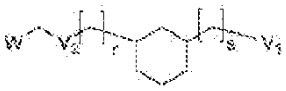
Fórmula IIv



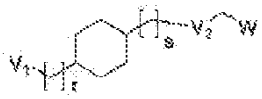
Fórmula IIw



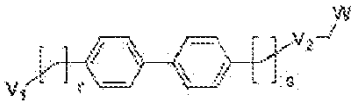
Fórmula IIx



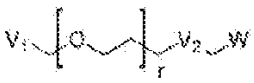
Fórmula IIy



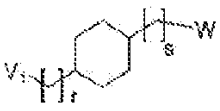
Fórmula IIz



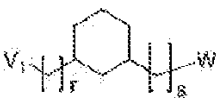
Fórmula IIaa



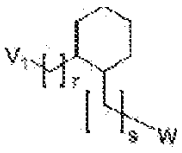
Fórmula IIab



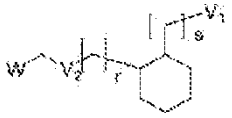
Fórmula IIac



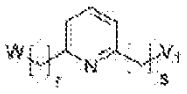
Fórmula IIad



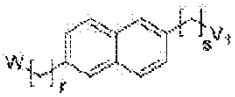
Fórmula IIae



Fórmula IIaf



Fórmula IIag



Fórmula IIah

y



Fórmula IIai ;

en donde:

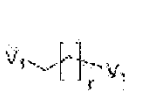
r es 0, 1, 2, 3, 4, o 5;

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

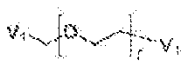
W representa CH_2---~ o (C=O)---~, en donde ---~ es un enlace covalente a X1; y

cada V_1 se selecciona independientemente de NH---†, CH_2---†, y (C=O)---† y cada V_2 es N---†, en donde ---† es un enlace covalente hacia Z1b, Z1a o Z1c sucesivo, siempre que V_1 sea NH---† cuando se conecta a Z1c; y los enlaces covalentes entre las unidades Z1a y Z1b comprenden cada uno independientemente un enlace amina o una unión de amida; y cuando n'=0 y m'=1, Z1a se conjuga directamente con X1 mediante un enlace de amina o enlace amida, y

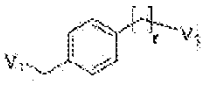
en donde las Fórmulas IIIa-IIIai son:



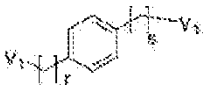
Fórmula IIIa



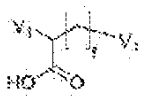
Fórmula IIIb



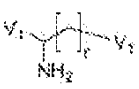
Fórmula IIIc



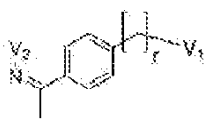
Fórmula IIId



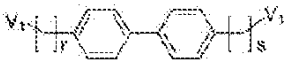
Fórmula IIIe



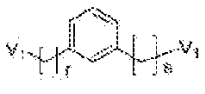
Fórmula IIIf



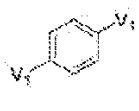
Fórmula IIIg



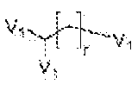
Fórmula IIIh



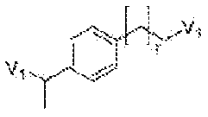
Fórmula IIIi



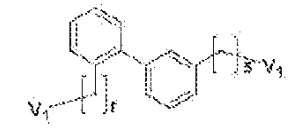
Fórmula IIIj



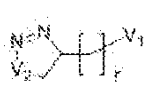
Fórmula IIIk



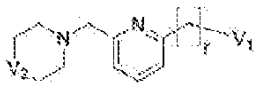
Fórmula IIIl



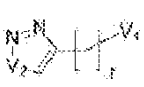
Fórmula IIIm



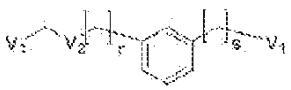
Fórmula IIIn



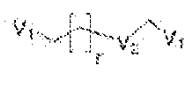
Fórmula IIIo



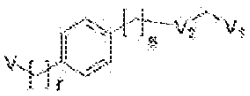
Fórmula IIIp



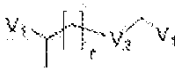
Fórmula IIIq



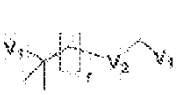
Fórmula IIIr



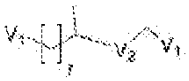
Fórmula IIIs



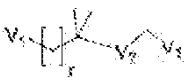
Fórmula IIIt



Fórmula IIIu



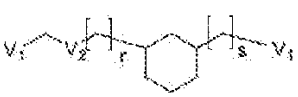
Fórmula IIIv



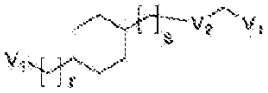
Fórmula IIIw



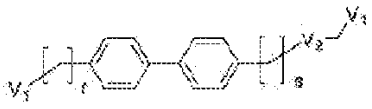
Fórmula IIIx



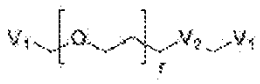
Fórmula IIIy



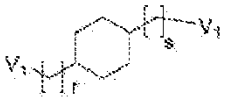
Fórmula IIIz



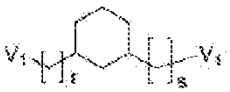
Fórmula IIIaa



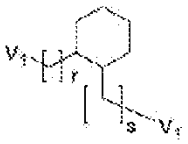
Fórmula IIIab



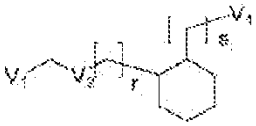
Fórmula IIIac



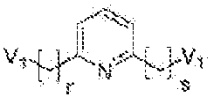
Fórmula IIIad



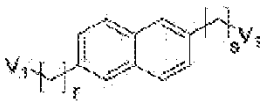
Fórmula IIIae



Fórmula IIIaf



Fórmula IIIag



Fórmula IIIah

y



Fórmula IIIai ;

en donde:

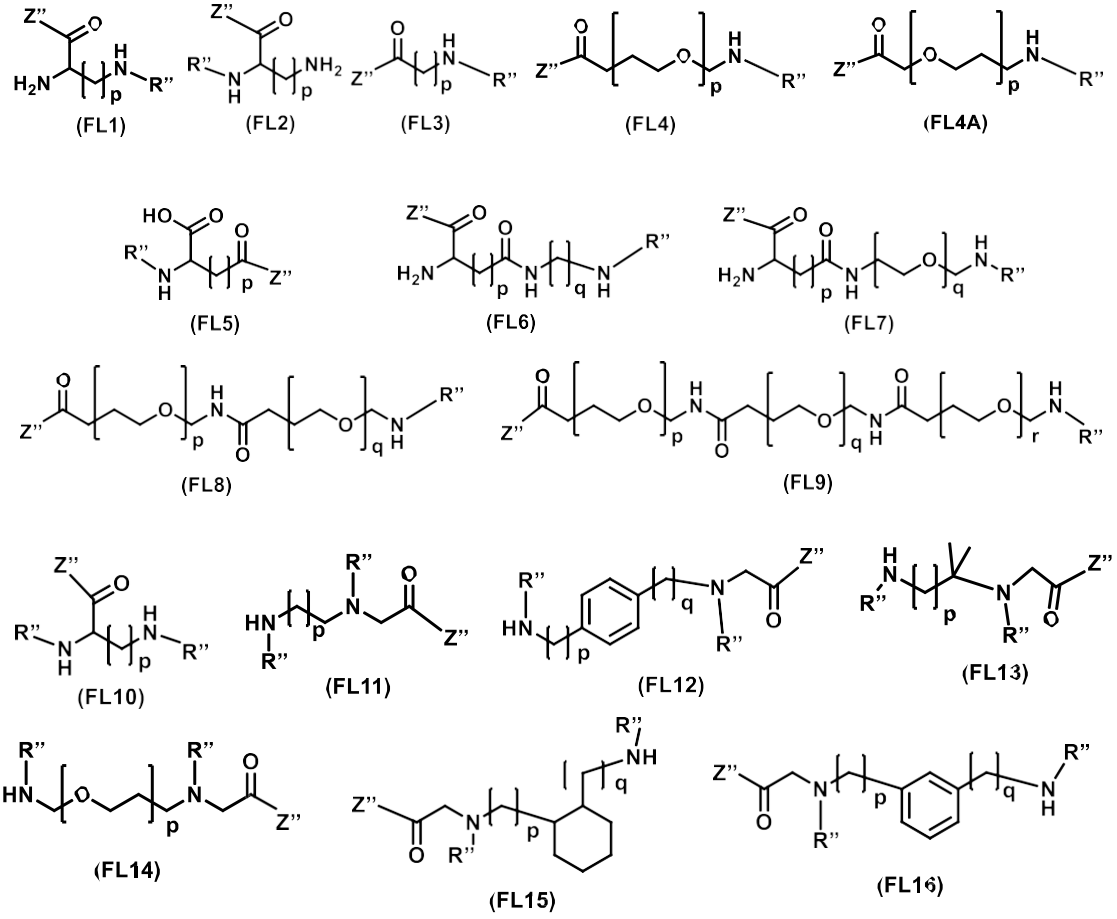
r es 1, 2, 3, 4, o 5;

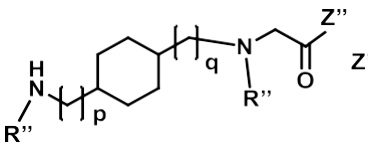
s es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cada V_1 se selecciona independientemente de NH---†, CH_2---†, y (C=O)---† y cada V_2 es N---†, en donde ---† es un enlace covalente hacia Z1b, Z1a o Z1c sucesivo, siempre que V_1 sea NH---† cuando se conecta a Z1c; y los enlaces covalentes entre las

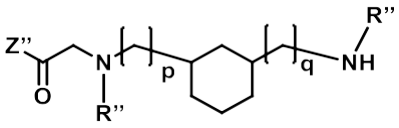
unidades Z1a y Z1b comprenden cada uno independientemente un enlace amina o una unión de amida; y cuando n'=0 y m'=1, Z1a se conjuga directamente con X1 mediante un enlace de amina o enlace amida.

82. El compuesto de la reivindicación 75, en donde el al menos un Z1c se conjuga covalentemente indirectamente mediante un enlazador seleccionado de (i) Fórmulas FL1-FL19:



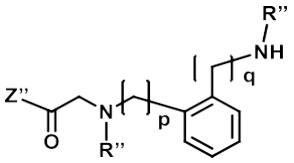


(FL17)



(FL18)

y



(FL19) ;

en donde, en las Fórmulas FL1 a FL19:

Z'' representa un punto de unión hacia X1;

R'' representa un punto de unión hacia Z1c;

p es 1, 2, 3, 4, o 5,

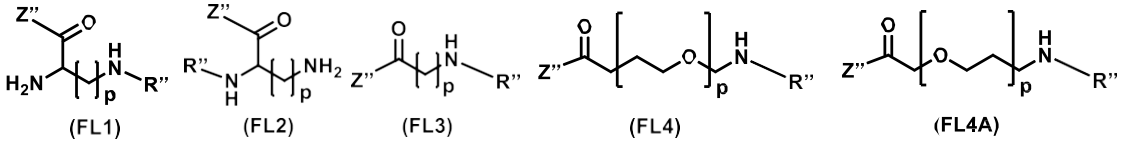
q es 1, 2, 3, 4, o 5,

r es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada; y

(ii) un aminoácido L o D que comprende al menos un grupo amina conjugado directamente con Z1c, en donde un grupo funcional ácido del aminoácido está conjugado hacia X1.

83. El compuesto de la reivindicación 75, en donde n' es 1 y cada uno de los Z1b se selecciona independientemente de (i) Fórmulas FL1-FL19:

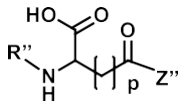

(FL1)

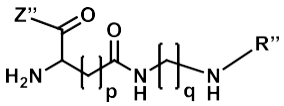
(FL2)

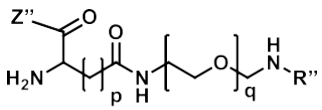
(FL3)

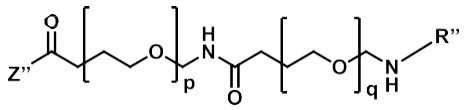
(FL4)

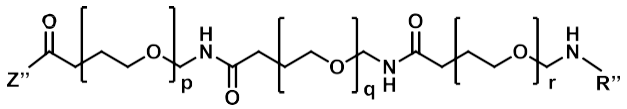
(FL4A)

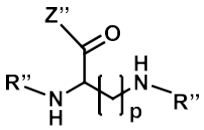

(FL5)

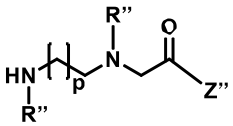

(FL6)

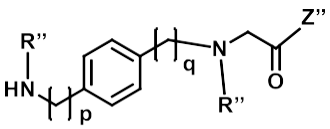

(FL7)

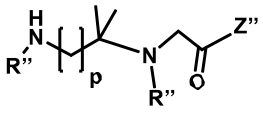

(FL8)

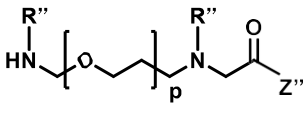

(FL9)

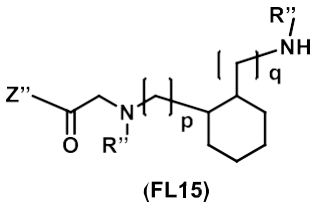

(FL10)

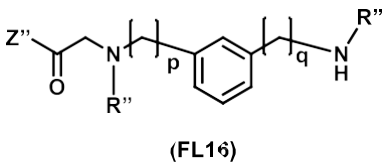

(FL11)

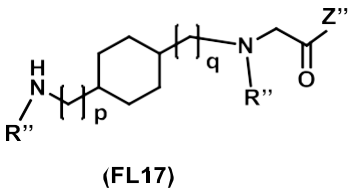

(FL12)

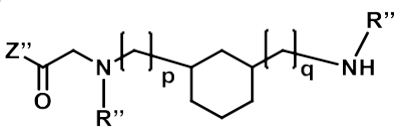

(FL13)


(FL14)

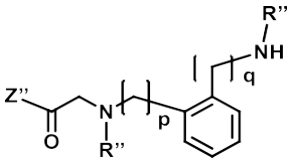

(FL15)


(FL16)


(FL17)


(FL18)

y


(FL19)

;

en donde, en las Fórmulas FL1 a FL19:

Z" representa un punto de unión hacia X1;

R" representa un punto de unión hacia Z1c;

p es 1, 2, 3, 4, o 5,

q es 1, 2, 3, 4, o 5,

r es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada; y

(ii) un aminoácido L o D que comprende al menos un grupo amina conjugado directamente con Z1c, en donde un grupo funcional ácido del aminoácido está conjugado hacia X1.

84. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde el compuesto comprende una sustancia farmacológica que comprende una hormona polipeptídica humana del páncreas humano, insulina, glucagón, GLP-1, una somatostatina, un polipéptido inhibidor gástrico, un polipéptido insulinotrópico dependiente de glucosa, un péptido híbrido que comprende secuencias de dos o más hormonas polipeptídicas humanas, o un análogo de este.

85. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde:

X1 comprende insulina humana o un análogo de insulina humana que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 1 y 3 a 33, y la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 2 y 34 a 74, 24047, y 24048;

cada Z1c se selecciona independientemente de FF1, FF10, FF12, FF14, FF15, FF114, FF115, FF116, FF163, FF193, FF194, FF203, FF221-FF231 y se conjuga covalentemente ya sea de forma directa o indirecta a través de un enlazador, con Z1a y/o Z1b, o con X1;

cada Z1a está independientemente ausente o comprende independientemente una secuencia seleccionada de K, GK, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), KGSHK

(sec. con núm. de ident.: 4238), KNSTK (sec. con núm. de ident.: 5085), GKASHK (sec. con núm. de ident.: 12414), GKEEEK (sec. con núm. de ident.: 12677), GKEEHK (sec. con núm. de ident.: 12680), GKGHSK (sec. con núm. de ident.: 13120), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050), GKGSHK (sec. con núm. de ident.: 13198), GKGSTK (sec. con núm. de ident.: 13205), GKHENK (sec. con núm. de ident.: 13271), GKNSHK (sec. con núm. de ident.: 13982), GKNSTK (sec. con núm. de ident.: 13989), GKQSSK (sec. con núm. de ident.: 14380), GKYQFK (sec. con núm. de ident.: 15128), GKGSKK (sec. con núm. de ident.: 24045), GKKPGKK (sec. con núm. de ident.: 24046), GKGPSK (sec. con núm. de ident.: 24044), GKPSHKP (sec. con núm. de ident.: 24043) y GSHKGSHK (sec. con núm. de ident.: 24042);

cada uno de dichos ligadores se selecciona de FL1, FL3, FL4 y FL5;

cada m' es independientemente 0 o 1;

cada n' es independientemente 0, 1, 2 o 3;

cada o' es independientemente 1, 2, 3, 4 o 5;

cada p' es 1, 2, 3, 4, o 5; y

q' es 1, 2, 3, o 4, en donde cuando cualquiera de n', o', p', o q' es 2 o más, los grupos correspondientes Z1a, Z1b, y Z1c se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes; y

en donde cada Z1c se conjuga independientemente de manera covalente, directa o indirectamente, con una amina de Z1a, con una amina de Z1b, o con X1.

86. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde:

X1 comprende la insulina humana o un análogo de insulina humana que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende la sec. con núm. de ident.: 1; y la cadena B se selecciona de las sec. con núms. de ident.: 2, 36, 24047, y 24048;

cada Z1c se selecciona independientemente de FF1, FF10, FF12, FF14, FF15, FF114, FF115, FF116, FF193, FF194, FF203 y FF221-FF231 y se conjuga covalentemente ya sea de forma directa o indirecta a través de un ligador, con Z1a y/o Z1b, o con X1;

cada Z1a comprende independientemente una secuencia seleccionada de K, GK, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), KGSHK (sec. con núm. de ident.: 4238), KNSTK (sec. con núm. de ident.: 5085), GKASHK (sec. con núm. de ident.: 12414), GKEEEK (sec. con núm. de ident.: 12677), GKEEHK (sec. con núm. de ident.: 12680), GKGHSK (sec. con núm. de ident.: 13120), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050), GKGSHK (sec. con núm. de ident.: 13198), GKGSTK (sec. con núm. de ident.: 13205), GKHENK (sec. con núm. de ident.: 13271), GKNSHK (sec. con núm. de ident.: 13982), GKNSTK (sec. con núm. de ident.: 13989), GKQSSK (sec. con núm. de ident.: 14380), GKYQFK (sec. con núm. de ident.: 15128), GKGSKK (sec. con núm. de ident.: 24045), GKKPGKK (sec. con núm. de ident.: 24046), GKGPSK (sec. con núm. de ident.: 24044), GKPSHKP (sec. con núm. de ident.: 24043), y GSHKGSHK (sec. con núm. de ident.: 24042);

cada uno de dichos ligadores está independientemente ausente o se selecciona independientemente de FL3 y FL5;

cada m’ es independientemente 0 o 1;

cada n’ es independientemente 0 o 2;

cada o’ es independientemente 1, 2, o 3;

cada p’ es 1, 2, o 3; y

q’ es 1, 2, o 3, en donde, cuando cualquiera de n’, o’, p’ o q’ es 2 o más, los grupos correspondientes Z1a, Z1b y Z1c se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

en donde cada Z1c se conjuga independientemente de manera covalente, directa o indirectamente, con una amina de Z1a, con una amina de Z1b, o con X1.

87. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde cada uno de los Z1a está independientemente ausente o comprende independientemente una secuencia seleccionada de K, GK, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050), KGSHK (sec. con núm. de ident.: 4238), y GKGSHK (sec. con núm. de ident.: 13198).

88. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde cada uno de los Z1c se selecciona independientemente de FF1, FF10, FF12, FF14, FF15, FF114, FF115, FF116, y FF221-FF231, y en donde el B_1 y el B_2 se seleccionan independientemente de las Fórmulas F1 y F2.

89. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 71 y 75-76, en donde el B_1 y el B_2 se seleccionan independientemente de F2 y F7.

90. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 76-78, en donde al menos un R_1 en B_1 o B_2 es F o CF_3.

91. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde Z1b está independientemente ausente, FL3, o FL5.

92. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde cada uno de los Z1c se selecciona independientemente de FF10, FF12, FF116, FF221, FF222, y FF224-FF231.

93. El compuesto de la reivindicación 76, en donde:

cada B_1 y B_2 se selecciona independientemente de F2 y F7 y se conjuga covalentemente a Z1c usando un enlace amida,

cada Z1b está independientemente ausente; FL3, en donde p es 1, 2, o 3; o FL5, en donde p es 2, 3, o 4;

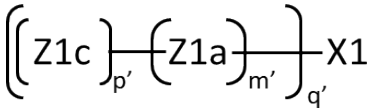
cada FF se selecciona independientemente de FF10, FF12, FF116, FF134, FF163, FF193, FF203, FF221, FF222 y FF224-FF231; en donde cada FF12 y FF222 tiene estereoquímica (*S,R*) o (*S,S*);

cada Z1c se conjuga directa o indirectamente a través de FL3 o FL5 con el grupo amina en una o más cadenas laterales de lisina en X1 o el terminal N en X1; y

X1 es una sustancia farmacológica polipeptídica y/o una insulina que tiene opcionalmente de 0 a 4 residuos reemplazados, insertados o mutados a lisinas, y en donde cada una de las lisinas se conjuga directa o indirectamente con un Z1c.

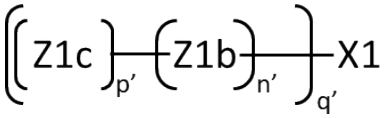
94. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde Z1c es FF224, n’ es 0, y Z1a es un aminoácido que contiene amina.

95. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 71-94, en donde el compuesto se selecciona de:



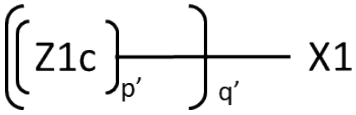
;

IA



; y

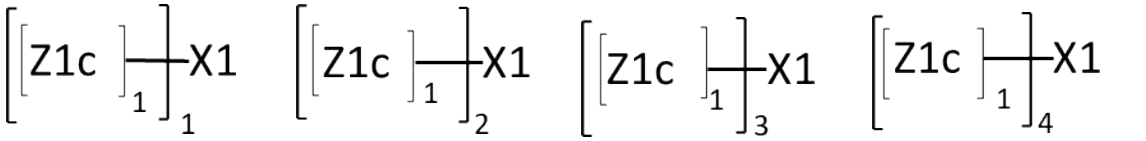
IB



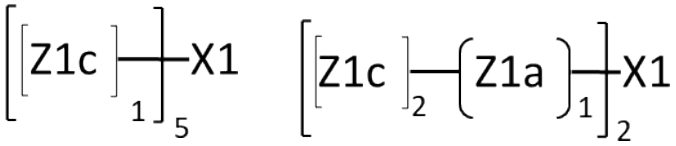
.

IC

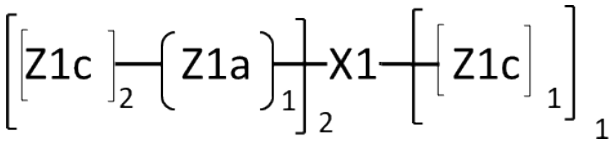
96. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 71-94, en donde el compuesto se selecciona de:


Z1c
X1

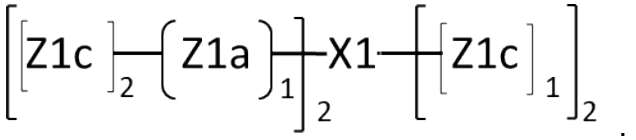
;


Z1c
Z1a
X1

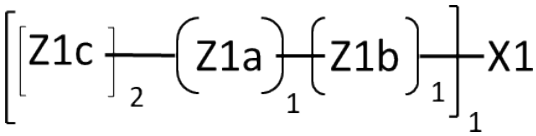
;


Z1c
Z1a
X1
Z1c

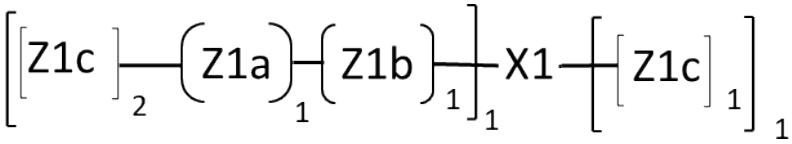
;


Z1c
Z1a
X1
Z1c

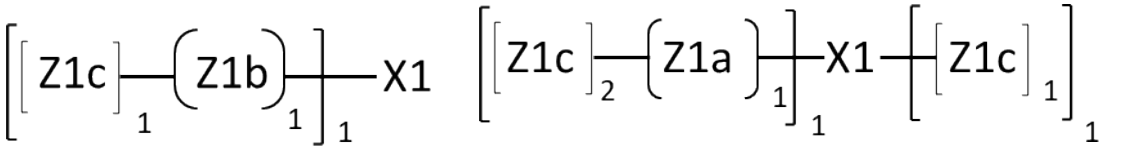
;


Z1c
Z1a
Z1b
X1

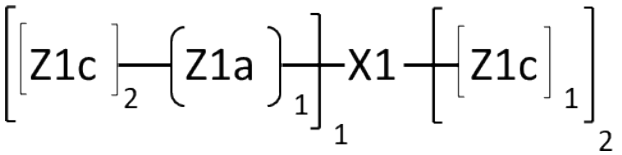
;


Z1c
Z1a
Z1b
X1
Z1c

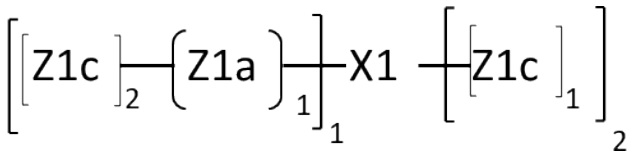
;


Z1c
Z1b
X1
Z1c
Z1a
X1
Z1c

;

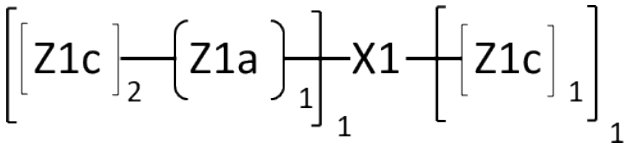


; y

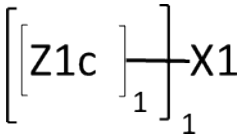


.

97. El compuesto de la reivindicación 96, en donde el compuesto se selecciona de

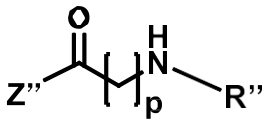


y



.

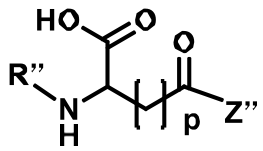
98. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde Z1c covalentemente se conjuga directamente a X1 mediante un enlazador, y en donde el enlazador se selecciona independientemente entre ácido gamma-glutámico, beta-alanina, y



(FL3)

la Fórmula FL3,

en donde p es 1, 2, o 3; y



(FL5)

la Fórmula FL5,

en donde p es 2, 3, o 4.

99. El compuesto de la reivindicación 71 o 75, en donde X1 es OH o NH_2, y el compuesto comprende además una sustancia farmacológica conjugada covalentemente directa o indirectamente con el compuesto.

100. Un tautómero, estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal, o hidrato, o derivado isotópico farmacéuticamente aceptable de este del compuesto de las reivindicaciones 66-71.

101. Un compuesto que comprende X1 y uno o más Z1c, o un tautómero, estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal o hidrato farmacéuticamente aceptable, o un derivado isotópico de estos,

en donde:

X1 comprende:

(ix) NH_2 u OH;

(x) una sustancia farmacológica que comprende una amina;

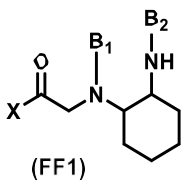
(xi) una sustancia farmacológica que se conjuga covalentemente con un enlazador que contiene amina; o

(xii) una amina configurada para conjugarse covalentemente con una sustancia farmacológica;

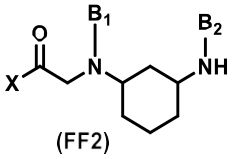
en donde cada Z1c se conjuga covalente, directa o indirectamente, con una amina en X1 o con OH cuando X1 es OH, y

en donde cada Z1c se selecciona independientemente de:

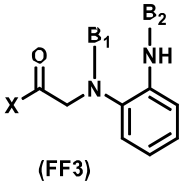
w) Fórmulas FF1-FF48, en donde las Fórmulas FF1-FF48 son:



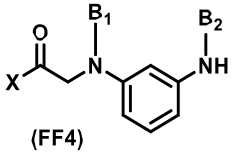
(FF1)



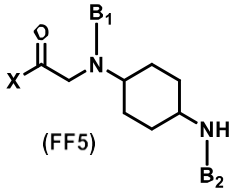
(FF2)



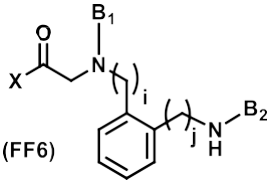
(FF3)



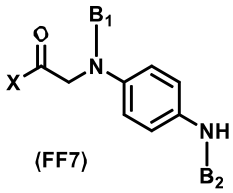
(FF4)



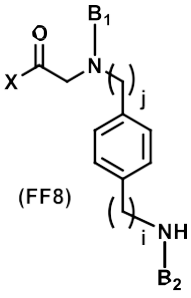
(FF5)



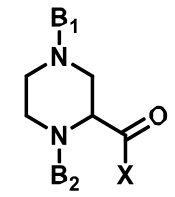
(FF6)



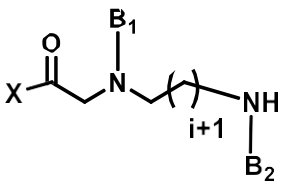
(FF7)



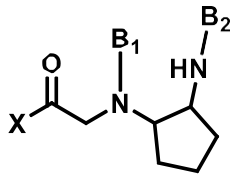
(FF8)



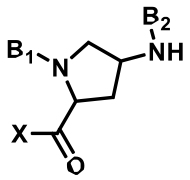
(FF9)



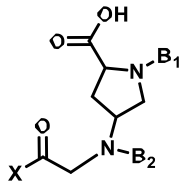
(FF10)



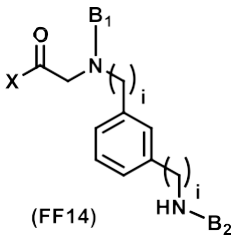
(FF11)



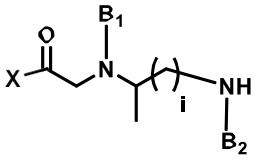
(FF12)



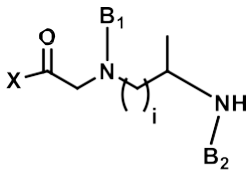
(FF13)



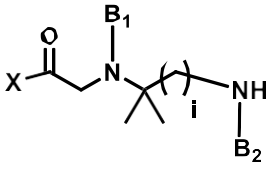
(FF14)



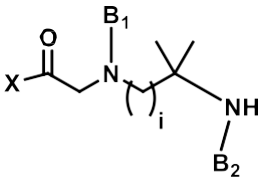
(FF15)



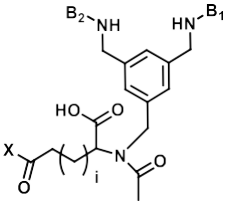
(FF16)



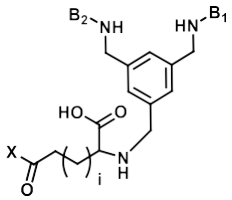
(FF17)



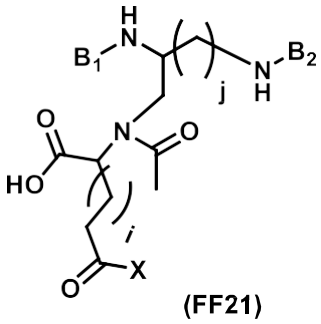
(FF18)



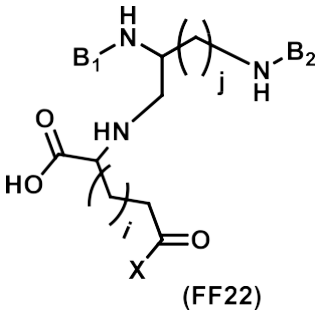
(FF19)



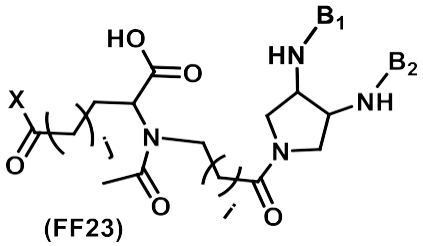
(FF20)



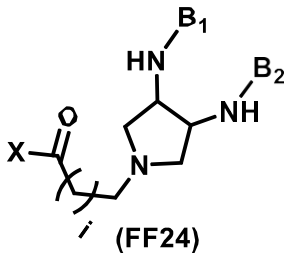
(FF21)



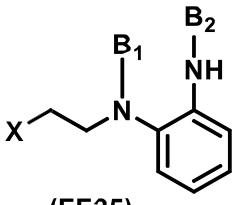
(FF22)



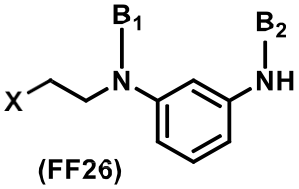
(FF23)



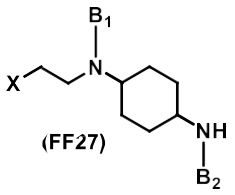
(FF24)



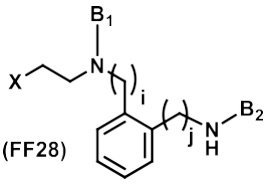
(FF25)



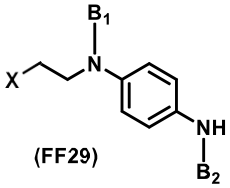
(FF26)



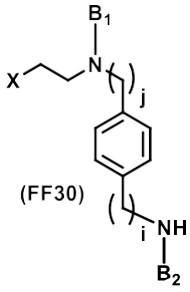
(FF27)



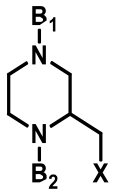
(FF28)



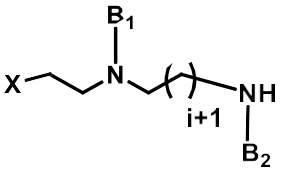
(FF29)



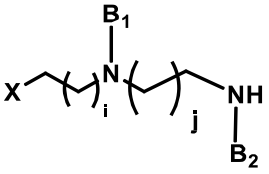
(FF30)



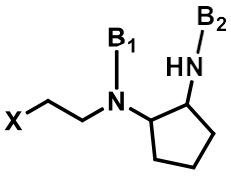
(FF31)



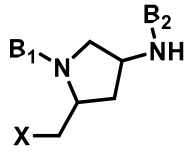
(FF32)



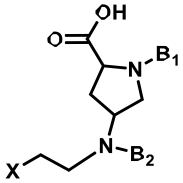
(FF33)



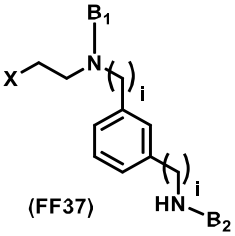
(FF34)



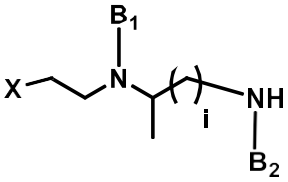
(FF35)



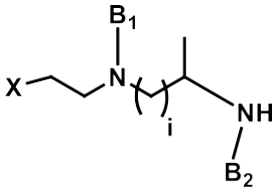
(FF36)



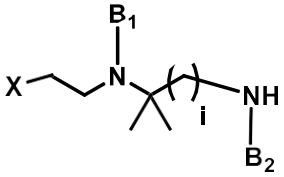
(FF37)



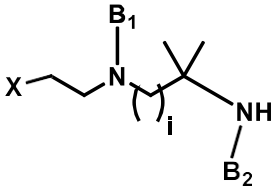
(FF38)



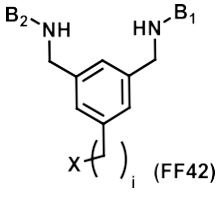
(FF39)



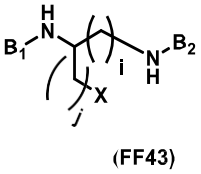
(FF40)



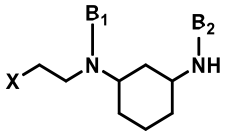
(FF41)



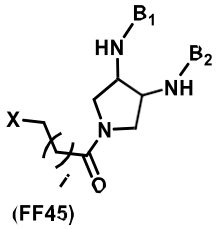
(FF42)



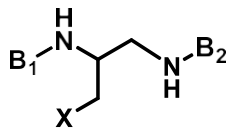
(FF43)



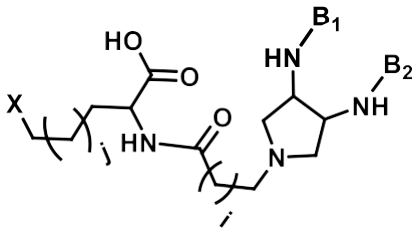
(FF44)



(FF45)

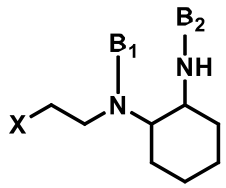


(FF46)



(FF47)

y



(FF48);

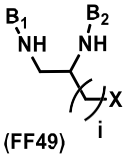
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

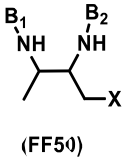
j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

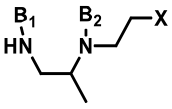
x) Fórmulas FF49-FF88, en donde las Fórmulas FF49-FF88 son:



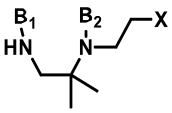
(FF49)



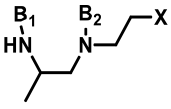
(FF50)



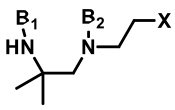
(FF51)



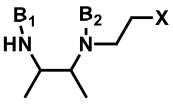
(FF52)



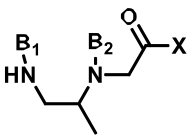
(FF53)



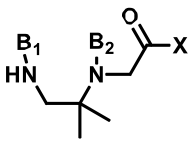
(FF54)



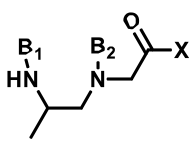
(FF55)



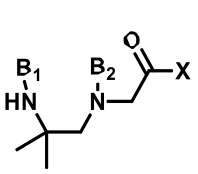
(FF56)



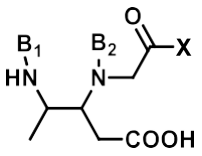
(FF57)



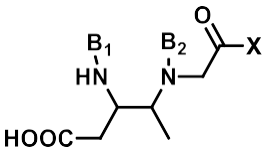
(FF58)



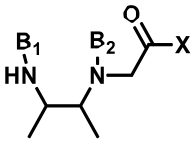
(FF59)



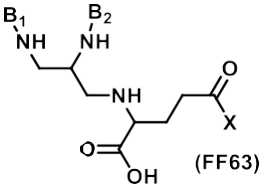
(FF60)



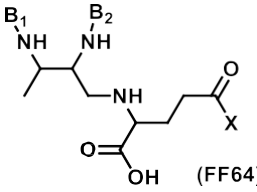
(FF61)



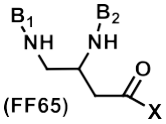
(FF62)



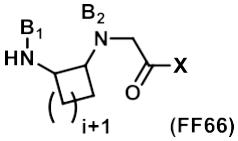
(FF63)



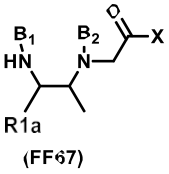
(FF64)



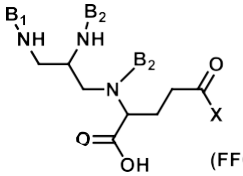
(FF65)



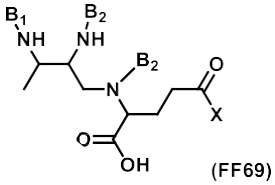
(FF66)



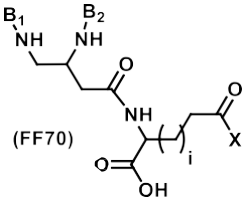
(FF67)



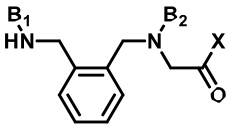
(FF68)



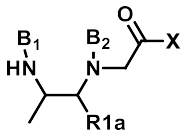
(FF69)



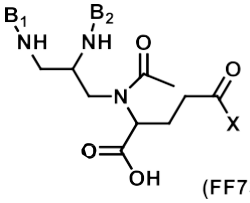
(FF70)



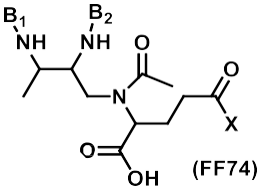
(FF71)



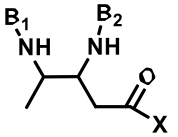
(FF72)



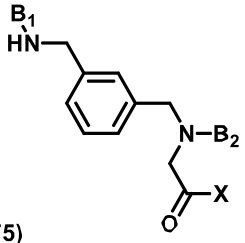
(FF73)



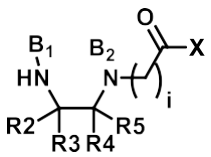
(FF74)



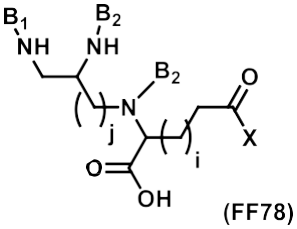
(FF75)



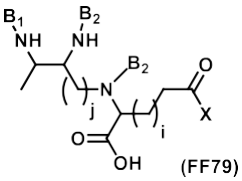
(FF76)



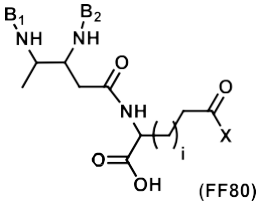
(FF77)



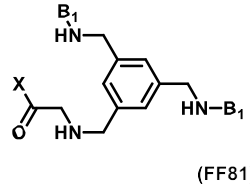
(FF78)



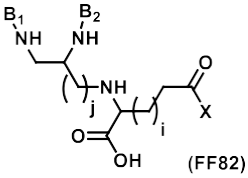
(FF79)



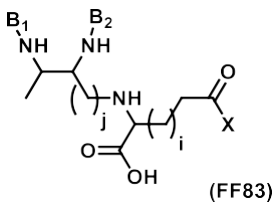
(FF80)

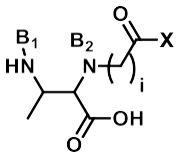


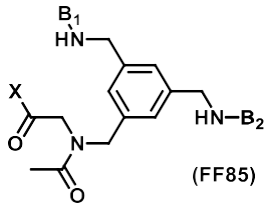
(FF81)

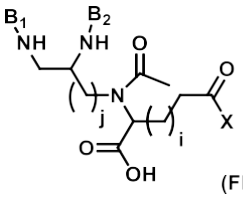


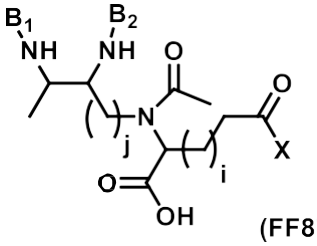
(FF82)

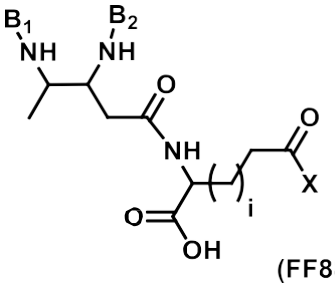

(FF83)


(FF84)


(FF85)


(FF86)


(FF87) y


(FF88);

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

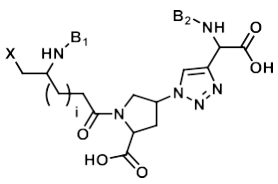
j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

R1a se selecciona de COOH, CH_3, H y OH;

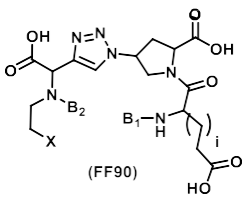
R2, R3, R4 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de CH_3, H, OH, y COOH, y al menos uno de R2, R3, R4 y R5 es CH_3 u OH; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, son cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

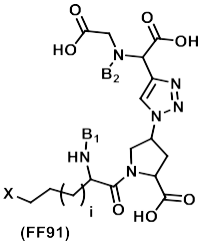
y) Fórmulas FF89-FF112, en donde las Fórmulas FF89-FF112 son:



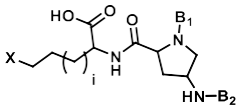
(FF89)



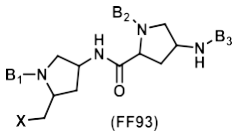
(FF90)



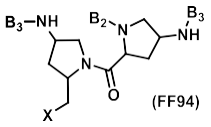
(FF91)



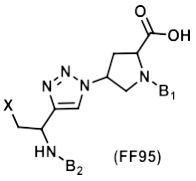
(FF92)



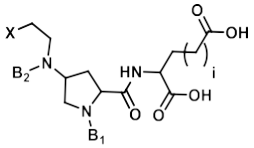
(FF93)



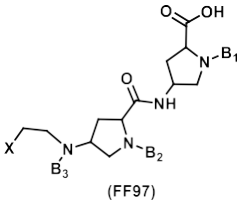
(FF94)



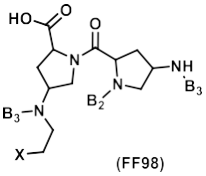
(FF95)



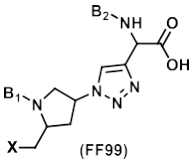
(FF96)



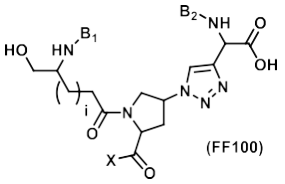
(FF97)



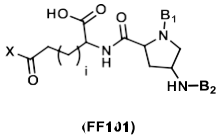
(FF98)



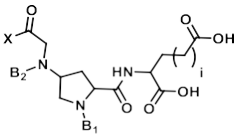
(FF99)



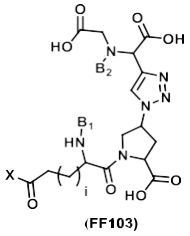
(FF100)



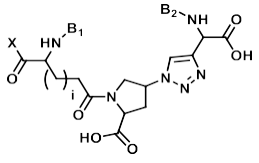
(FF101)



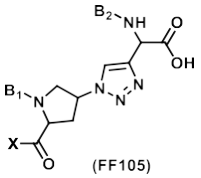
(FF102)



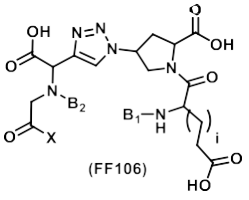
(FF103)



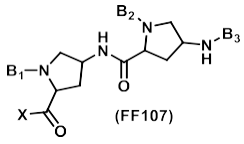
(FF104)



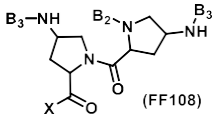
(FF105)



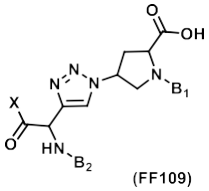
(FF106)



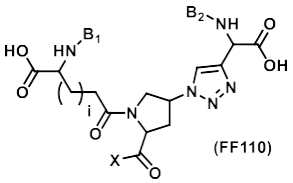
(FF107)



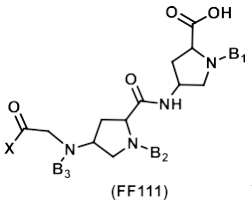
(FF108)



(FF109)

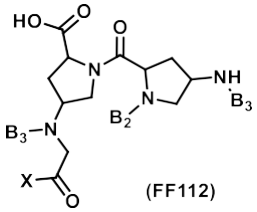


(FF110)



(FF111)

y



(FF112)

;

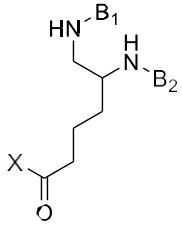
5

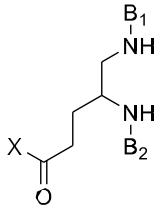
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

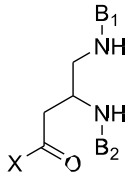
i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

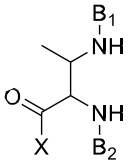
B_1, B_2 y B_3, que pueden ser idénticos o diferentes, son cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro, un derivado de ácido carboxílico o un H, en donde en cada estructura FF89-FF112 que contiene grupos B1, B2 y B3, al menos dos de los grupos B1, B2 y B3 son independientemente un grupo aromático que contiene boro;

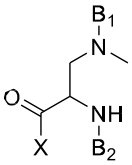
z) Fórmulas FF113-FF136, en donde las Fórmulas FF113-FF136 son:

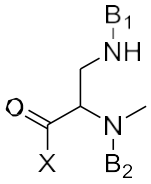

(FF113)

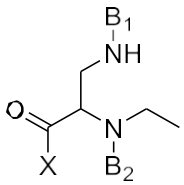

(FF114)

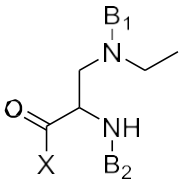

(FF115)

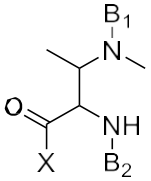

(FF116)

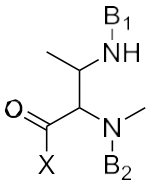

(FF117)

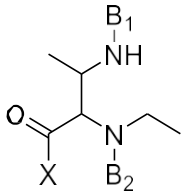

(FF118)

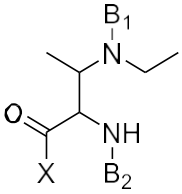

(FF119)

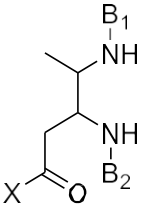

(FF120)

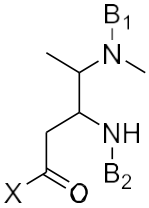

(FF121)

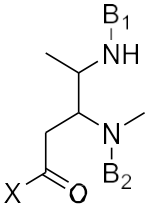

(FF122)

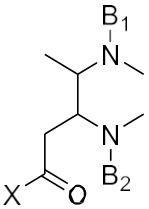

(FF123)

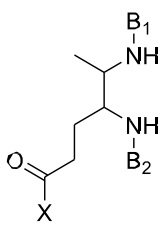

(FF124)


(FF125)

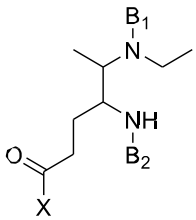

(FF126)


(FF127)

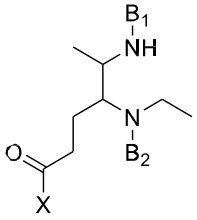

(FF128)



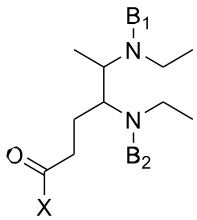
(FF129)



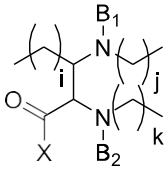
(FF130)



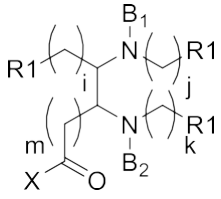
(FF131)



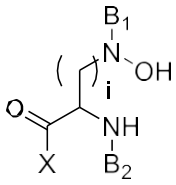
(FF132)



(FF133)

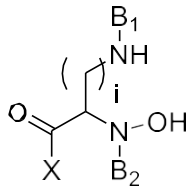


(FF134)



(FF135)

y



(FF136)

;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

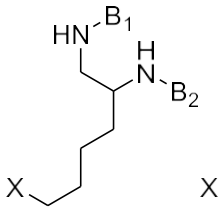
k es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

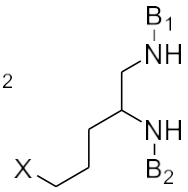
cada R1 se selecciona independientemente de H, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo, o arilo; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

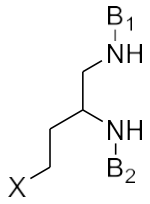
aa) Fórmulas FF137-FF160, en donde las Fórmulas FF137-FF160 son:



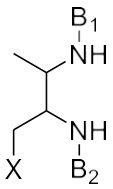
(FF137)



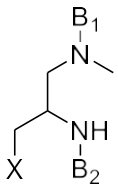
(FF138)



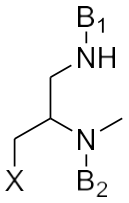
(FF139)



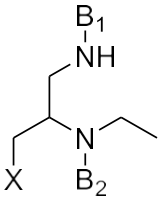
(FF140)



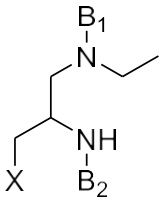
(FF141)



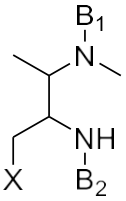
(FF142)



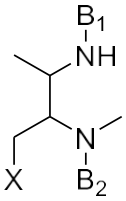
(FF143)



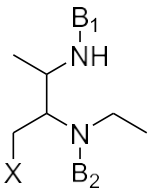
(FF144)



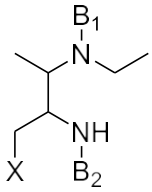
(FF145)



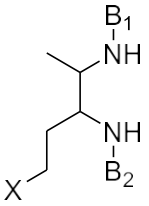
(FF146)



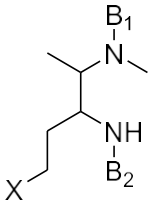
(FF147)



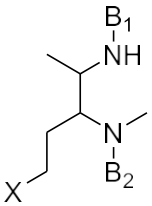
(FF148)



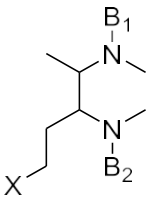
(FF149)



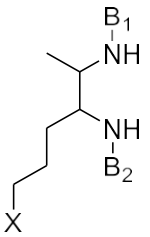
(FF150)



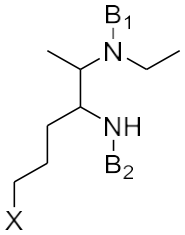
(FF151)



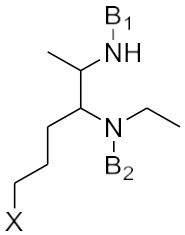
(FF152)



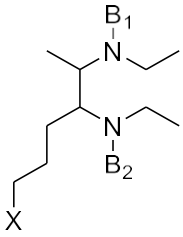
(FF153)



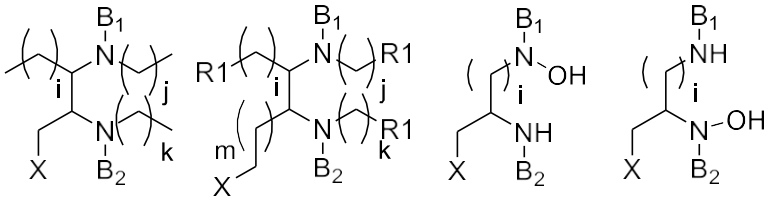
(FF154)



(FF155)



(FF156)



(FF157) (FF158) (FF159) y (FF160) ;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

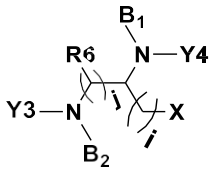
k es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

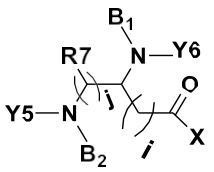
cada R1 se selecciona independientemente de H, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo, o arilo; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

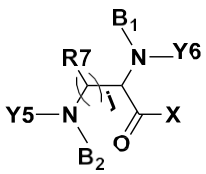
bb) Fórmulas FF161-FF164, en donde las Fórmulas FF161-FF164 son:



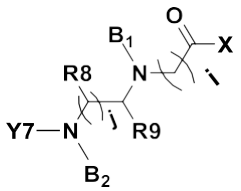
(FF161)



(FF162)



(FF163)



(FF164)

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

j es 1, 2, 3, 4, o 5;

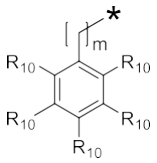
cada R6, R7, R8, y R9 para diferentes valores de j se selecciona independientemente de H, CF_3, CH_3, CHF_2 y $(CH_2)_mCH_3$, en donde m es 1, 2, 3, 4 o 5;

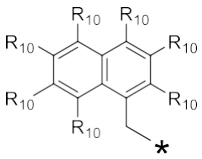
Y3, Y4, Y5, Y6 e Y7 se seleccionan cada uno independientemente de H, CH_2-X4 y las Fórmulas IV-1 a IV-135;

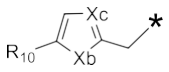
en donde X4 se selecciona de -COOH, $-(CH_2)_mCOOH$, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada X4 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo o arilo; en donde m es 1, 2, 3, 4, o 5;

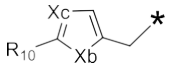
en donde al menos uno de Y5, Y6 e Y7 en las Fórmulas FF162 y FF163 no es H y al menos uno de Y7, R8 y R9 en FF164 no es H; y

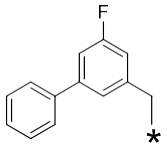
en donde las Fórmulas IV-1 a IV-135 son:

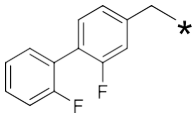

(IV-1)

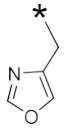

(IV-2)

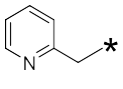

(IV-3)

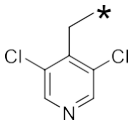

(IV-4)

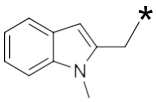

(IV-5)

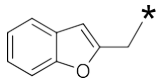

(IV-6)

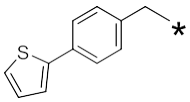

(IV-7)

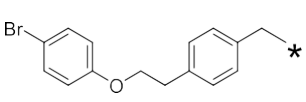

(IV-8)

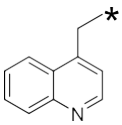

(IV-9)

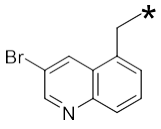

(IV-10)

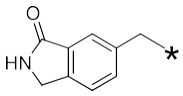

(IV-11)

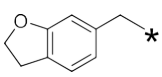

(IV-12)

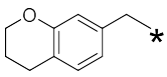

(IV-13)

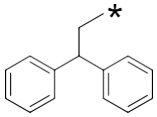

(IV-14)

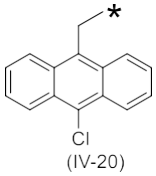

(IV-15)

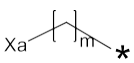

(IV-16)

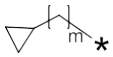

(IV-17)

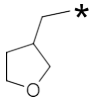

(IV-18)

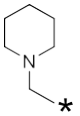

(IV-19)


(IV-20)


(IV-21)

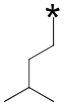

(IV-22)

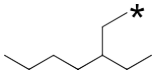

(IV-23)

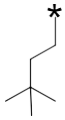

(IV-24)


(IV-25)

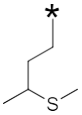

(IV-26)

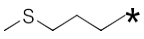

(IV-27)

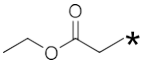

(IV-28)

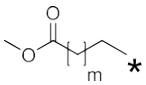

(IV-29)

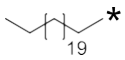

(IV-30)

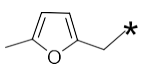

(IV-31)

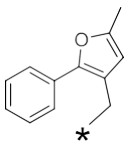

(IV-32)

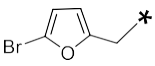

(IV-33)

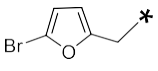

(IV-34)

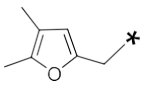

(IV-35)


(IV-36)


(IV-37)


(IV-38)


(IV-39)


(IV-40)

(IV-41)

(IV-42)

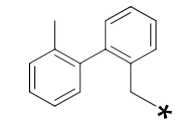
(IV-43)

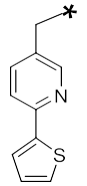
(IV-44)

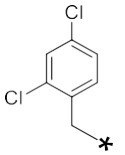
(IV-45)

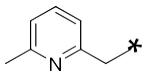
(IV-46)

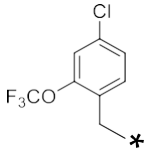
(IV-47)

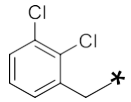

(IV-48)

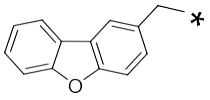

(IV-49)

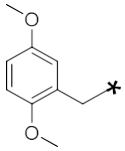

(IV-50)

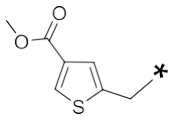

(IV-51)

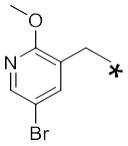

(IV-52)

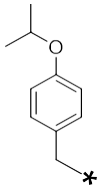

(IV-53)

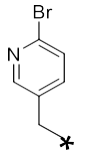

(IV-54)

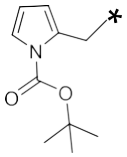

(IV-55)

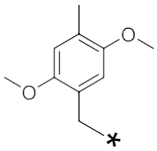

(IV-56)

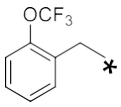

(IV-57)

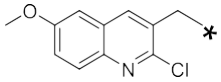

(IV-58)

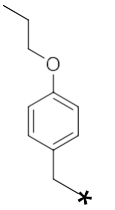

(IV-59)

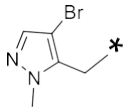

(IV-60)

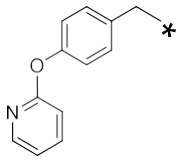

(IV-61)

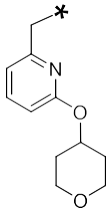

(IV-62)

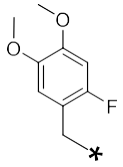

(IV-63)

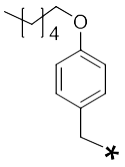

(IV-64)

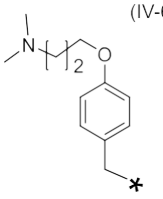

(IV-65)

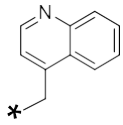

(IV-66)

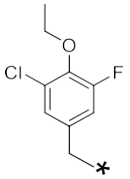

(IV-67)

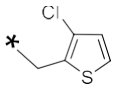

(IV-68)

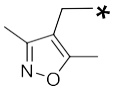

(IV-69)

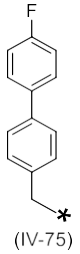

(IV-70)

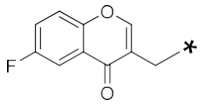

(IV-71)

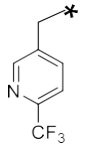

(IV-72)

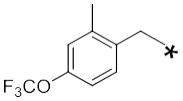

(IV-73)

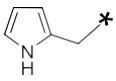

(IV-74)

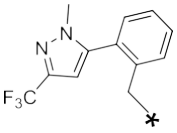

(IV-75)

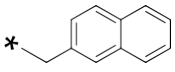

(IV-76)

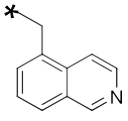

(IV-77)

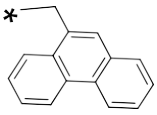

(IV-78)

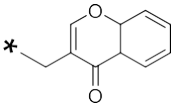

(IV-79)

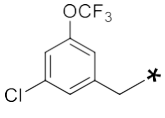

(IV-80)

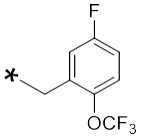

(IV-81)

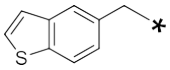

(IV-82)


(IV-83)


(IV-84)


(IV-85)

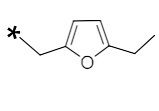

(IV-86)

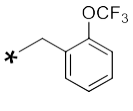

(IV-87)

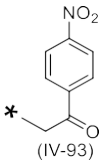
(IV-88)

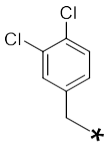
(IV-89)

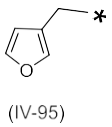
(IV-90)

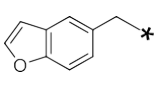

(IV-91)

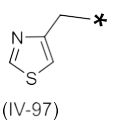

(IV-92)

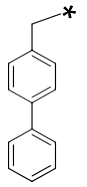

(IV-93)

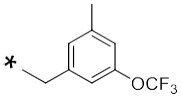

(IV-94)

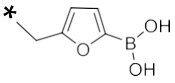

(IV-95)

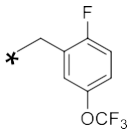

(IV-96)

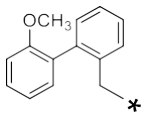

(IV-97)

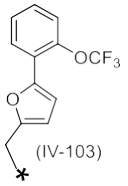

(IV-98)

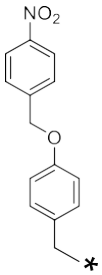

(IV-99)

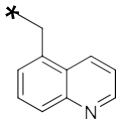

(IV-100)

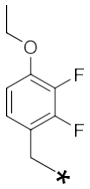

(IV-101)

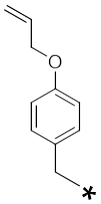

(IV-102)

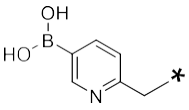

(IV-103)

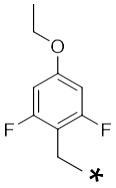

(IV-104)

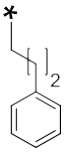

(IV-105)

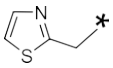

(IV-106)

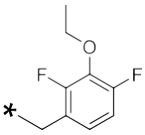

(IV-107)

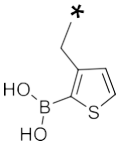

(IV-108)

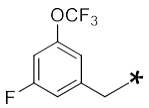

(IV-109)

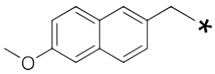

(IV-110)

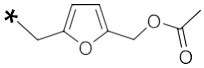

(IV-111)

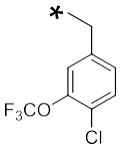

(IV-112)

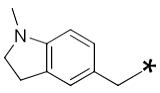

(IV-113)

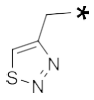

(IV-114)

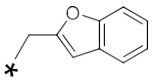

(IV-115)

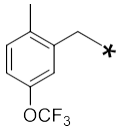

(IV-116)

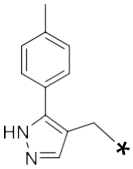

(IV-117)

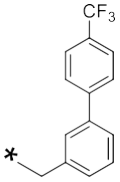

(IV-118)

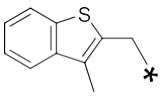

(IV-119)

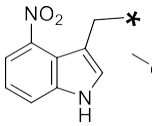

(IV-120)

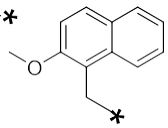

(IV-121)

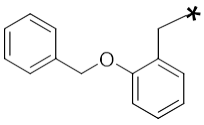

(IV-122)

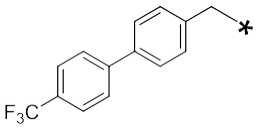

(IV-123)

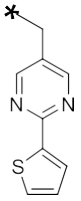

(IV-124)

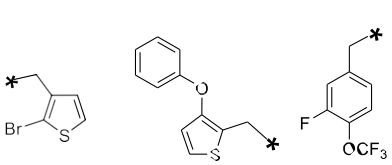

(IV-125)


(IV-126)


(IV-127)

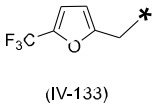

(IV-128)

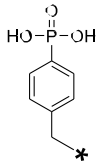

(IV-129)


(IV-130)

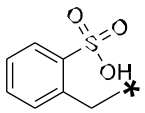
(IV-131)

(IV-132)


(IV-133)


(IV-134)

y


(IV-135)

;

en donde Xa representa CH=O, CHF_2, CF_3, CH_2SH, COOH, CH_2OH, CH_2NO_2, CH_2NH_2, CH_3, $C(CH_3)_3$, $CH(CH_3)_2$, $CH((CH_2)_3\text{-}CH_3)_2$ o $CH(CH_2\text{-}CH_3)_2$;

Xb representa O, NH, CH_2, o S;

Xc representa CH o N;

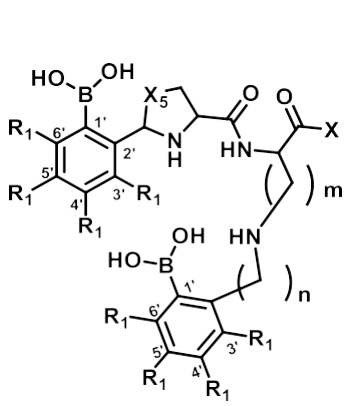
cada R_{10} se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, CH_3, CF_3, CH=O, OH, COOH, y $(CH_2)_nCH_3$,

m es 1, 2, 3, 4, o 5; y n es 1, 2, 3, 4, o 5;

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

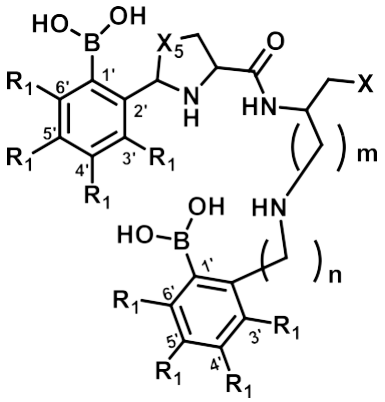
* en las Fórmulas IV-1 a IV-135 representa un punto de unión a las Fórmulas FF161-164 correspondientes;

cc) Fórmulas FF165-FF166, en donde las Fórmulas FF165-FF166 son:



(FF165)

y



(FF166)

;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

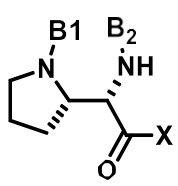
m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

n es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

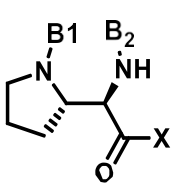
X5 es S, O, o NH; y

cada R_1 se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH$ CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

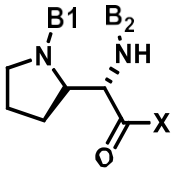
dd) Fórmulas FF167-FF192, en donde las Fórmulas FF167-FF192 son:



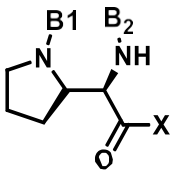
(FF167)



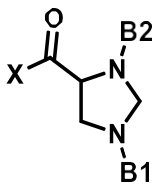
(FF168)



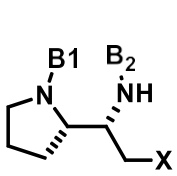
(FF169)

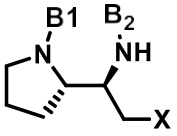


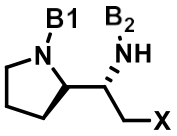
(FF170)

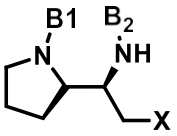


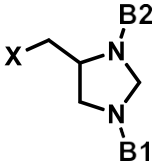
(FF171)

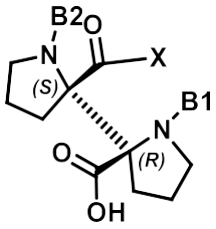

(FF172)

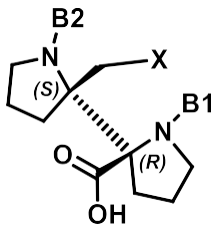

(FF173)

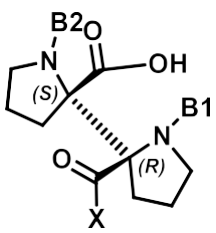

(FF174)

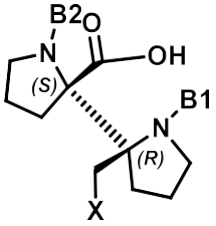

(FF175)

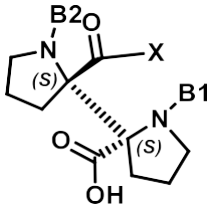

(FF176)

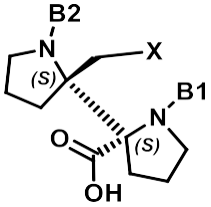

(FF177)

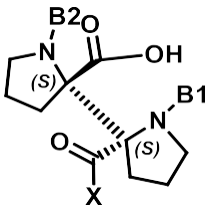

(FF178)

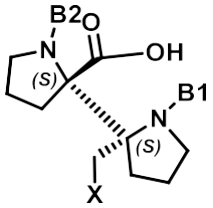

(FF179)

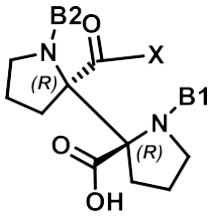

(FF180)

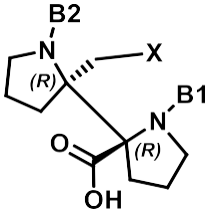

(FF181)

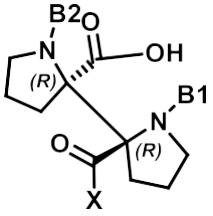

(FF182)

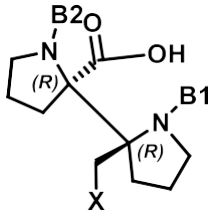

(FF183)

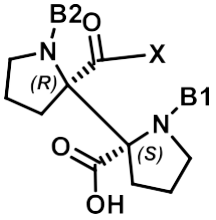

(FF184)

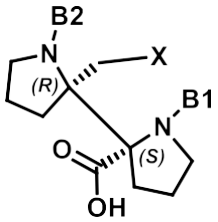

(FF185)

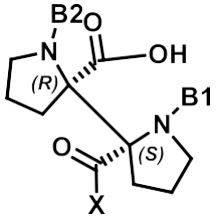

(FF186)


(FF187)

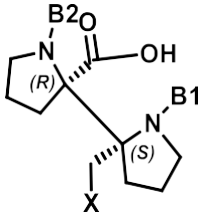

(FF188)


(FF189)


(FF190)


(FF191)

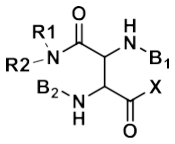
y

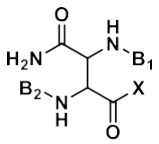

(FF192) ;

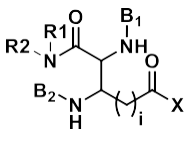
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

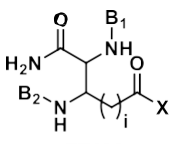
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

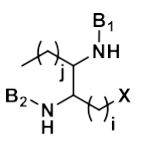
ee) Fórmulas FF193-FF209, en donde las Fórmulas FF193-FF209 son:

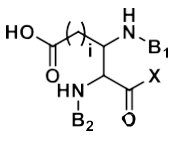

FF193

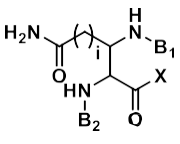

FF194

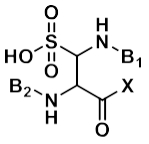

FF195

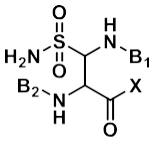

FF196

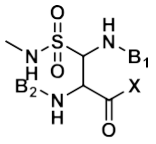

FF197

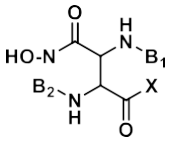

FF198

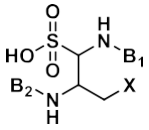

FF199

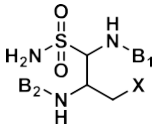

FF200

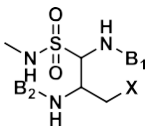

FF201

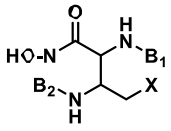

FF202

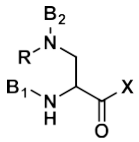

FF203

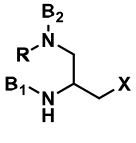

FF204


FF205


FF206


FF207


FF208


FF209

;

en donde R en FF208 y FF209 es un alquilo, arilo o haluro que se conjuga covalentemente a través de al menos un grupo CH_2 con el grupo amino en la cadena lateral de FF208 o FF209,

R1 y R2 se seleccionan independientemente de H, CH_3, alquilo y las Fórmulas IV-1 a IV-135;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

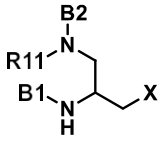
j es 1, 2, 3, 4, o 5; y

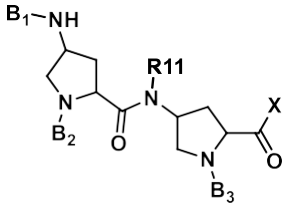
en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH; y

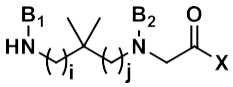
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

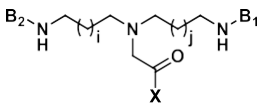
ff) Fórmulas FF210-FF224, en donde las Fórmulas FF210-FF224 son:

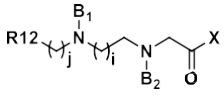

FF210

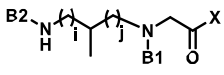

FF211

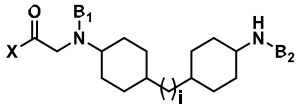

FF212

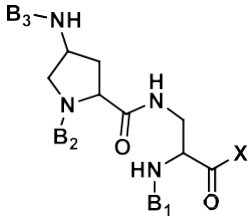

FF213

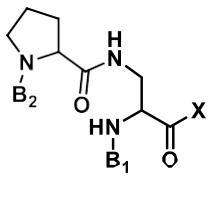

FF214

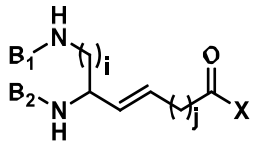

FF215

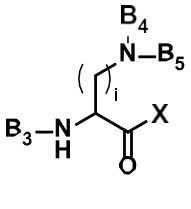

FF216


FF217


FF218

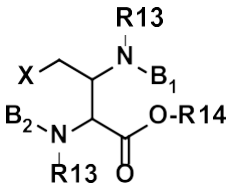

FF219


FF220


FF221



FF222



FF223



, y FF224;

en donde R11 en FF210 a FF212 se selecciona de las Fórmulas IV-1 a IV-135 y R12 se selecciona de una amina, un hidroxilo, un alquilo, y un grupo haluro;

en donde cada R13 se selecciona independientemente de H, CH_3, alquilo, arilo y las Fórmulas IV-1 a IV-135; R14 se selecciona de H, CH_3, alquilo, arilo y heteroarilo;

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

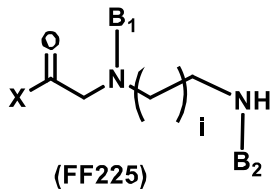
X'' representa un punto de unión covalente a una amina --N en el compuesto, en donde -- representa un enlace covalente único a un grupo CH_2 o CH en el compuesto;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

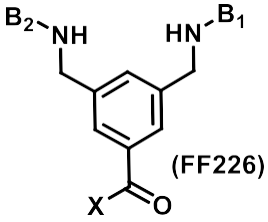
j es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cada uno de B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6 representa independientemente un grupo aromático que contiene boro, en donde en cada estructura FF que contiene grupos B_1, B_2 y B_3, al menos dos de los grupos B1, B2 y B3 son independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

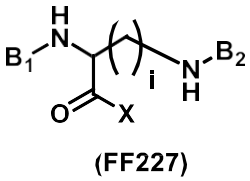
gg) Fórmulas FF225-FF231, en donde las Fórmulas FF225-FF231 son:



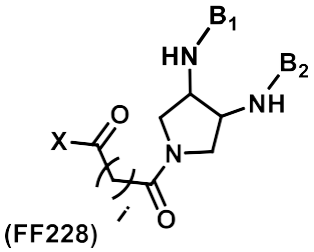
(FF225)



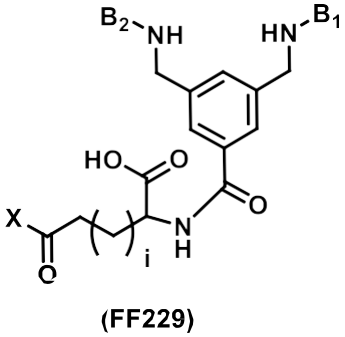
(FF226)



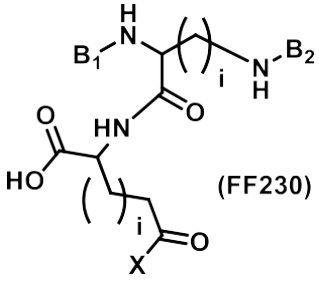
(FF227)



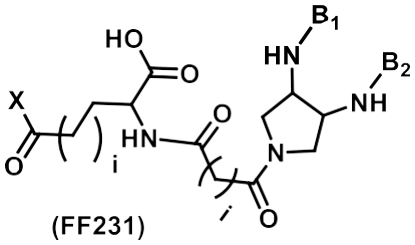
(FF228)



(FF229)



(FF230)



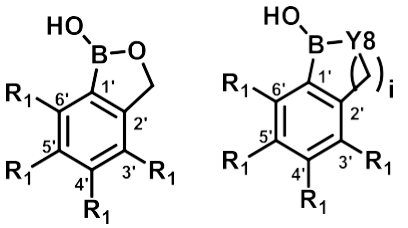
(FF231)

en donde X representa un punto de unión covalente ya sea directamente a una amina en X1 o a una amina que está conjugada de manera covalente directa o indirectamente con X1, o con OH cuando X1 es OH;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, cada uno representa independientemente un grupo aromático que contiene boro, en donde B_1 y B_2 en las Fórmulas FF225-FF231 no son un ácido borónico o un grupo aromático que contiene boro F2 o F6,

en donde las Fórmulas F2 y F6 son:



(F2) y (F6) ;

R_1 en la posición 4’ o la posición 5’ representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c;

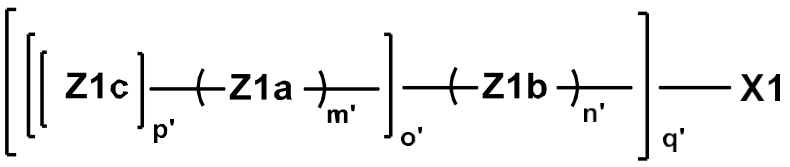
cero, uno, o dos R_1 representa F, Cl, CF_2, CF_3, SF_5, OCF_3, SO_2CH_3, y/o SO_2CF_3, y cada R_1 restante representa H;

Y8 es O; y

i es 1; y

en donde al menos una amina primaria o secundaria en FF1-FF223 y FF225-231 se conjuga covalentemente con B_6.

102. El compuesto de la reivindicación 101, en donde el compuesto es un conjugado molecular representado por la siguiente fórmula, o un estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros, o una sal farmacéuticamente aceptable de este:



,

caracterizados porque

X1 comprende:

(v) NH_2 u OH,

(vi) una sustancia farmacológica polipeptídica que comprende una amina,

(vii) una sustancia farmacológica polipeptídica que se conjuga covalentemente con un enlazador que contiene amina, o

(viii) una amina configurada para conjugarse covalentemente con una sustancia farmacológica polipeptídica;

cada Z1c se selecciona independientemente de las Fórmulas FF1-FF231;

cada Z1a comprende independientemente de 1 a 50 aminoácidos conectados entre sí mediante enlaces amida o peptídicos;

cada Z1b es independientemente un enlazador de molécula pequeña;

cada m’ es independientemente 0 o 1;

cada n' es independientemente 0 o un número entero positivo;

cada o’ es independientemente un número entero mayor o igual a 1;

cada p’ es un número entero positivo; y

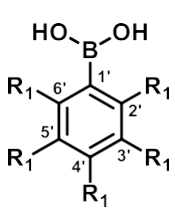
q’ es un número entero positivo de al menos 1 y no más de dos veces la cantidad total de grupos amina en X1, en donde, cuando cualquiera de n’, o’, p’ o q’ es 2 o más, los grupos correspondientes Z1a, Z1b y Z1c se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

en donde cada Z1c se conjuga independientemente de manera covalente, directa o indirectamente, con una amina de Z1a, con una amina de Z1b, o con X1; y

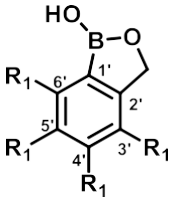
en donde opcionalmente el conjugado molecular puede comprender uno o más isótopos en cualquier posición del conjugado molecular.

103. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde el compuesto comprende al menos uno de B_1, B_2 y B_3 seleccionados independientemente de las Fórmulas F1-F11 o en donde el compuesto comprende al menos uno de B_4, B_5 y B_6 seleccionados independientemente de las Fórmulas F1-F11,

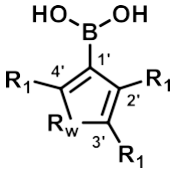
en donde las Fórmulas F1-F11 son:



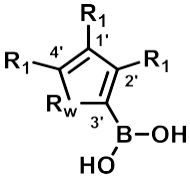
(F1)



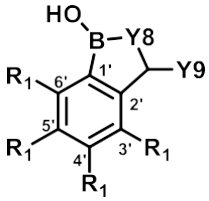
(F2)



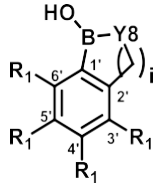
(F3)



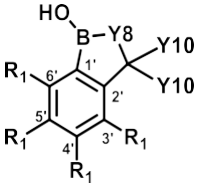
(F4)



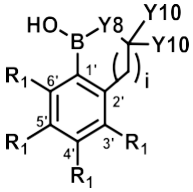
(F5)



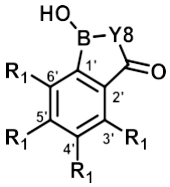
(F6)



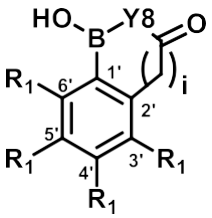
(F7)



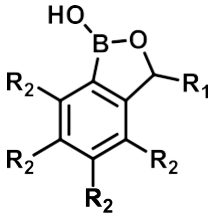
(F8)



(F9)



(F10), y



(F11);

en donde para B_1, B_2 y B_3:

un R_1 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde,

para las Fórmulas F3-F4:

R_w es O o S;

para las Fórmulas F5-F10:

cuando Y8 es O, i es 1, 2, 3, 4, o 5; o

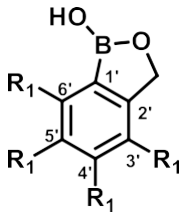
cuando Y8 es NR, R es un grupo alquilo o H, e i es 1, 2, 3, 4, o 5;

Y9 es H, CH_3 o un grupo alquilo, siempre que, cuando Y8 es O, Y9 sea un CH_3 o un grupo alquilo; y

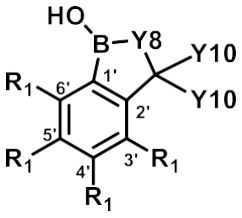
cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, CF_3, y OCH_3, con la condición de que al menos un Y10 no sea H.

104. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-103, en donde el compuesto comprende al menos un grupo seleccionado de B_1, B_2, B_3 B_4, B_5 y B_6, cada uno independientemente seleccionado de las Fórmulas F2, F7, F8, y F11,

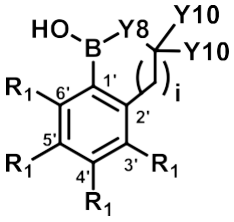
en donde las Fórmulas F2, F7, F8, y F11 son:



(F2)

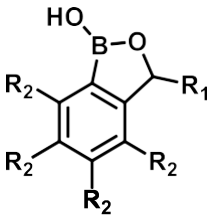


(F7)



(F8)

, y



(F11)

;

en donde para B_1, B_2 y B_3:

un R_1 representa (C=O)---* o $(CH_2)_m$(C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

en donde para la Fórmula F7:

Y8 es O o NR, en donde R es un grupo alquilo o H; y

cada Y10 se selecciona independientemente de CH_3, F, CF_3, y OCH_3;

en donde para la Fórmula F8:

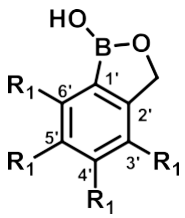
cuando Y8 es O, i es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cuando Y8 es NR, R es un grupo alquilo o H, e i es 1, 2, 3, 4, o 5;

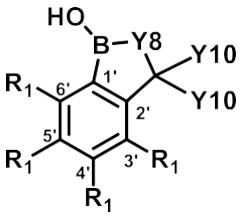
cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, CF_3, y OCH_3, con la condición de que al menos un Y10 no sea H; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

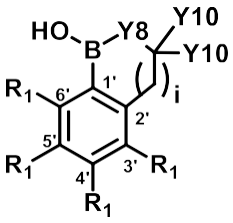
105. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-104, en donde el compuesto comprende al menos un grupo seleccionado de B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6, cada uno independientemente seleccionado de:



(F2)

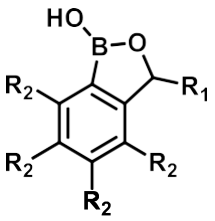


(F7)



(F8)

, y



(F11)

;

en donde para B_1, B_2 y B_3:

un R_1 representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3,

$O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para la Fórmula F7:

Y8 es O; y

cada Y10 se selecciona independientemente de CH_3, F, y CF_3;

en donde para la Fórmula F8:

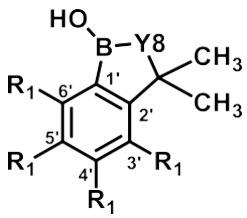
Y8 es O;

i es 1, 2, 3, 4 o 5; y

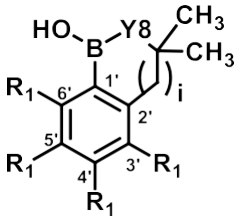
cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, y CF_3, con la condición de que al menos un Y10 no sea H; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

106. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-105, en donde el compuesto comprende al menos un grupo seleccionado de B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6, cada uno independientemente seleccionado de:

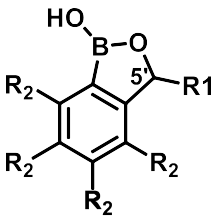


(F7A)



(F8A)

, y



(F11)

;

en donde para B_1, B_2 y B_3:

R_1 en la posición 5' representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para la Fórmula F7A:

Y8 es O; y

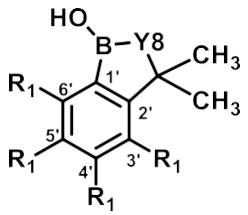
en donde para la Fórmula F8A:

Y8 es O; y

i es 1, 2, 3, 4 o 5; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

107. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-106, en donde B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6 son cada una independientemente la Fórmula F7A,



(F7A) ,

en donde para B_1, B_2 y B_3:

R_1 en la posición 5' representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4 y B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto de $Z1_C$ y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa un punto de unión al resto de $Z1_C$, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3,

$O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

cada R_1 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —$(SO_2)NH\ CH_3$, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

Y8 es O; y

--- representa un punto de unión al resto de Z1c.

108. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-107, en donde al menos un Z1c covalentemente se conjuga indirectamente mediante un enlazador a una amina de X1 o a NH_2 cuando X1 es NH_2 o a OH cuando X1 es OH o a una amina de Z1a,

en donde el enlazador se representa por la Fórmula $(X'')_{n1}$, en donde

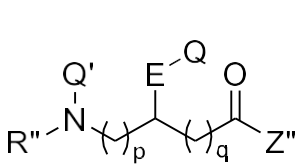
cada n1 se selecciona independientemente de 1, 2, 3, 4, y 5, y

cada X" se selecciona independientemente de:

c) un aminoácido L o D, en donde un grupo funcional amina del aminoácido L o D se conjuga covalentemente, directa o indirectamente, con Z1c y un grupo funcional ácido del aminoácido L o D se conjuga, directa o indirectamente, a X1 o a Z1a; y

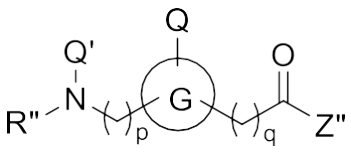
d) las fórmulas FL(IA), FL(IB), FL69 y FL70;

en donde las Fórmulas FL(IA) y FL(IB) son:



FL(IA)

,



FL(IB)

, y estereoisómeros de este;

en donde:

G se selecciona de un grupo cicloalquilo de 3 a 6 miembros, un grupo heterociclilo de 3 a 10 miembros, un grupo heteroarilo, y un grupo arilo, en donde cada grupo se sustituye opcionalmente con 1-3 grupos seleccionados independientemente de hidroxi, amino, halógeno, cicloalquilo, alcoxi, y alquilo;

E está ausente o es un grupo alquileno opcionalmente sustituido con 1-3 grupos seleccionados independientemente de halógeno, hidroxi, y amino;

Q está ausente o se selecciona de hidrógeno, alquilo, halo, ciano, alcoxi, ácido carboxílico, amino, hidroxi, amida, haloalquilo, cicloalquilo, heterociclo, heteroarilo y arilo, en donde el alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterociclo, heteroarilo, y cada arilo está opcionalmente sustituido con 1-5 grupos seleccionados independientemente de alquilo, amino, amida, halo, hidroxi, ciano, haloalquilo y alcoxi;

Q' se selecciona de hidrógeno, alquilo y un grupo acilo;

Q y Q', junto con el átomo de carbono y nitrógeno al que están unidos, forman opcionalmente un heterociclilo de 4 miembros, un heterociclilo de 5 miembros, un heterociclilo de 6 miembros, un heterociclilo bicíclico de 9 miembros o un heterociclilo de 10 miembros. heterociclilo bicíclico, en donde el heterociclilo de 4 miembros, el heterociclilo de 5 miembros, el heterociclilo de 6 miembros, el heterociclilo bicíclico de 9

miembros y el heterociclilo bicíclico de 10 miembros están opcionalmente sustituidos con 1-5 grupos seleccionados independientemente de alquilo, amino, halo, hidroxi, ciano, amida, haloalquilo y alcoxi;

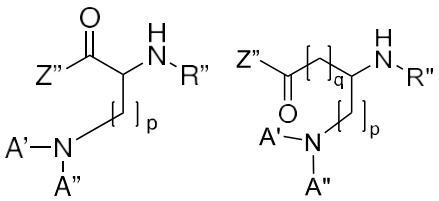
p es 0, 1, 2, 3, 4, o 5;

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

R” representa un enlace covalente, directo o indirecto, a Z1c;

Z'' representa un enlace covalente, directa o indirectamente, con X1 o con Z1a; y cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada;

en donde las Fórmulas FL69 y FL70 son:



FL69 , FL70 , y estereoisómeros de este;

en donde:

R'' representa un enlace covalente, directo o indirecto, a Z1c;

Z'' representa un enlace covalente, directo o indirecto, con X1 o con Z1a;

A' se selecciona de H, un alquilo, un ácido graso saturado, un ácido graso insaturado, un cicloalquilo, un haloalquilo, un arilo, y un heteroarilo; y

A” es

(i) un ácido biliar conjugado, directa o indirectamente, a través de su grupo ácido a la amina en FL69 o FL70; o

(ii) un grupo acilo C_2-C_{20} termina opcionalmente en un grupo ácido, en donde uno o más átomos de carbono del grupo acilo C_2-C_{20} se reemplazan opcional e

independientemente con un grupo seleccionado de C(=O), O, NH, NH_2, S, S(O), SO_2, fenilo, heterociclilo de 5 miembros, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, y en donde el uno o más átomos de carbono del grupo acilo C_2-C_{20}, NH, NH_2, SO_2, fenilo, heterociclilo de 5 miembros, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, y heteroarilo de 6 miembros se sustituye cada uno independientemente con 0, 1, 2, 3, o 4 R_x,

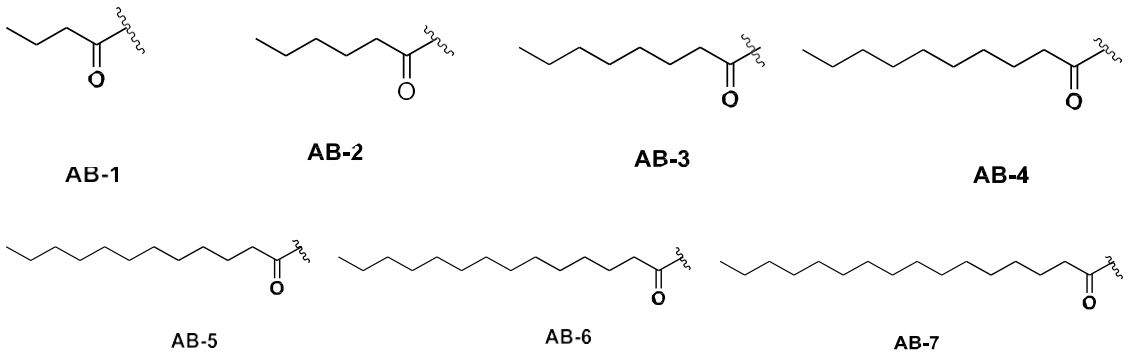
en donde R_x se selecciona de alquilo C_1-C_5, halógeno, haloalquilo C_1-C_5, ácido carboxílico, hidroxilo, -O-alquilo C_1-C_5, NH_2, y un heterociclilo de 5 miembros sustituido o no sustituido, heterociclilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, y heteroarilo de 6 miembros;

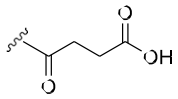
p es 1, 2, 3, 4, o 5,

q es 1, 2, 3, 4, o 5, y

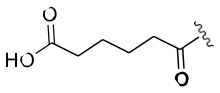
cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada.

109. El compuesto de la reivindicación 108, en donde cada A" se selecciona independientemente de:

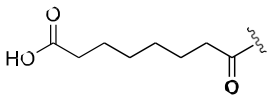




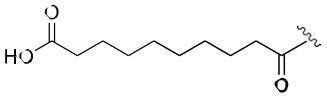
AB-8



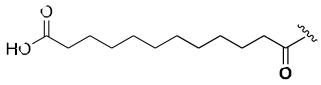
AB-9



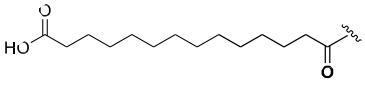
AB-10



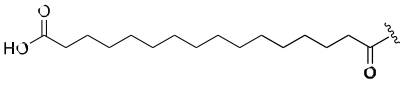
AB-11



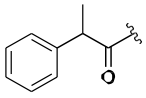
AB-12



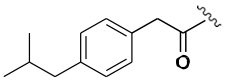
AB-13



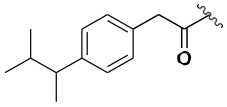
AB-14



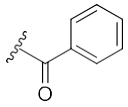
AB-15



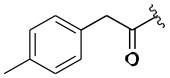
AB-16



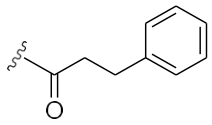
AB-17



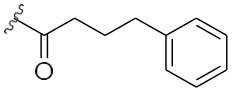
AB-18



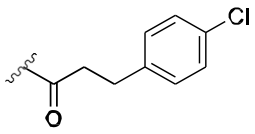
AB-19



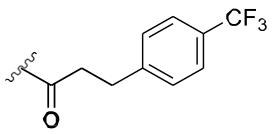
AB-20



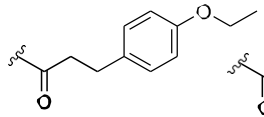
AB-21



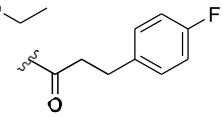
AB-22



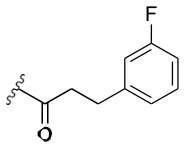
AB-23



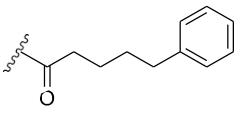
AB-24



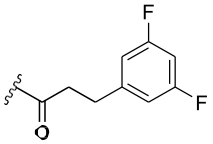
AB-25



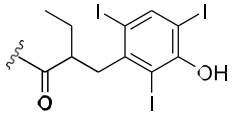
AB-26



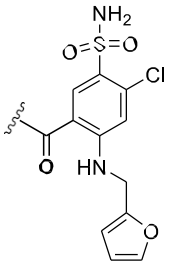
AB-27



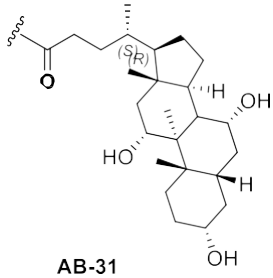
AB-28



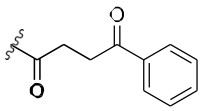
AB-29



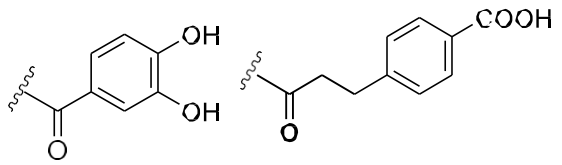
AB-30



AB-31



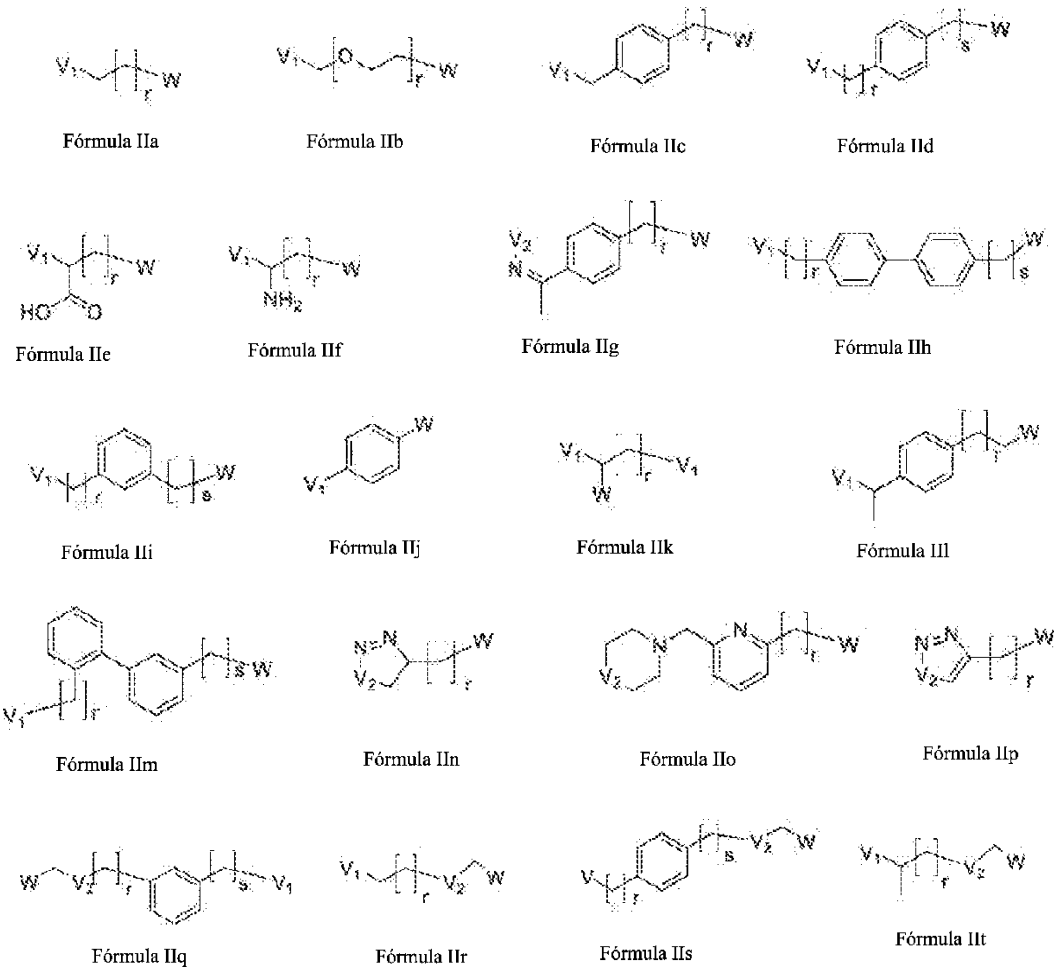
AB-32

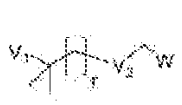


AB-33 **AB-34** , y **AB-35** .

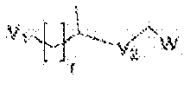
110. El compuesto de la reivindicación 102, en donde el compuesto comprende al menos un Z1b seleccionado de las Fórmulas IIa-IIai y las Fórmulas IIIa-IIIai,

en donde las Fórmulas IIa-IIai son:

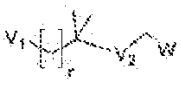




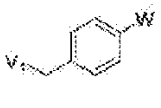
Fórmula IIu



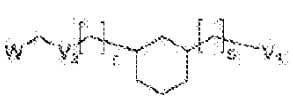
Fórmula IIv



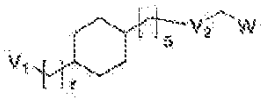
Fórmula IIw



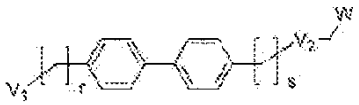
Fórmula IIx



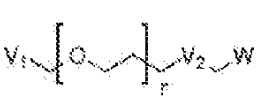
Fórmula IIy



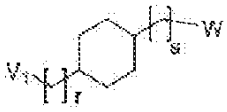
Fórmula IIz



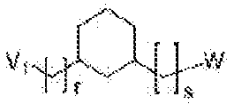
Fórmula IIaa



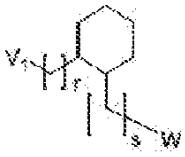
Fórmula IIab



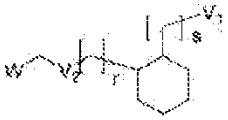
Fórmula IIac



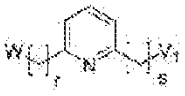
Fórmula IIad



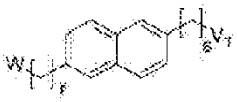
Fórmula IIae



Fórmula IIaf

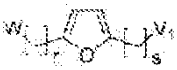


Fórmula IIag



Fórmula IIah

y



Fórmula IIai

;

en donde:

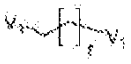
r es 0, 1, 2, 3, 4, o 5;

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

W representa CH_2---~ o (C=O)---~, en donde ---~ es un enlace covalente a X1; y

cada V_1 se selecciona independientemente de NH---†, CH_2---†, y (C=O)---† y cada V_2 es N---†, en donde ---† es un enlace covalente hacia Z1b, Z1a o Z1c sucesivo, siempre que V_1 sea NH---† cuando se conecta a Z1c; y los enlaces covalentes entre las unidades Z1a y Z1b comprenden cada uno independientemente un enlace amina o una unión de amida; y cuando n'=0 y m'=1, Z1a se conjuga directamente con X1 mediante un enlace de amina o enlace amida, y

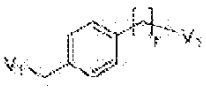
en donde las Fórmulas IIIa-IIIai son:



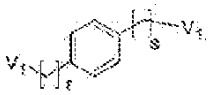
Fórmula IIIa



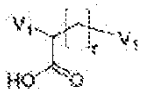
Fórmula IIIb



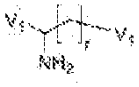
Fórmula IIIc



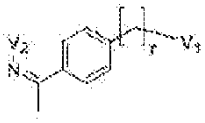
Fórmula IIId



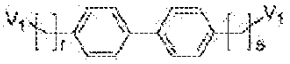
Fórmula IIIe



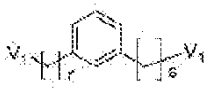
Fórmula IIIf



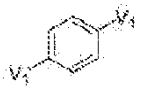
Fórmula IIIg



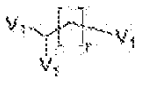
Fórmula IIIh



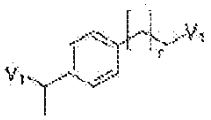
Fórmula IIIi



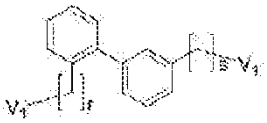
Fórmula IIIj



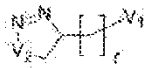
Fórmula IIIk



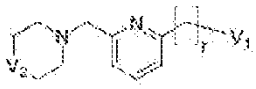
Fórmula IIIl



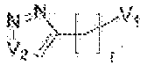
Fórmula IIIm



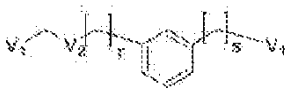
Fórmula IIIn



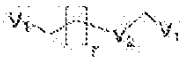
Fórmula IIIo



Fórmula IIIp



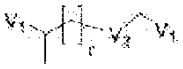
Fórmula IIIq



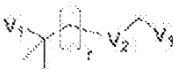
Fórmula IIIr



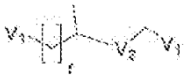
Fórmula IIIs



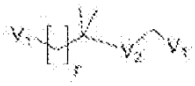
Fórmula IIIt



Fórmula IIIu



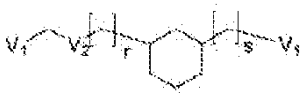
Fórmula IIIv



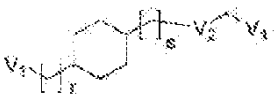
Fórmula IIIw



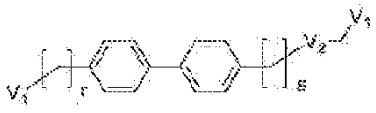
Fórmula IIIx



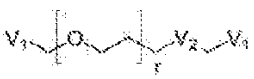
Fórmula IIIy



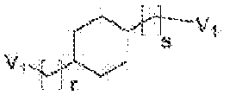
Fórmula IIIz



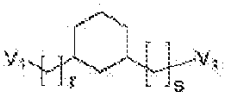
Fórmula IIIaa



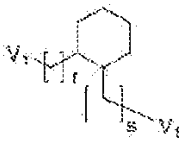
Fórmula IIIab



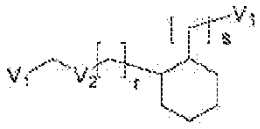
Fórmula IIIac



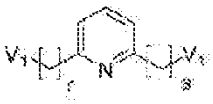
Fórmula IIIad



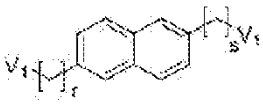
Fórmula IIIae



Fórmula IIIaf

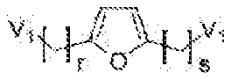


Fórmula IIIag



Fórmula IIIah

y



Fórmula IIIai ;

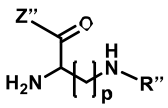
en donde:

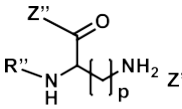
r es 1, 2, 3, 4, o 5;

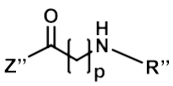
s es 1, 2, 3, 4, o 5; y

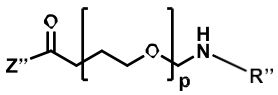
cada V_1 se selecciona independientemente de NH---†, CH_2---†, y (C=O)---† y cada V_2 es N---†, en donde ---† es un enlace covalente hacia Z1b, Z1a o Z1c sucesivo, siempre que V_1 sea NH---† cuando se conecta a Z1c; y los enlaces covalentes entre las unidades Z1a y Z1b comprenden cada uno independientemente un enlace amina o una unión de amida; y cuando n'=0 y m'=1, Z1a se conjuga directamente con X1 mediante un enlace de amina o enlace amida.

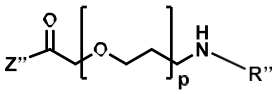
111. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde el al menos un Z1c covalentemente se conjuga indirectamente mediante un enlazador seleccionado de (i) las Fórmulas FL1-FL19:

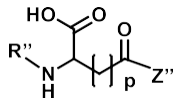

(FL1)

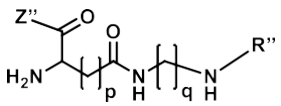

(FL2)

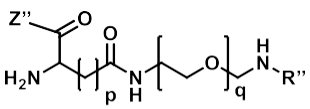

(FL3)

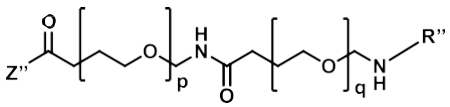

(FL4)

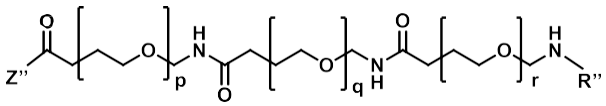

(FL4A)

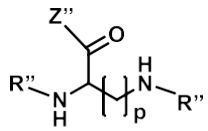

(FL5)

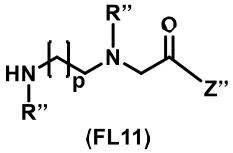

(FL6)

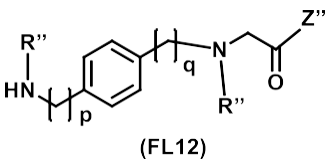

(FL7)

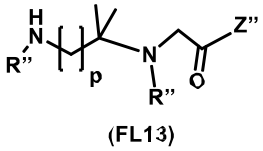

(FL8)

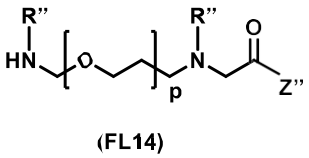

(FL9)

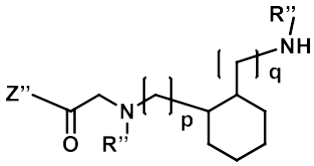

(FL10)

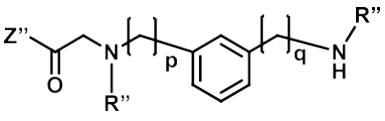

(FL11)

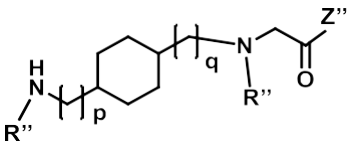

(FL12)

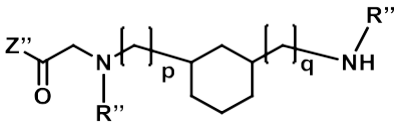

(FL13)


(FL14)

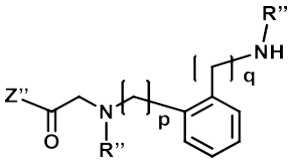

(FL15)


(FL16)


(FL17)


(FL18)

y


(FL19)

;

en donde, en las Fórmulas FL1 a FL19:

Z'' representa un punto de unión hacia X1;

R'' representa un punto de unión hacia Z1c;

p es 1, 2, 3, 4, o 5,

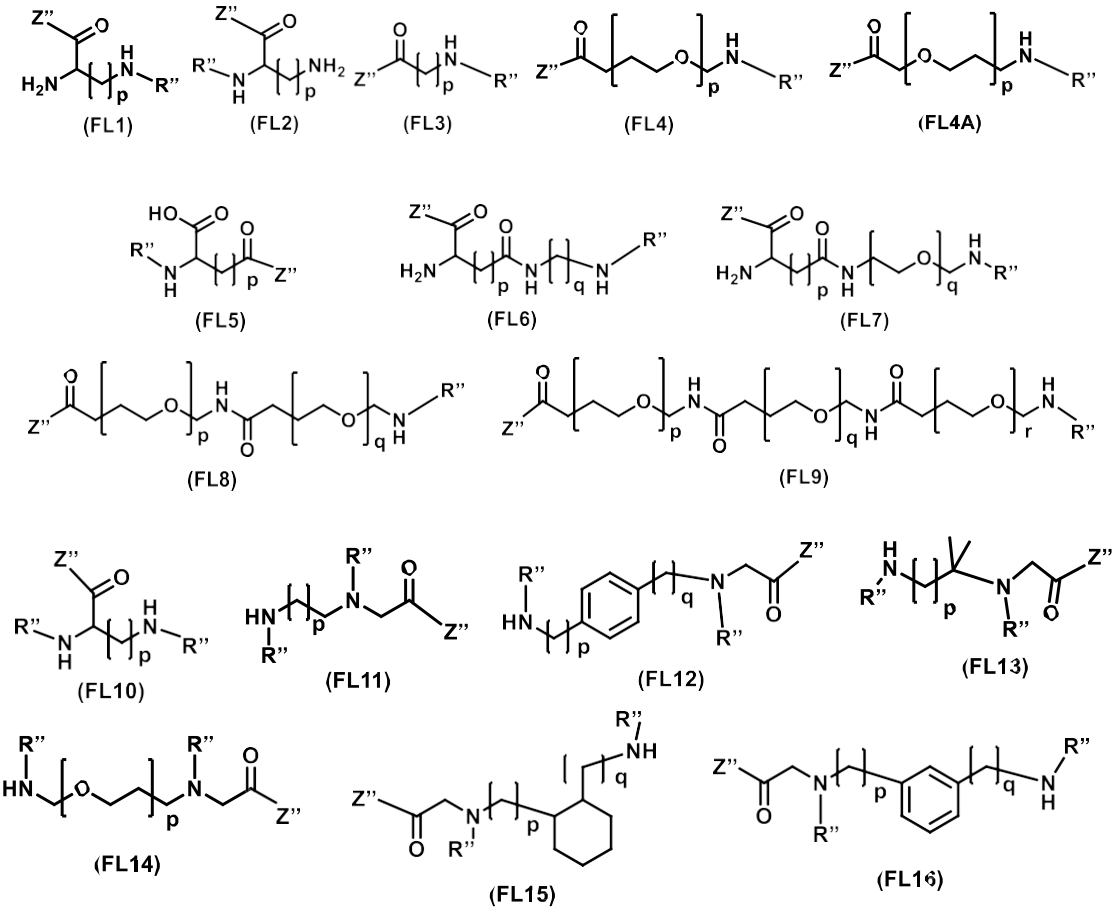
q es 1, 2, 3, 4, o 5,

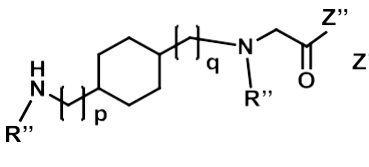
r es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada; y

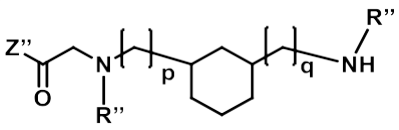
(ii) un aminoácido L o D que comprende al menos un grupo amina conjugado directamente con Z1c, en donde un grupo funcional ácido del aminoácido está conjugado hacia X1.

112. El compuesto de la reivindicación 102, en donde n' es 1 y cada uno de los Z1b se selecciona independientemente de (i) las Fórmulas FL1-FL19:



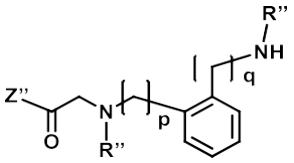


(FL17)



(FL18)

y



(FL19) ;

en donde, en las Fórmulas FL1 a FL19:

Z'' representa un punto de unión hacia X1;

R'' representa un punto de unión hacia Z1c;

p es 1, 2, 3, 4, o 5,

q es 1, 2, 3, 4, o 5,

r es 1, 2, 3, 4, o 5; y

cualquier amina primaria está opcionalmente acetilada o alquilada; y

(ii) un aminoácido L o D que comprende al menos un grupo amina conjugado directamente con Z1c, en donde un grupo funcional ácido del aminoácido está conjugado hacia X1.

113. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde el compuesto comprende una sustancia farmacológica que comprende una hormona polipeptídica humana del páncreas humano, insulina, glucagón, GLP-1, una somatostatina, un polipéptido inhibidor gástrico, un polipéptido insulinotrópico dependiente de glucosa, un péptido híbrido que comprende secuencias de dos o más hormonas polipeptídicas humanas, o un análogo de este.

114. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde:

X1 comprende insulina humana o un análogo de insulina humana que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 1 y 3 a 33, y la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 2 y 34 a 74, 24047, y 24048;

cada Z1c se selecciona independientemente de FF1, FF10, FF12, FF14, FF15, FF114, FF115, FF116, FF163, FF193, FF194, FF203, FF221-FF231 y se conjuga covalentemente ya sea de forma directa o indirecta a través de un enlazador, con Z1a y/o Z1b, o con X1;

cada Z1a está independientemente ausente o comprende independientemente una secuencia seleccionada de K, GK, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), KGSHK (sec. con núm. de ident.: 4238), KNSTK (sec. con núm. de ident.: 5085), GKASHK (sec. con núm. de ident.: 12414), GKEEEK (sec. con núm. de ident.: 12677), GKEEHK (sec. con núm. de ident.: 12680), GKGHSK (sec. con núm. de ident.: 13120), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050), GKGSHK (sec. con núm. de ident.: 13198), GKGSTK (sec. con núm. de ident.: 13205), GKHENK (sec. con núm. de ident.: 13271), GKNSHK (sec. con núm. de ident.: 13982), GKNSTK (sec. con núm. de ident.: 13989), GKQSSK (sec. con núm. de ident.: 14380), GKYQFK (sec. con núm. de ident.: 15128), GKGSKK (sec. con núm. de ident.: 24045), GKKPGKK (sec. con núm. de ident.: 24046), GKGPSK (sec. con núm. de ident.: 24044), GKPSHKP (sec. con núm. de ident.: 24043) y GSHKGSHK (sec. con núm. de ident.: 24042);

cada uno de dichos ligadores se selecciona de FL1, FL3, FL4 y FL5;

cada m’ es independientemente 0 o 1;

cada n’ es independientemente 0, 1, 2 o 3;

cada o’ es independientemente 1, 2, 3, 4 o 5;

cada p’ es 1, 2, 3, 4, o 5; y

q’ es 1, 2, 3, o 4, en donde cuando cualquiera de n’, o’, p’, o q’ es 2 o más, los grupos correspondientes Z1a, Z1b, y Z1c se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes; y

en donde cada Z1c se conjuga independientemente de manera covalente, directa o indirectamente, con una amina de Z1a, con una amina de Z1b, o con X1.

115. El compuesto de la reivindicación 113 o 114, en donde:

X1 comprende la insulina humana o un análogo de insulina humana que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la cadena A comprende la sec. con núm. de ident.: 1; y la cadena B se selecciona de las sec. con núms. de ident.: 2, 36, 24047, y 24048;

cada Z1c se selecciona independientemente de FF1, FF10, FF12, FF14, FF15, FF114, FF115, FF116, FF193, FF194, FF203 y FF221-FF231 y se conjuga covalentemente ya sea de forma directa o indirecta a través de un ligador, con Z1a y/o Z1b, o con X1;

cada Z1a comprende independientemente una secuencia seleccionada de K, GK, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), KGSHK (sec. con núm. de ident.: 4238), KNSTK (sec. con núm. de ident.: 5085), GKASHK (sec. con núm. de ident.: 12414), GKEEEK (sec. con núm. de ident.: 12677), GKEEHK (sec. con núm. de ident.: 12680), GKGHSK (sec. con núm. de ident.: 13120), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050),

GKGSHK (sec. con núm. de ident.: 13198), GKGSTK (sec. con núm. de ident.: 13205), GKHENK (sec. con núm. de ident.: 13271), GKNSHK (sec. con núm. de ident.: 13982), GKNSTK (sec. con núm. de ident.: 13989), GKQSSK (sec. con núm. de ident.: 14380), GKYQFK (sec. con núm. de ident.: 15128), GKGSKK (sec. con núm. de ident.: 24045), GKKPGKK (sec. con núm. de ident.: 24046), GKGPSK (sec. con núm. de ident.: 24044), GKPSHKP (sec. con núm. de ident.: 24043), y GSHKGSHK (sec. con núm. de ident.: 24042);

cada uno de dichos ligadores está independientemente ausente o se selecciona independientemente de FL3 y FL5;

cada m' es independientemente 0 o 1;

cada n' es independientemente 0 o 2;

cada o' es independientemente 1, 2, o 3;

cada p' es 1, 2, o 3; y

q' es 1, 2, o 3, en donde, cuando cualquiera de n', o', p' o q' es 2 o más, los grupos correspondientes Z1a, Z1b y Z1c se seleccionan independientemente y pueden ser iguales o diferentes;

en donde cada Z1c se conjuga independientemente de manera covalente, directa o indirectamente, con una amina de Z1a, con una amina de Z1b, o con X1.

116. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde cada uno de los Z1a está independientemente ausente o comprende independientemente una secuencia seleccionada de K, GK, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), GKGSH (sec. con

núm. de ident.: 24050), KGSHK (sec. con núm. de ident.: 4238), y GKGSHK (sec. con núm. de ident.: 13198).

117. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde cada uno de los Z1c se selecciona independientemente de FF1, FF10, FF12, FF14, FF15, FF114, FF115, FF116, y FF221-FF231, y en donde el B_1 y el B_2 se seleccionan independientemente de las Fórmulas F1 y F2.

118. El compuesto de la reivindicación 103, en donde B_1 y B_2 se seleccionada independientemente de F2 y F7.

119. El compuesto de la reivindicación 103, en donde al menos un R_1 en B_1 o B_2 es F o CF_3.

120. El compuesto de la reivindicación 111 o 112, en donde Z1b está independientemente ausente, FL3, o FL5.

121. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde cada uno de los Z1c se selecciona independientemente de FF10, FF12, FF116, FF221, FF222, y FF224-FF231.

122. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde:

cada B_1 y B_2 se selecciona independientemente de F2 y F7 y se conjuga covalentemente a Z1c usando un enlace amida,

cada Z1b está independientemente ausente; FL3, en donde p es 1, 2, o 3; o FL5, en donde p es 2, 3, o 4;

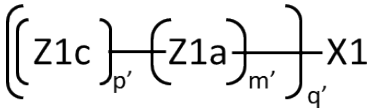
cada FF se selecciona independientemente de FF10, FF12, FF116, FF134, FF163, FF193, FF203, FF221, FF222 y FF224-FF231; en donde cada FF12 y FF222 tiene estereoquímica (*S,R*) o (*S,S*);

cada Z1c se conjuga directa o indirectamente a través de FL3 o FL5 con el grupo amina en una o más cadenas laterales de lisina en X1 o el terminal N en X1; y

X1 es una sustancia farmacológica polipeptídica y/o una insulina que tiene opcionalmente de 0 a 4 residuos reemplazados, insertados o mutados a lisinas, y en donde cada una de las lisinas se conjuga directa o indirectamente con un Z1c.

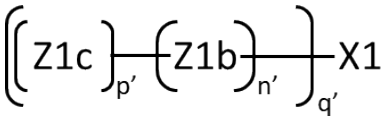
123. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde Z1c es FF224, n' es 0, y Z1a es un aminoácido que contiene amina.

124. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-123, en donde el compuesto se selecciona de:



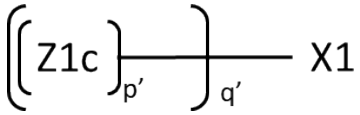
;

IA



; y

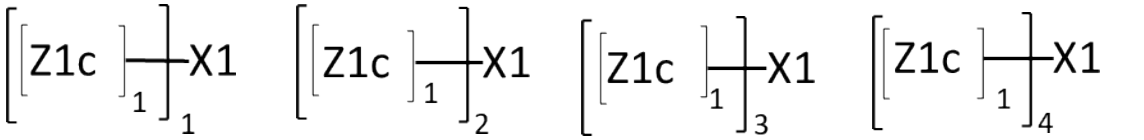
IB



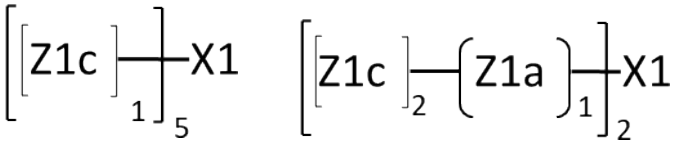
.

IC

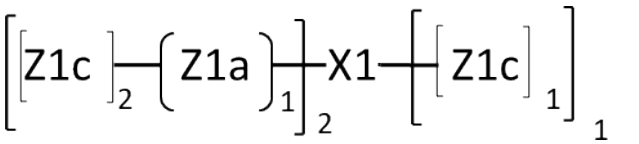
125. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-123, en donde el compuesto se selecciona de:



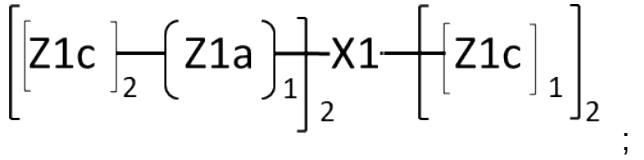
;



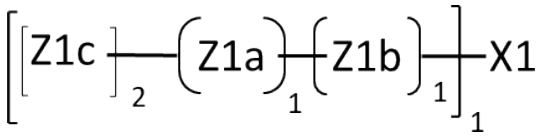
;



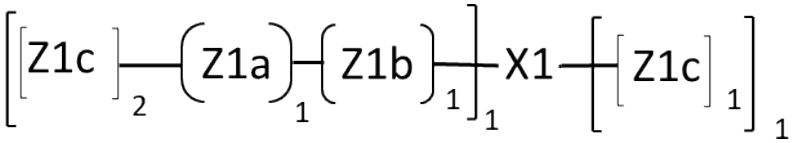
;



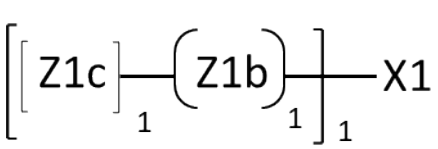
;



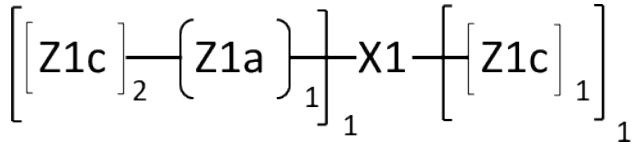
;



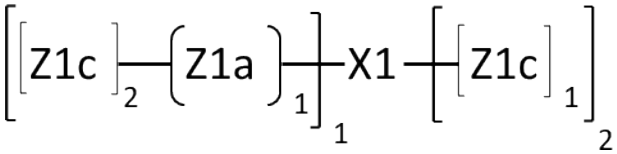
;



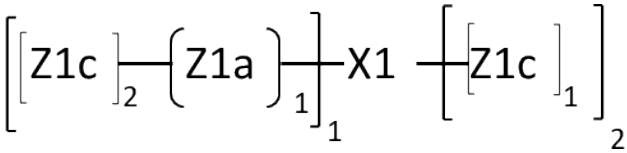
;



;

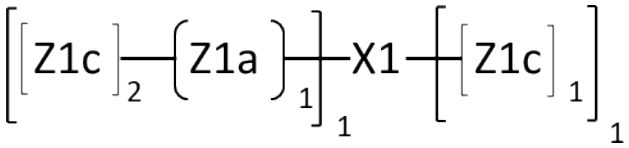


; y

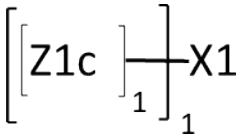


.

126. El compuesto de la reivindicación 125, en donde el compuesto se selecciona de

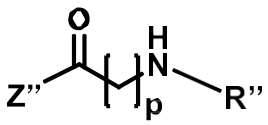


y



.

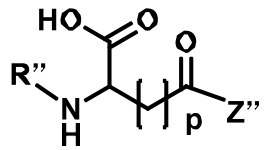
127. El compuesto de la reivindicación 111 o 112, en donde Z1c covalentemente se conjuga directamente a X1 mediante un enlazador, y en donde el enlazador se selecciona independientemente entre ácido gamma-glutámico, beta-alanina, y



(FL3)

la Fórmula FL3,

en donde p es 1, 2, o 3; y



(FL5)

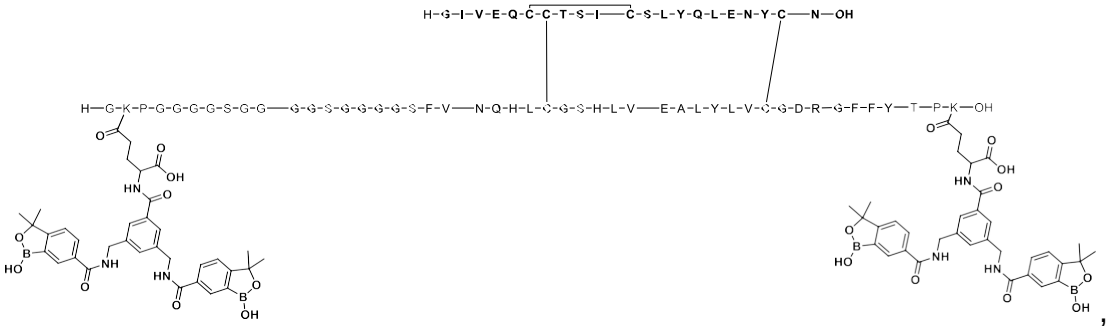
la Fórmula FL5,

en donde p es 2, 3, o 4.

128. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde X1 es OH o NH_2, y el compuesto comprende además una sustancia farmacológica conjugada covalentemente directa o indirectamente con el compuesto.

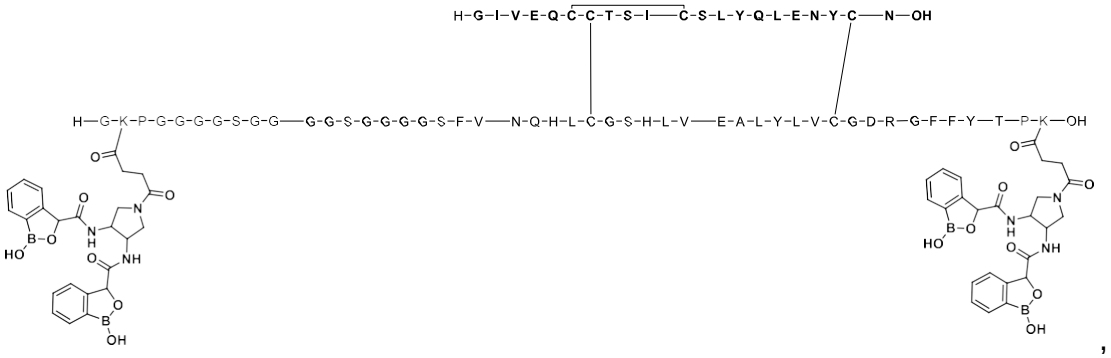
129. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde el compuesto se selecciona de:

Ejemplo 881:



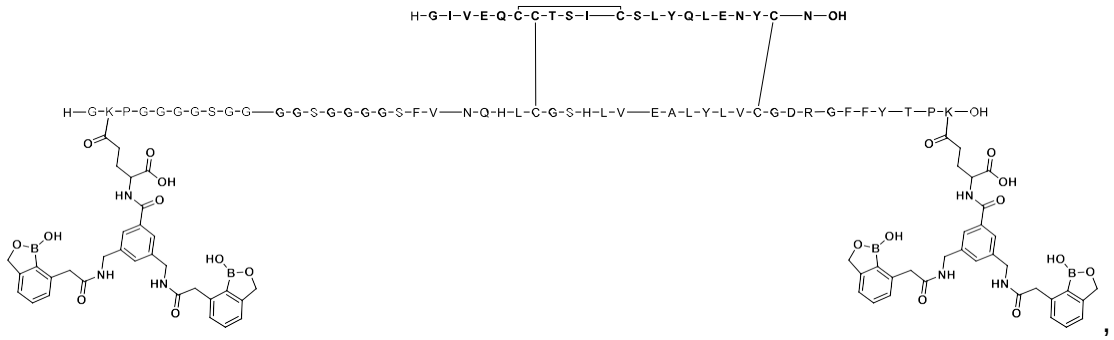
,

Ejemplo 882:

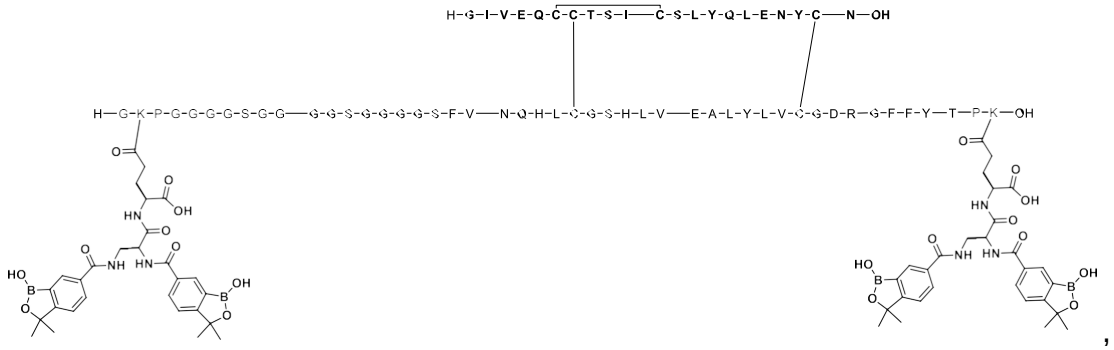


,

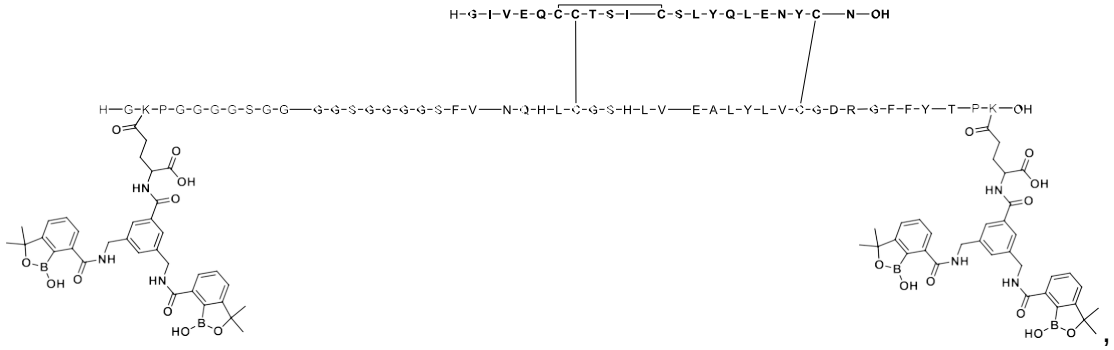
Ejemplo 883:



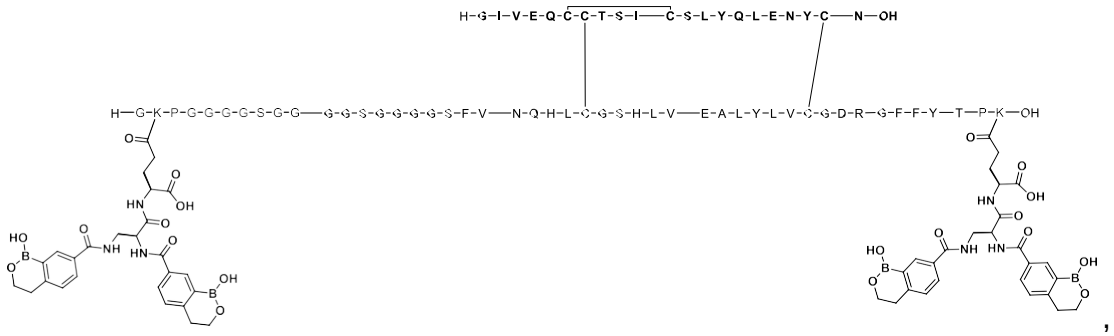
Ejemplo 884:



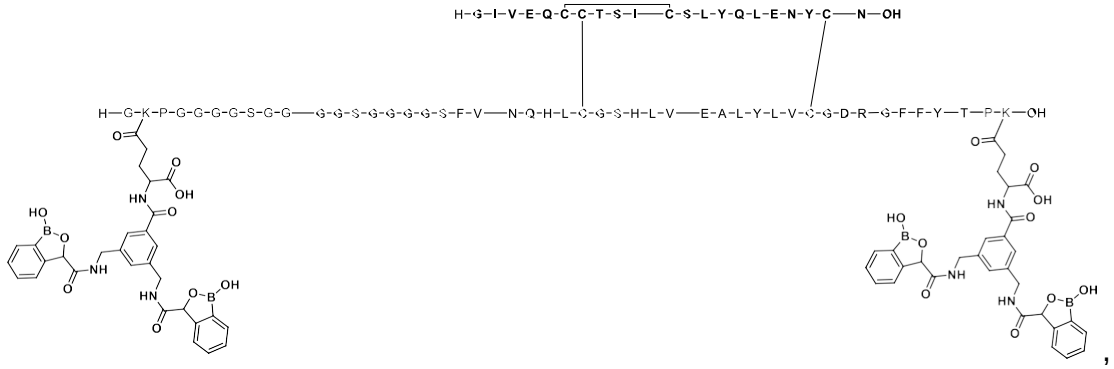
Ejemplo 885:



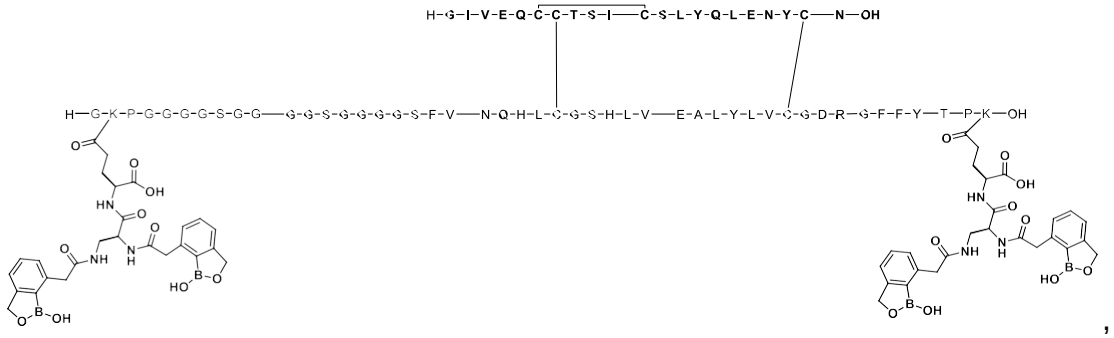
Ejemplo 886:



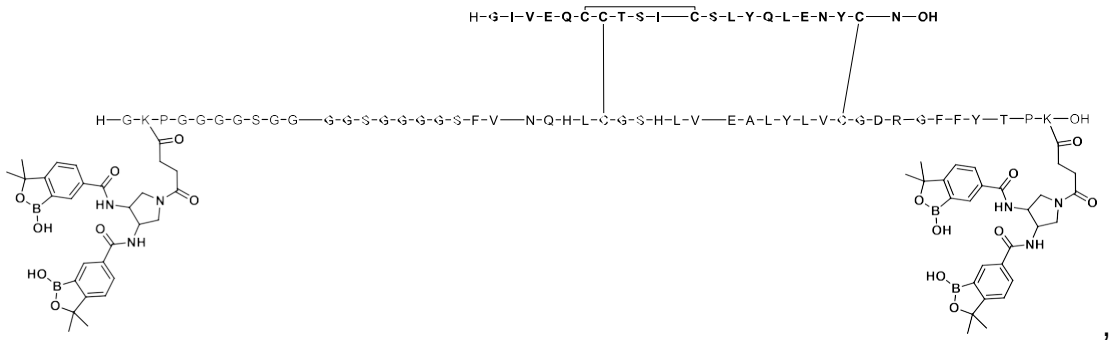
Ejemplo 887:



Ejemplo 888:

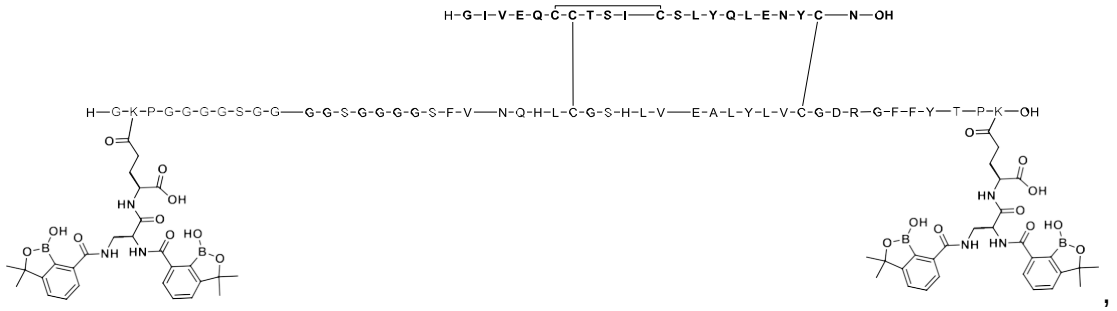


Ejemplo 889:



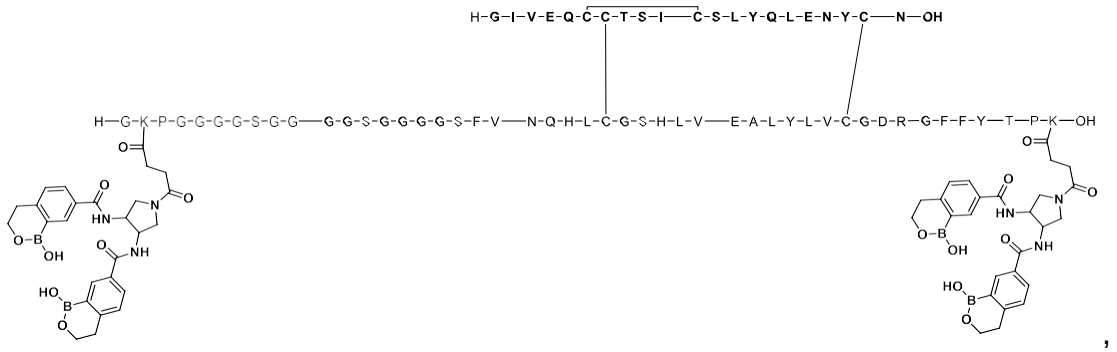
,

Ejemplo 890:



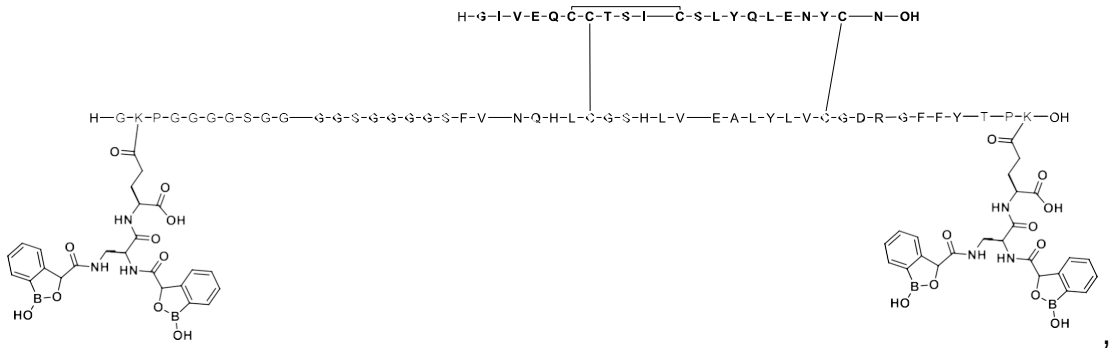
,

Ejemplo 891:

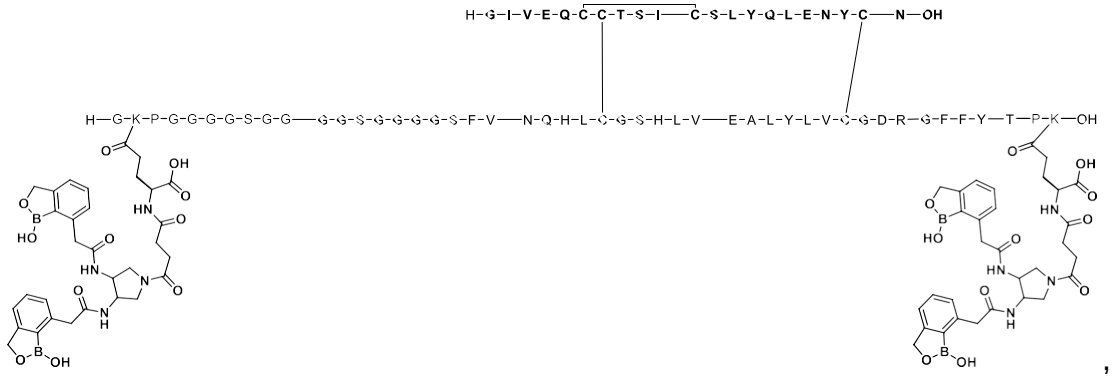


,

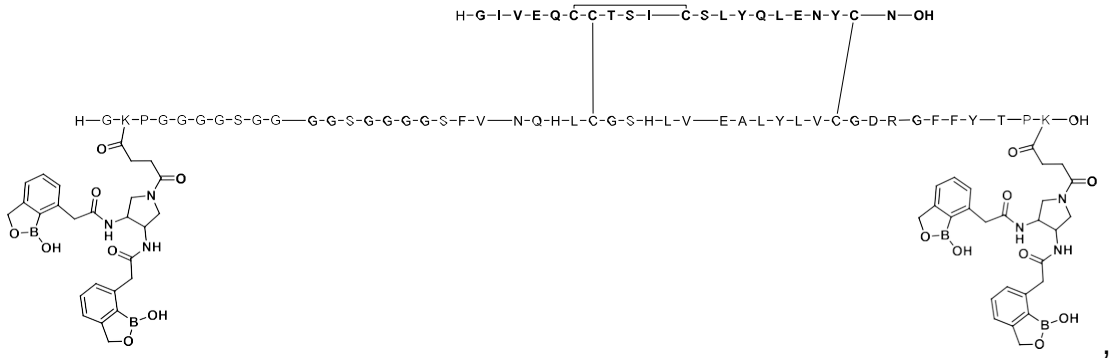
Ejemplo 892:



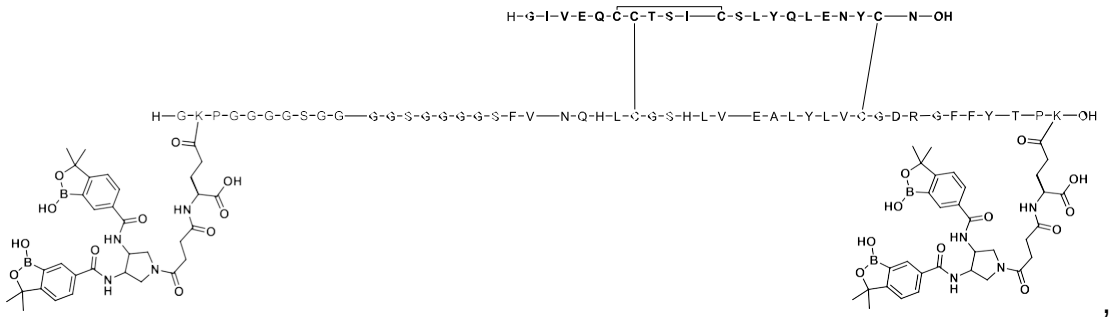
Ejemplo 893:



Ejemplo 894:

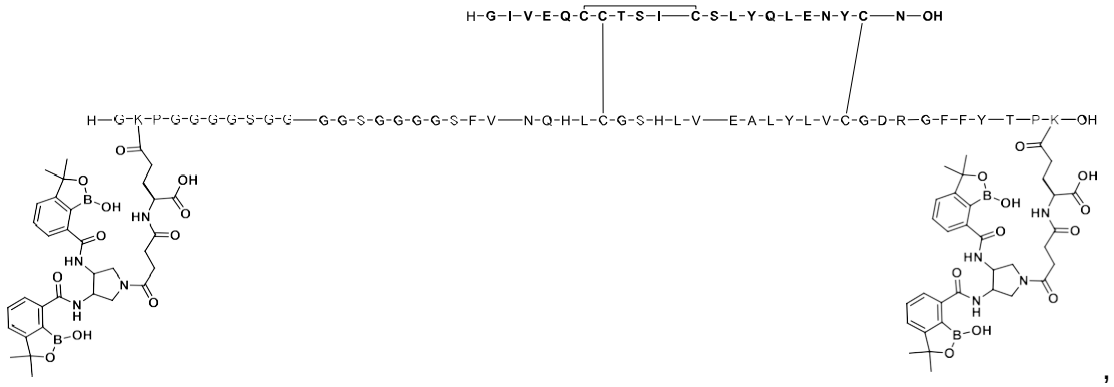


Ejemplo 895:



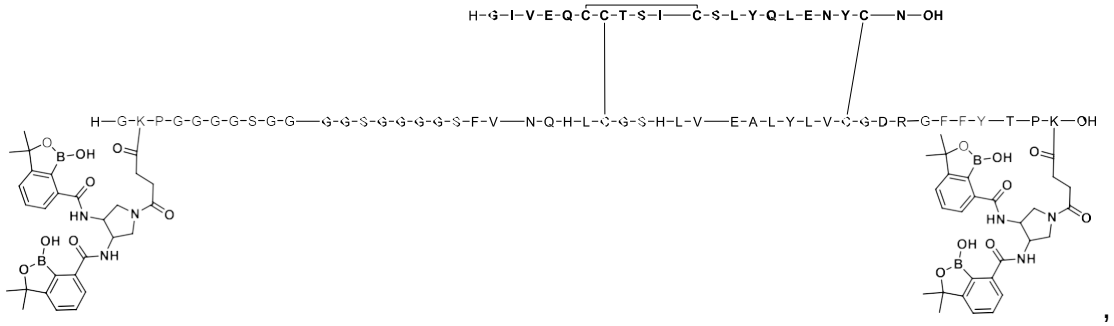
,

Ejemplo 896:



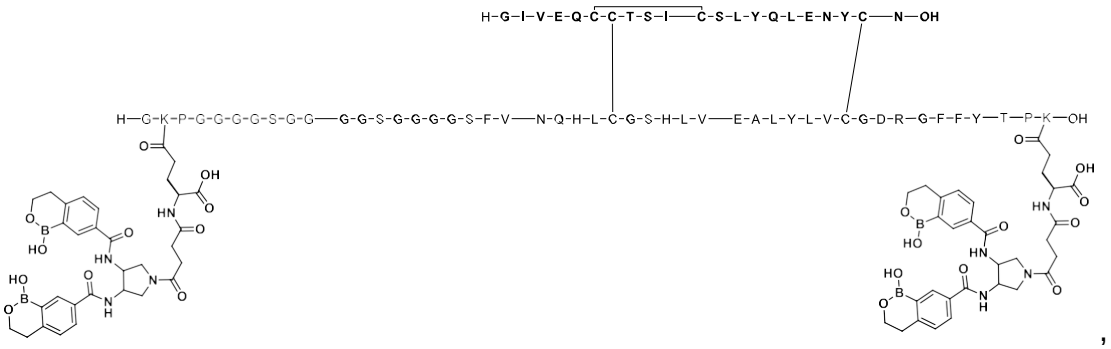
,

Ejemplo 897:

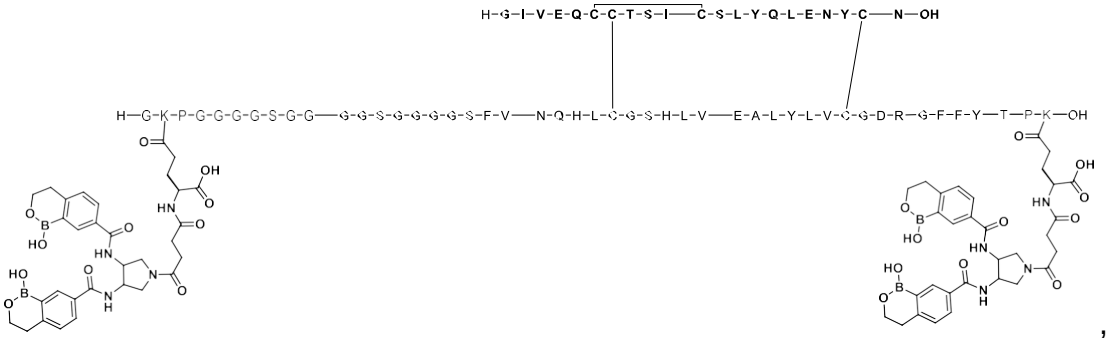


,

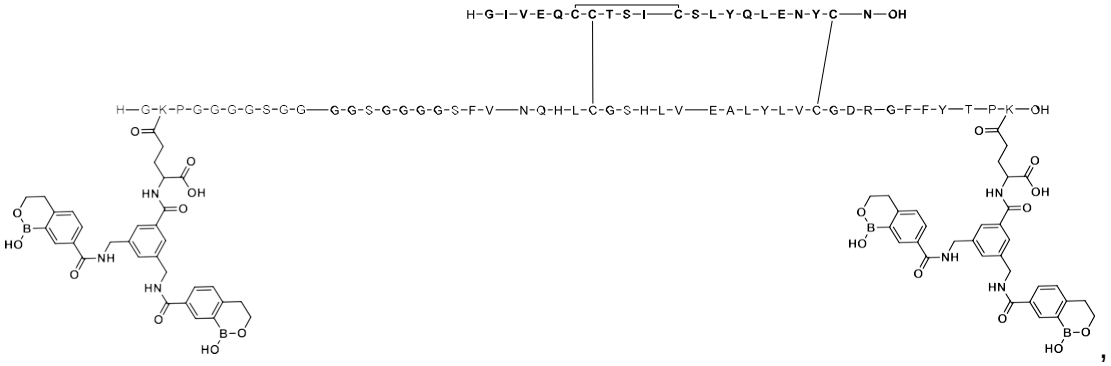
Ejemplo 898:



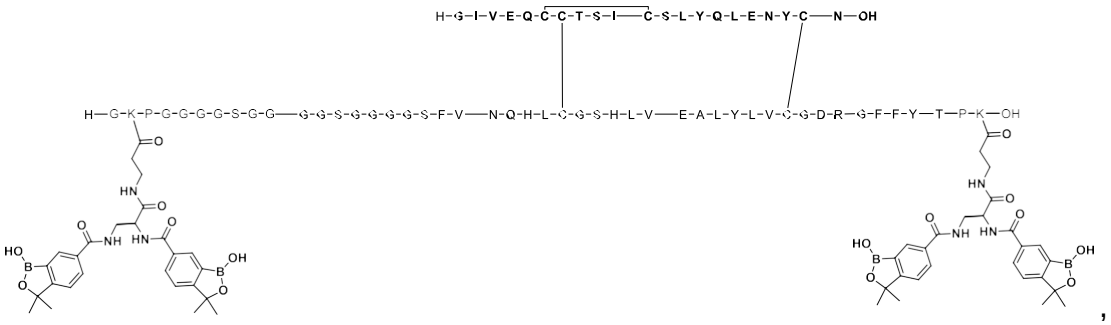
Ejemplo 899:



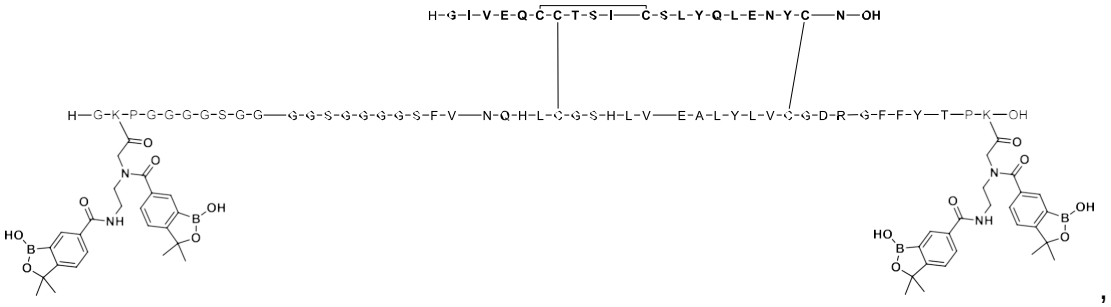
Ejemplo 900:



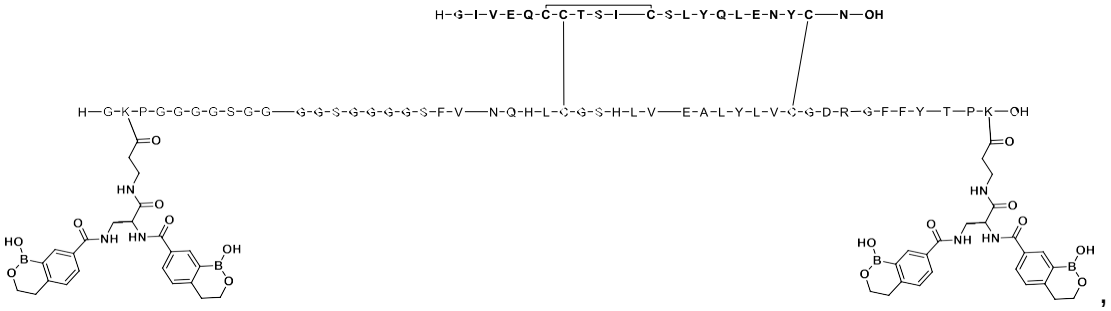
Ejemplo 901:



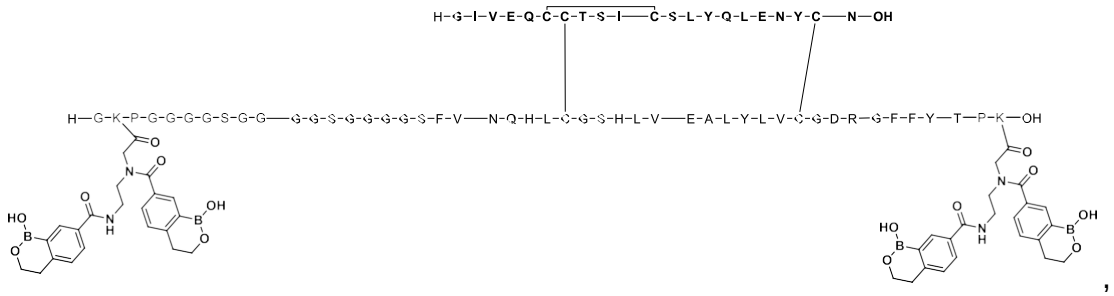
Ejemplo 902:



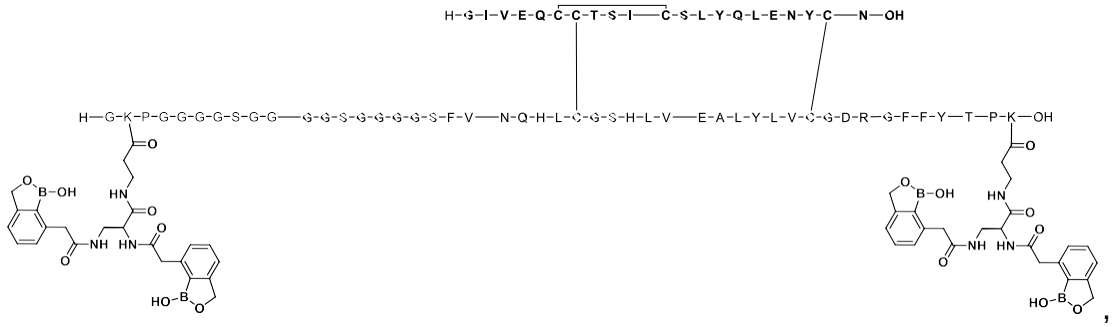
Ejemplo 903:



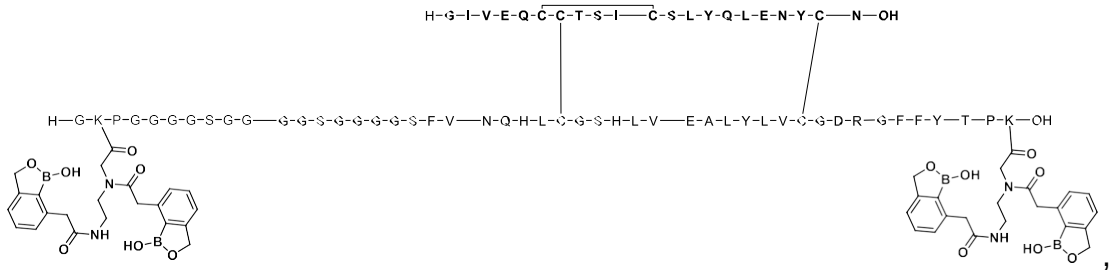
Ejemplo 904:



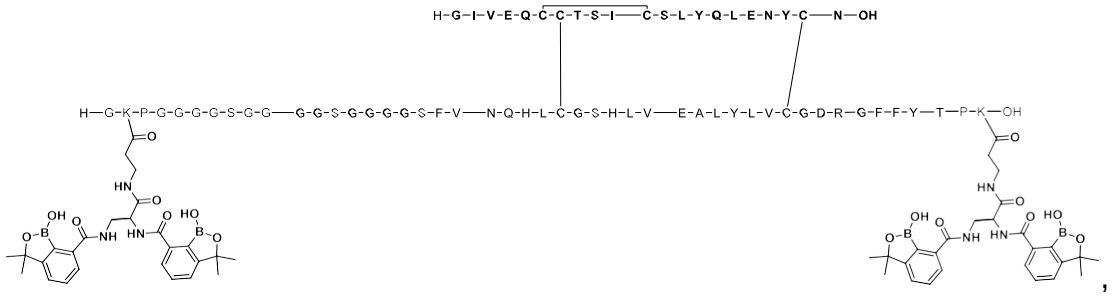
Ejemplo 905:



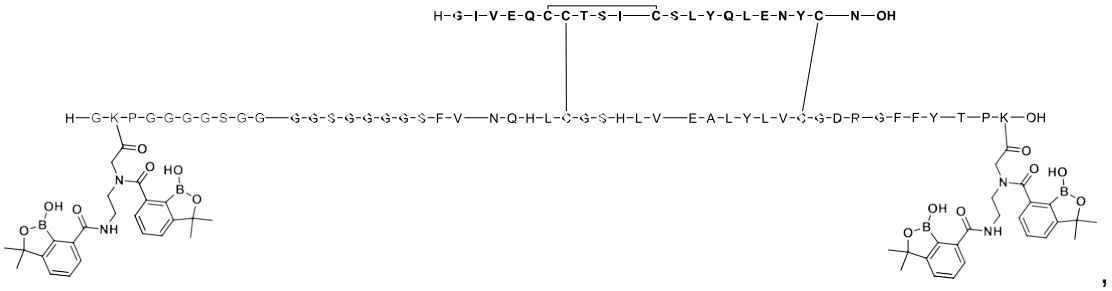
Ejemplo 906:



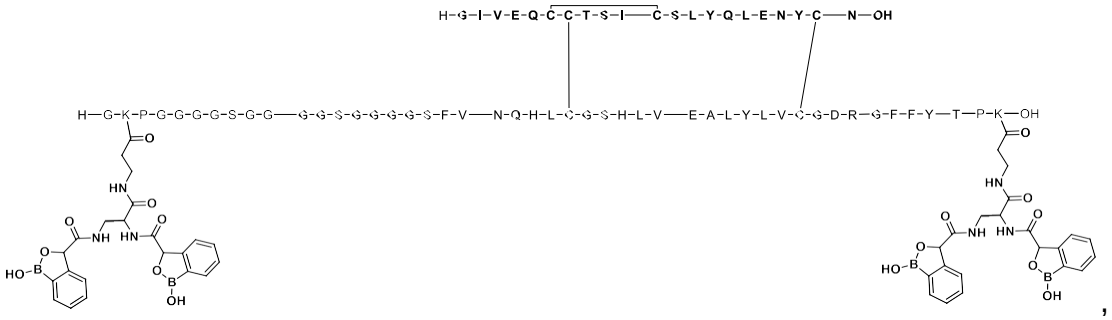
Ejemplo 907:



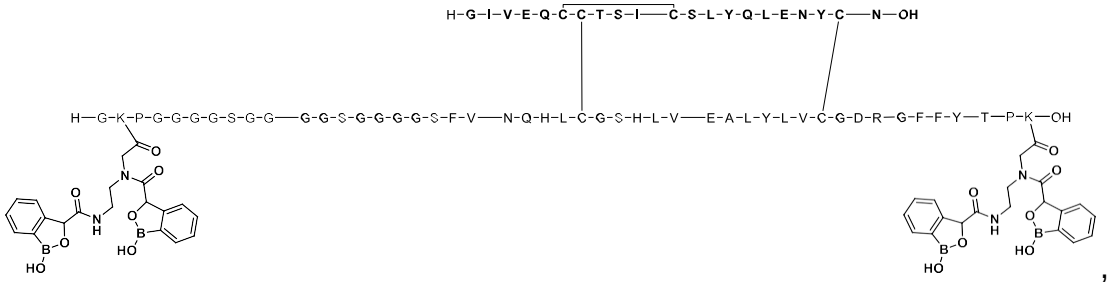
Ejemplo 908:



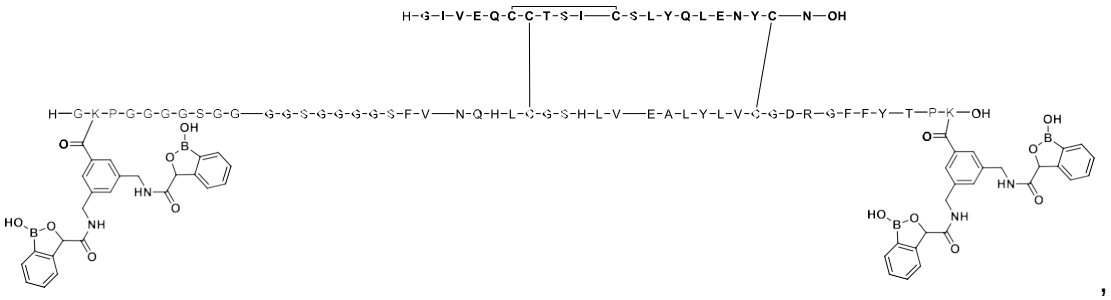
Ejemplo 909:



Ejemplo 910:

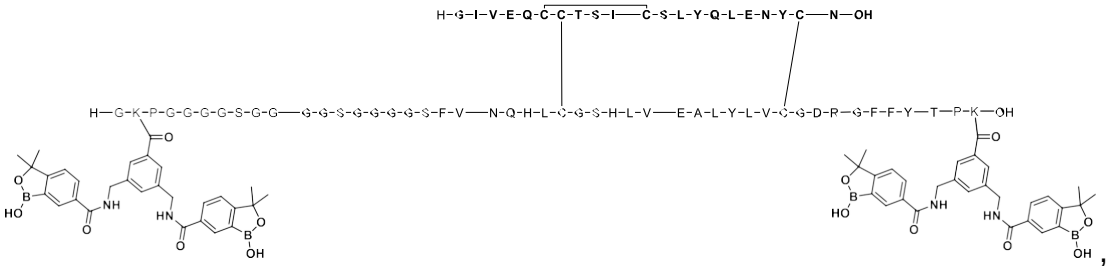


Ejemplo 911:



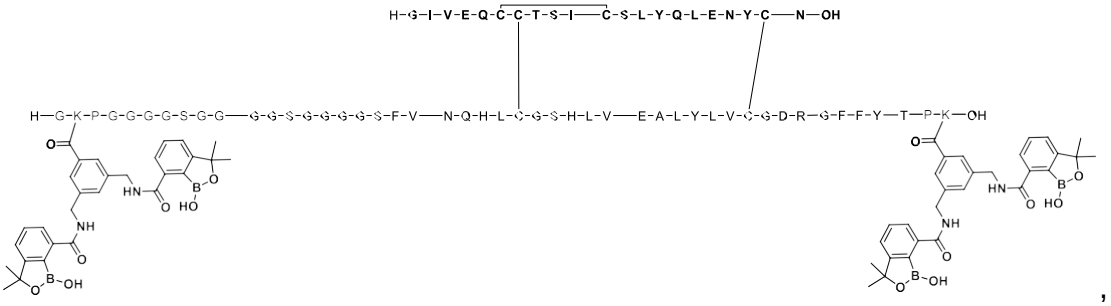
,

Ejemplo 912:



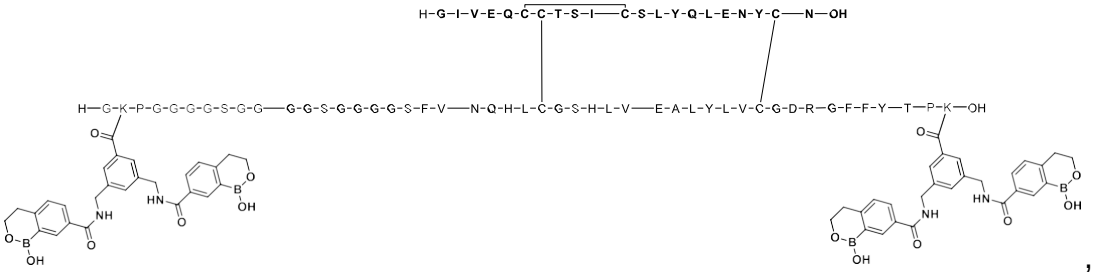
,

Ejemplo 913:



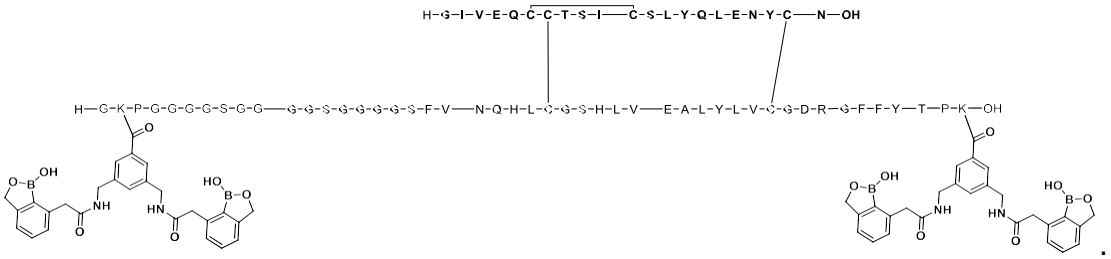
,

Ejemplo 914:



, y

Ejemplo 915:



130. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde X1 es una sustancia farmacológica polipeptídica y/o una insulina que tiene opcionalmente de 0 a 4 residuos reemplazados, insertados, o mutados a lisinas, y en donde cada una de las lisinas se conjuga con un Z1c.

131. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde una o más aminas están cada una independientemente acetiladas y/o alquiladas independientemente.

132. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde X1 comprende una sustancia farmacológica polipeptídica y la conjugación covalente con X1 es con grupos amino en uno o más residuos de lisina y/o con los grupos amino del terminal N en X1.

133. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde cada R1 se selecciona independientemente de un grupo alquilo C_1-C_{22}, un grupo acilo C_1-C_{22}, un grupo cicloalquilo (C_3-C_8), un grupo haloalquilo C_1-C_{22}, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo,

cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquilo C_1-C_{22}-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo C_1-C_{22}, o arilo.

134. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde X4 se selecciona de -COOH, - $(CH_2)_m$COOH, un grupo alquilo C_1-C_{22}, un grupo acilo C_1-C_{22}, un grupo cicloalquilo(C_3-C_8), un grupo haloalquilo C_1-C_{22}, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada X4 comprende opcionalmente uno o más haluros de alquilo C_1-C_{22}, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo C_1-C_{22}, o grupos arilo; en donde m es 1, 2, 3, 4, o 5.

135. El compuesto de la reivindicación 103, en donde el grupo alquilo de Y9 es un alquilo C_1-C_{22}.

136. El compuesto de la reivindicación 135, en donde Y9 es CH_3.

137. El compuesto de la reivindicación 101, en donde la al menos una amina primaria o secundaria en FF1-FF223 y FF225-FF231 se conjuga covalentemente con B6.

138. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde una amina en el compuesto se conjuga mediante un enlace amida a un grupo aromático que contiene boro.

139. El compuesto de la reivindicación 138, en donde el grupo aromático que contiene boro se selecciona de un ácido fenilborónico, boroxol y fenilboronato.

140. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-139, en donde el compuesto se formula en una solución que comprende uno o más de un regulador, estabilizador, vasodilatador, conservante, surfactante, sal, azúcar, o compuestos que contienen uno o más hidroxilos, alcoholes, dioles, o fenoles.

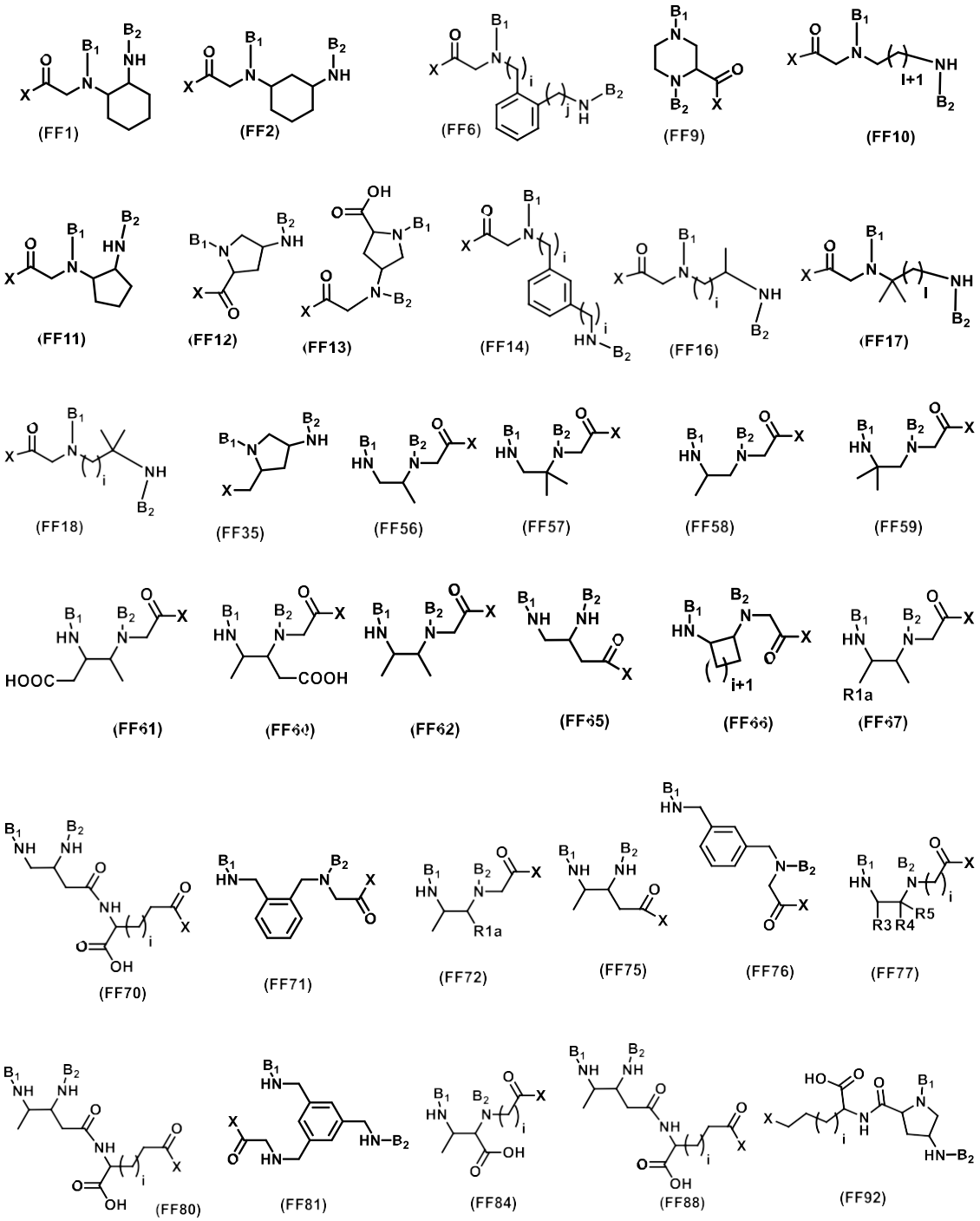
141. El compuesto de la reivindicación 140, en donde la solución comprende uno o más de citrato, zinc y/o cresol.

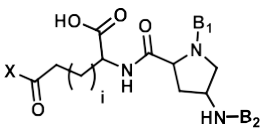
142. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde Z1c se conjuga con una cisteína.

143. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde el compuesto se conjuga covalentemente ya sea directamente o mediante un enlazador con un diol, azúcar, carbohidrato o una molécula que contiene diol.

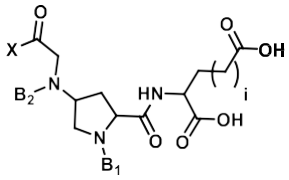
144. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde el compuesto se conjuga covalentemente con un anticuerpo, albúmina o un fragmento de este, o se conjuga covalentemente ya sea directamente o mediante un enlazador con una molécula que puede unirse a al menos una proteína presente en plasma humano.

145. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-144, en donde el compuesto comprende al menos un Z1c seleccionado de:

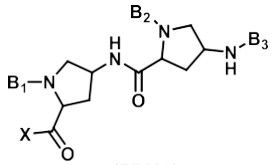




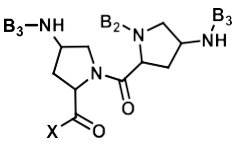
(FF101)



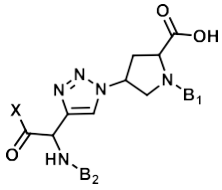
(FF102)



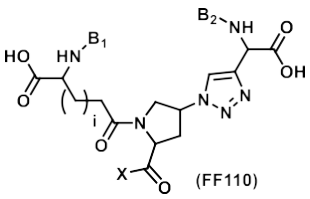
(FF107)



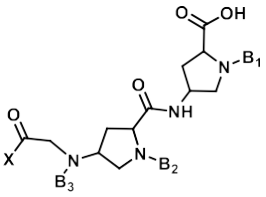
(FF108)



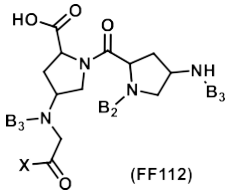
(FF109)



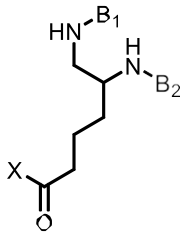
(FF110)



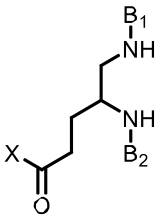
(FF111)



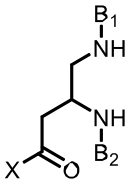
(FF112)



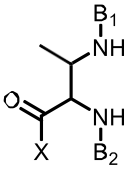
(FF113)



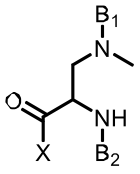
(FF114)



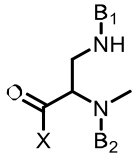
(FF115)



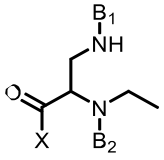
(FF116)



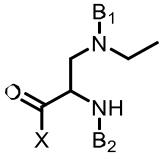
(FF117)



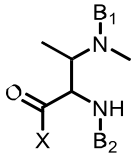
(FF118)



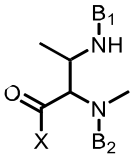
(FF119)



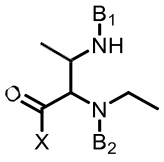
(FF120)



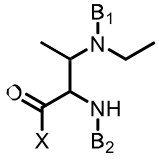
(FF121)



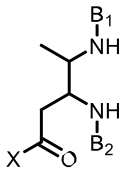
(FF122)



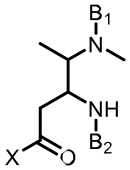
(FF123)



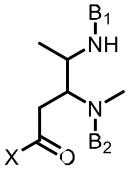
(FF124)



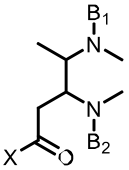
(FF125)



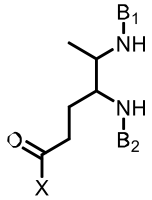
(FF126)



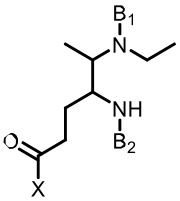
(FF127)



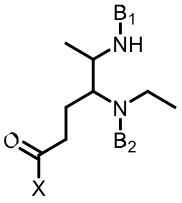
(FF128)



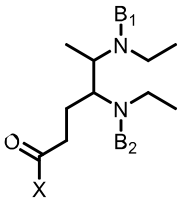
(FF129)



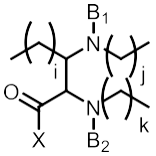
(FF130)



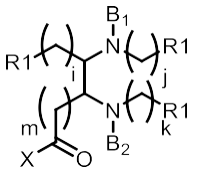
(FF131)



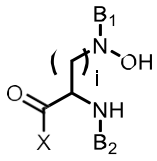
(FF132)



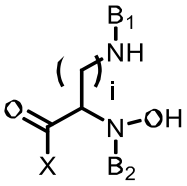
(FF133)



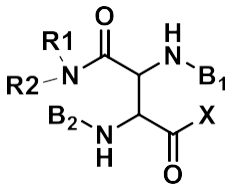
(FF134)



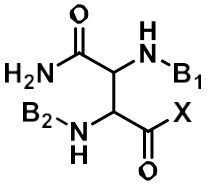
(FF135)



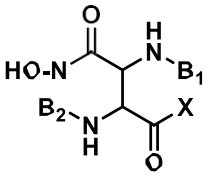
(FF136)



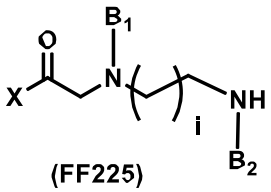
FF193



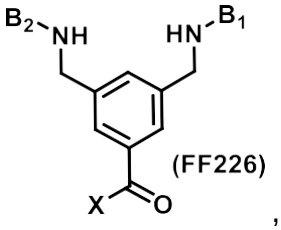
FF194 ,



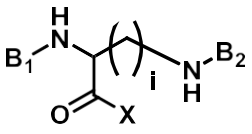
FF203 ,



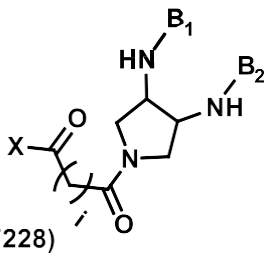
(FF225) ,



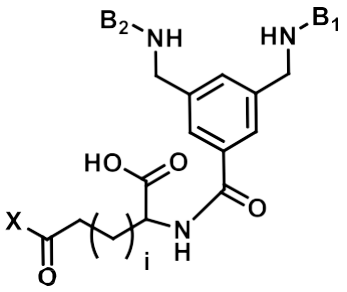
(FF226) ,



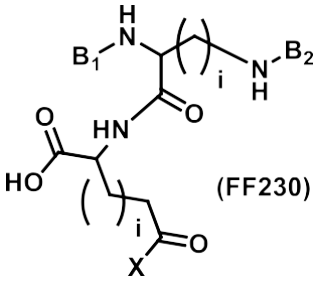
(FF227) ,



(FF228) ,

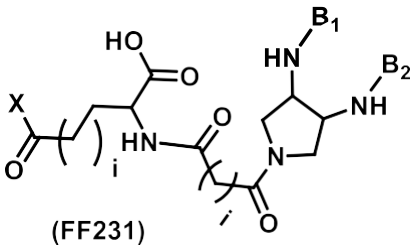


(FF229) ,



(FF230)

, y



(FF231) .

5

146. El compuesto de la reivindicación 145, en donde el compuesto comprende al menos un Z1c que tiene al menos un centro quiral y se selecciona de FF1, FF2, FF5, FF9, FF11-FF13, FF15-FF24, FF27, FF31, FF34-FF36, FF38, FF39, FF43-FF58, FF60-

FF70, FF72-FF75, FF77-FF80, FF82-FF84, FF86-FF212, FF216-FF220, FF222, FF223, y combinaciones de este.

147. El compuesto de la reivindicación 146, en donde el compuesto comprende al menos un FF12 y/o FF116; y

en donde la estereoquímica de FF12 y FF116 se selecciona independientemente de (*S,S*); (*S,R*); (*R,R*); y (*R,S*).

148. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde X1 comprende insulina humana o un análogo de insulina humana que comprende una cadena A y una cadena B, en donde el terminal C de la cadena A del análogo de insulina humana se extiende opcionalmente con un polipéptido de hasta 20 residuos, y/o el terminal N de la cadena B del análogo de insulina humana se extiende opcionalmente con un polipéptido de hasta 10 residuos.

149. El compuesto de la reivindicación 148, en donde X1 comprende al menos una lisina que tiene una cadena lateral de amina, y Z1c covalentemente se conjuga directamente con la cadena lateral de amina.

150. El compuesto de la reivindicación 101 o 102, en donde X1 comprende una sustancia farmacológica conjugada covalentemente con al menos un Z1c mediante un enlazador que contiene ácido.

151. Una composición o una mezcla que comprende al menos un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150 para usar como medicamento para el tratamiento de la diabetes, para controlar los niveles de azúcar en sangre, o para controlar la liberación de un fármaco basado en los niveles fisiológicos de azúcares o pequeñas moléculas que contienen diol.

152. Un método para administrar el compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150 a un sujeto humano como un agente terapéutico o profiláctico.

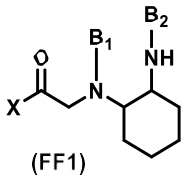
153. Un método para producir un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150, en donde el método comprende al menos una etapa de alquilación y/o amidación.

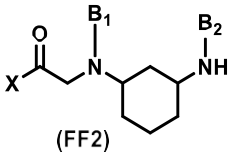
153. Un método para tratar a un sujeto mediante la administración de un dispositivo o formulación que comprende un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150 y los Ejemplos 881-915.

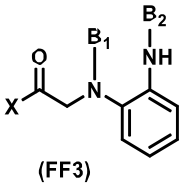
155. Un método de tratamiento o prevención de diabetes, intolerancia a la glucosa, hiperglucemia, o síndrome metabólico, en donde el método comprende administrar a un sujeto que lo necesita una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150 o la composición o la mezcla de la reivindicación 151.

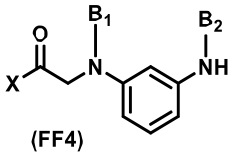
156. Un compuesto seleccionado de las Fórmulas FF1-FF231:

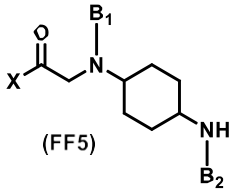
en donde las Fórmulas FF1-FF48 son:

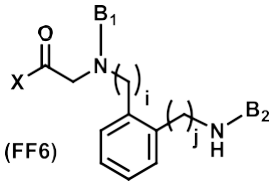

(FF1)

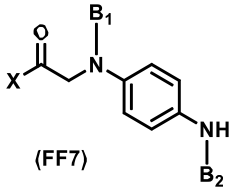

(FF2)

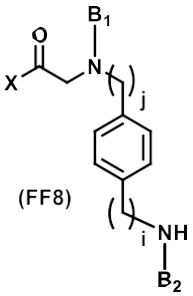

(FF3)

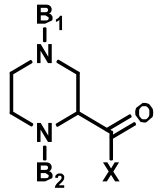

(FF4)

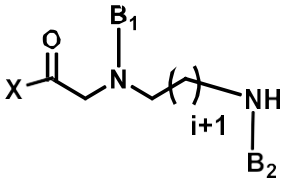

(FF5)

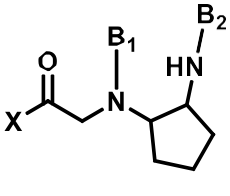

(FF6)

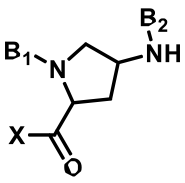

(FF7)

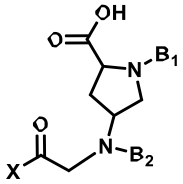

(FF8)

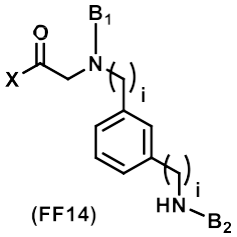

(FF9)

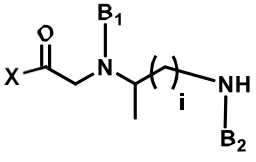

(FF10)

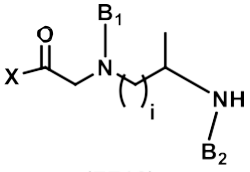

(FF11)

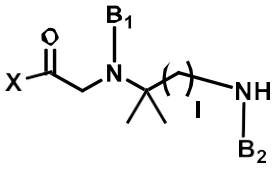

(FF12)

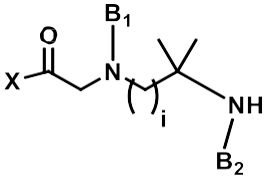

(FF13)

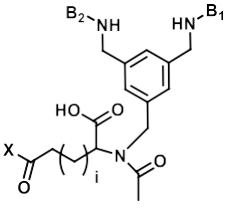

(FF14)

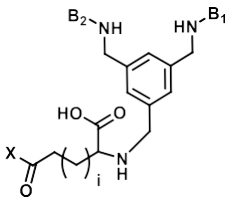

(FF15)

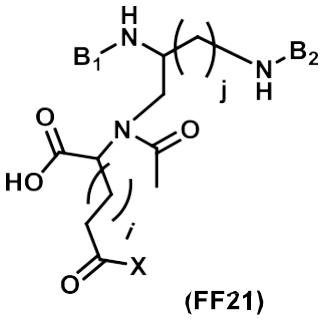

(FF16)


(FF17)

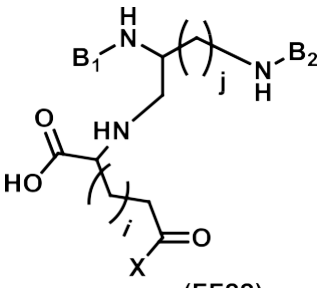

(FF18)


(FF19)

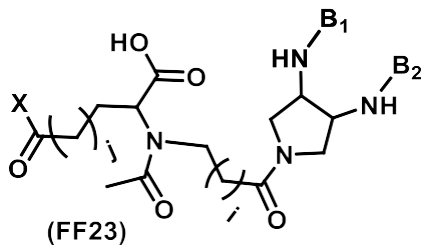

(FF20)



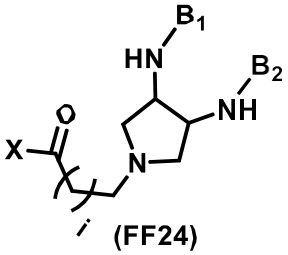
(FF21)



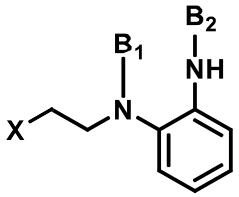
(FF22)



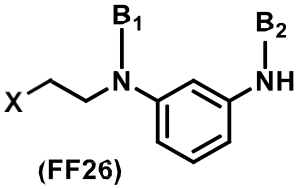
(FF23)



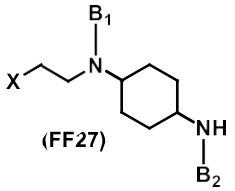
(FF24)



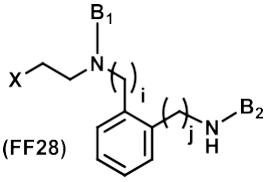
(FF25)



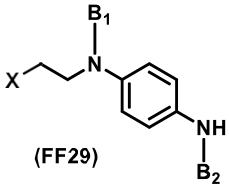
(FF26)



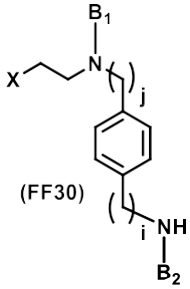
(FF27)



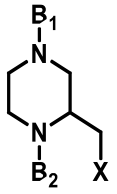
(FF28)



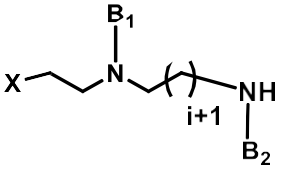
(FF29)



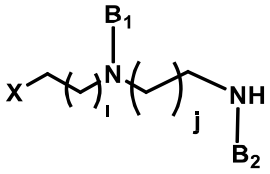
(FF30)



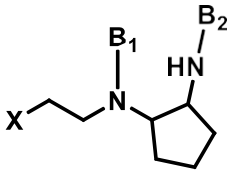
(FF31)



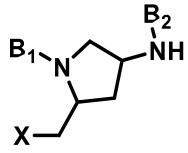
(FF32)



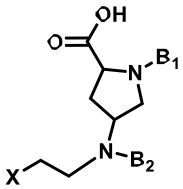
(FF33)



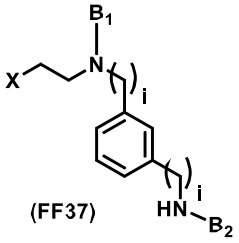
(FF34)



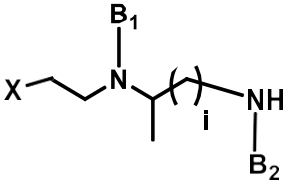
(FF35)



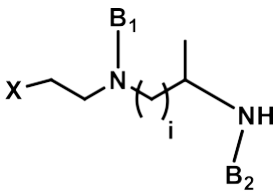
(FF36)

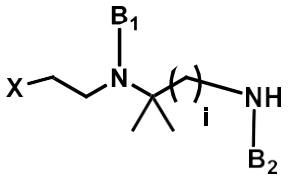


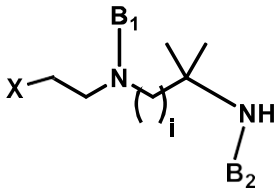
(FF37)

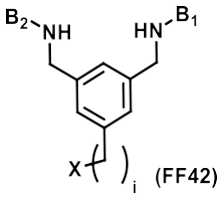


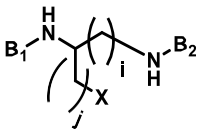
(FF38)

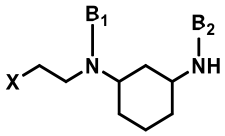

(FF39)

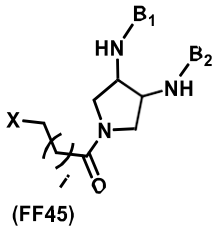

(FF40)

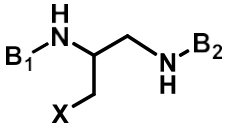

(FF41)

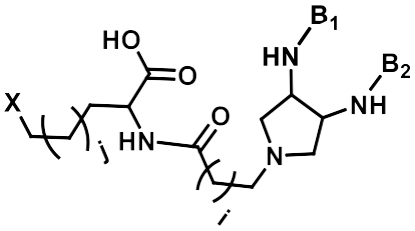

(FF42)


(FF43)

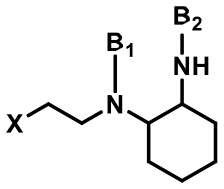

(FF44)


(FF45)


(FF46)


(FF47)

y


(FF48);

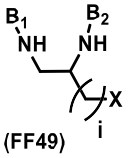
en donde X se selecciona de una maleimida, amina, OH, y halógeno; y

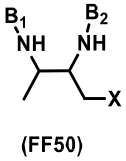
i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

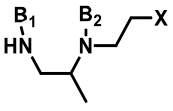
j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

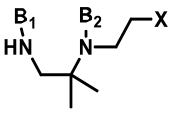
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

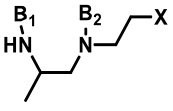
en donde las Fórmulas FF49-FF88 son:

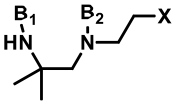

(FF49)

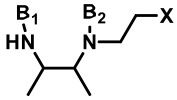

(FF50)

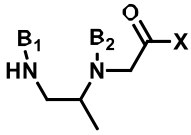

(FF51)

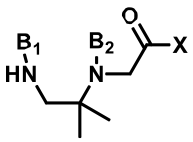

(FF52)

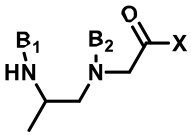

(FF53)

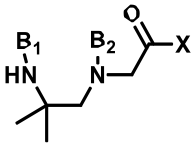

(FF54)

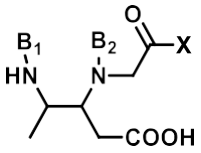

(FF55)

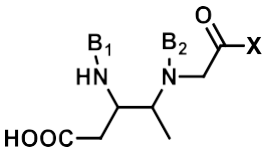

(FF56)

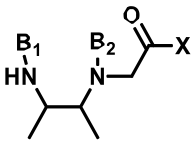

(FF57)

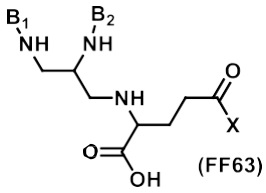

(FF58)

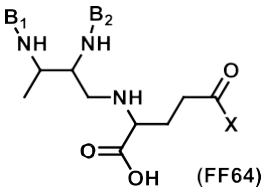

(FF59)

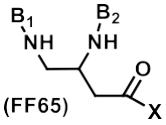

(FF60)

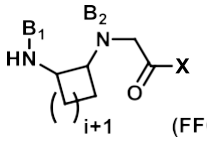

(FF61)

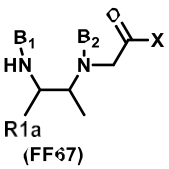

(FF62)

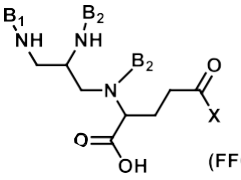

(FF63)

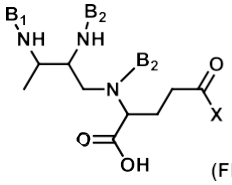

(FF64)

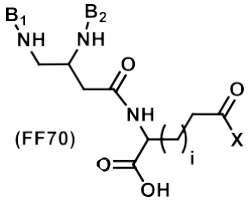

(FF65)

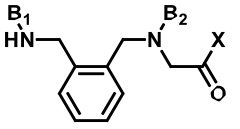

(FF66)

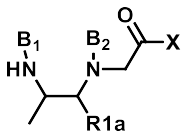

(FF67)

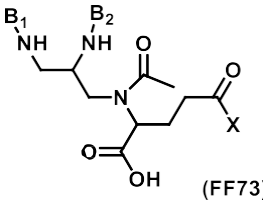

(FF68)

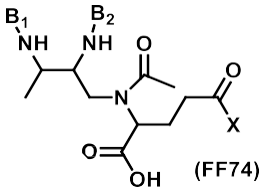

(FF69)

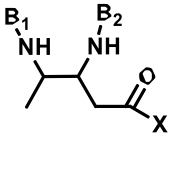

(FF70)

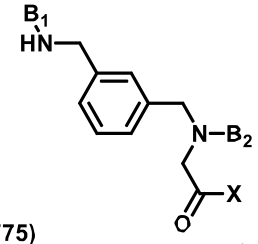

(FF71)

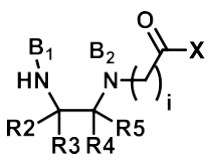

(FF72)

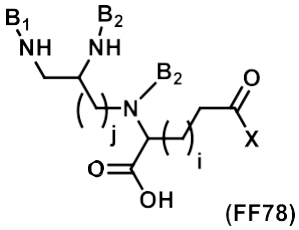

(FF73)

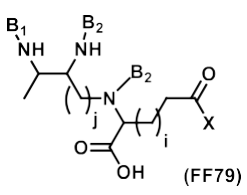

(FF74)

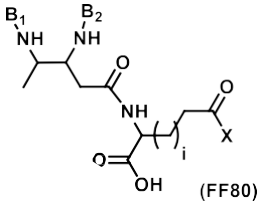

(FF75)

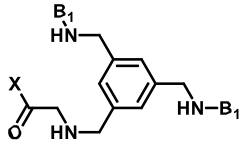

(FF76)

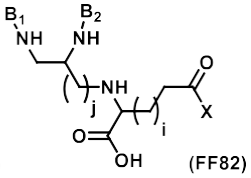

(FF77)

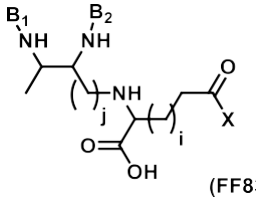

(FF78)

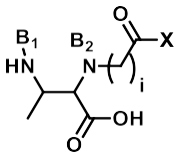

(FF79)

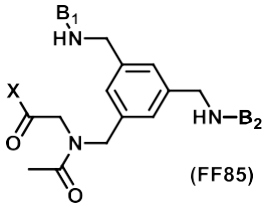

(FF80)

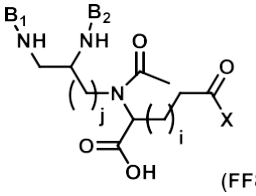

(FF81)

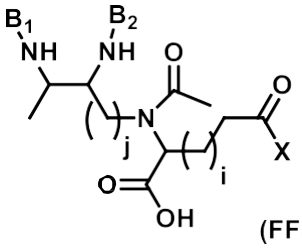

(FF82)

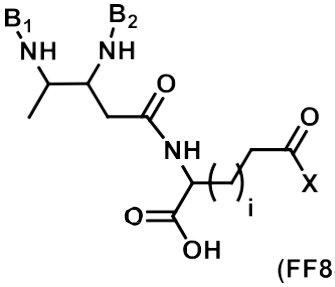

(FF83)


(FF84)


(FF85)


(FF86)


(FF87) y


(FF88);

en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

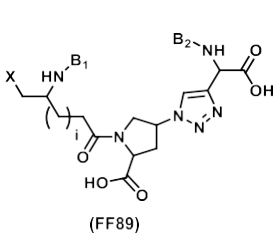
j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

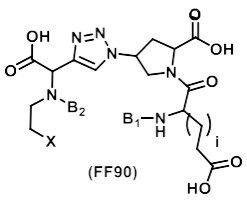
R1a se selecciona de COOH, CH_3, H y OH;

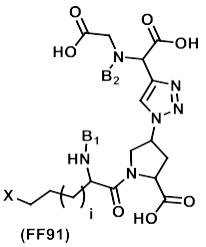
R2, R3, R4 y R5 se seleccionan cada uno independientemente de CH_3, H, OH, y COOH, y al menos uno de R2, R3, R4 y R5 es CH_3 u OH; y

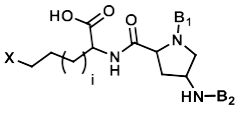
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, son cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

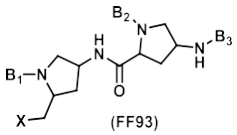
en donde las Fórmulas FF89-FF112 son:

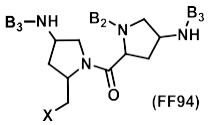

(FF89)

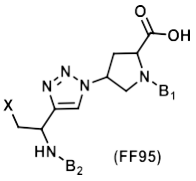

(FF90)

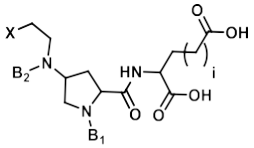

(FF91)

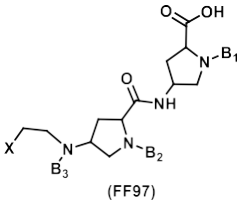

(FF92)

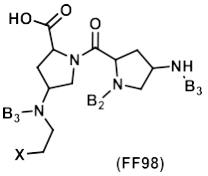

(FF93)

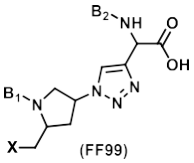

(FF94)

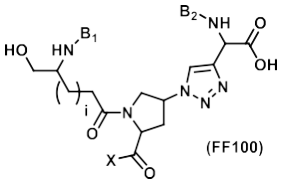

(FF95)

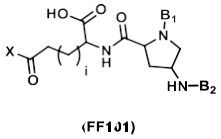

(FF96)

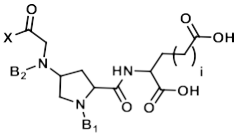

(FF97)

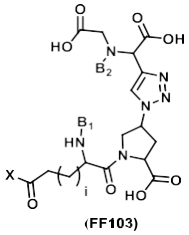

(FF98)

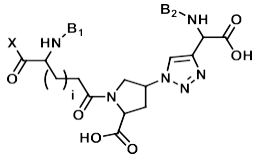

(FF99)

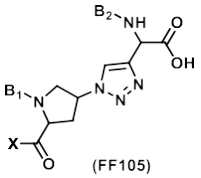

(FF100)

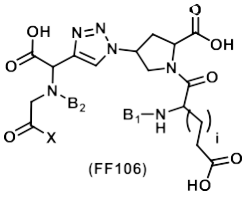

(FF101)

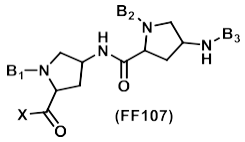

(FF102)

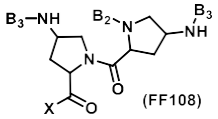

(FF103)

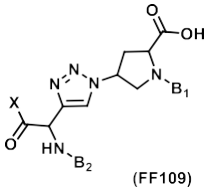

(FF104)

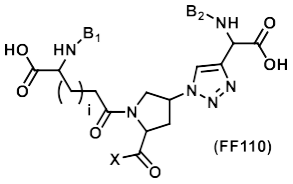

(FF105)

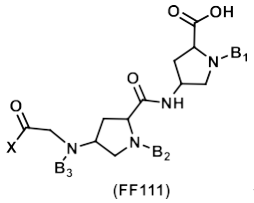

(FF106)

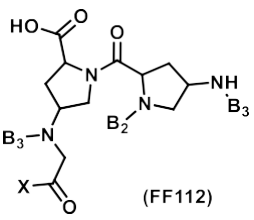

(FF107)


(FF108)


(FF109)


(FF110)


(FF111)

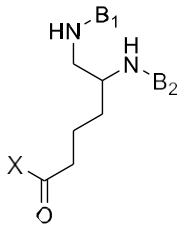
y 
(FF112) ;

en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

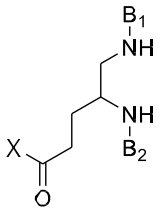
i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7; y

cada uno de B_1, B_2 y B_3, que pueden ser idénticos o diferentes, representa independientemente un grupo aromático que contiene boro, un derivado de ácido carboxílico, o un H, en donde al menos dos de B1, B2 y B3 en cada estructura FF son independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

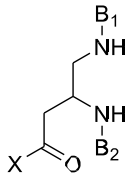
en donde las Fórmulas FF113-FF136 son:



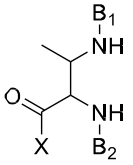
(FF113)



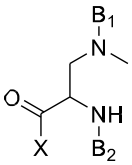
(FF114)



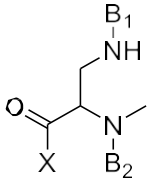
(FF115)



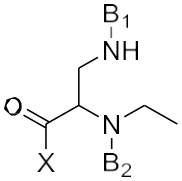
(FF116)



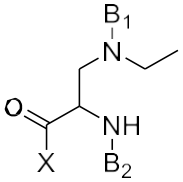
(FF117)



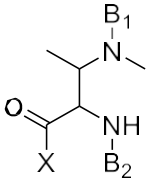
(FF118)



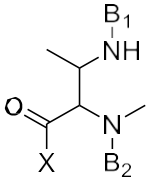
(FF119)



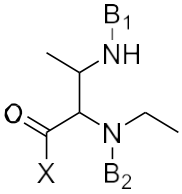
(FF120)



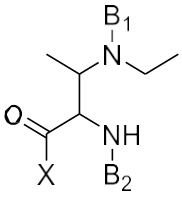
(FF121)



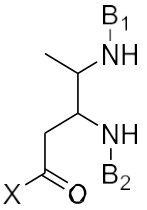
(FF122)



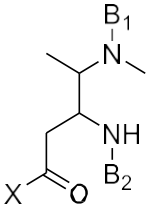
(FF123)



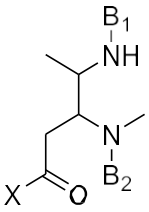
(FF124)



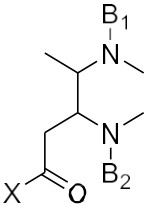
(FF125)



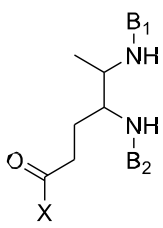
(FF126)



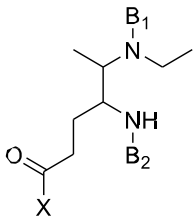
(FF127)



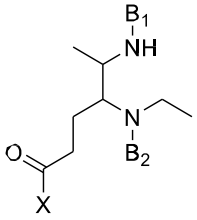
(FF128)



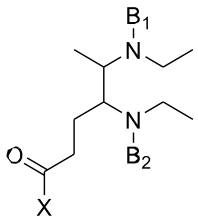
(FF129)



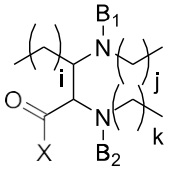
(FF130)



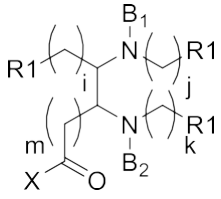
(FF131)



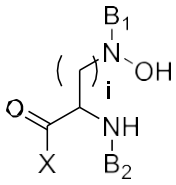
(FF132)



(FF133)

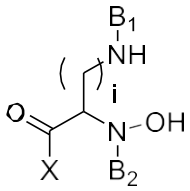


(FF134)



(FF135)

y



(FF136)

;

en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

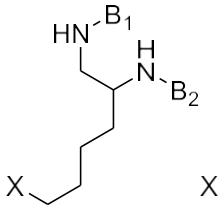
k es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

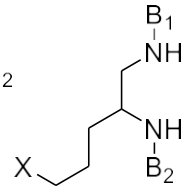
cada R1 se selecciona independientemente de H, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo o arilo; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

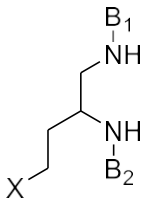
en donde las Fórmulas FF137-FF160 son:



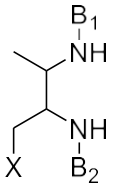
(FF137)



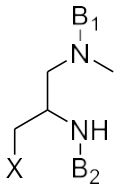
(FF138)



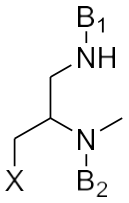
(FF139)



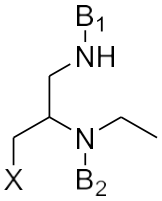
(FF140)



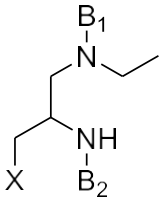
(FF141)



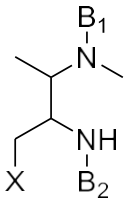
(FF142)



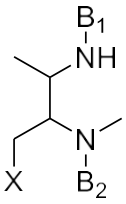
(FF143)



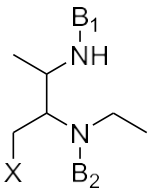
(FF144)



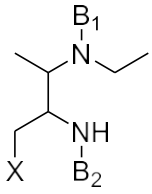
(FF145)



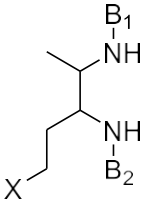
(FF146)



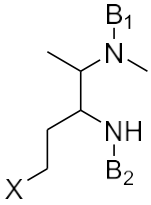
(FF147)



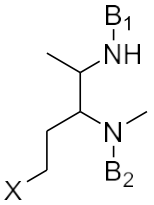
(FF148)



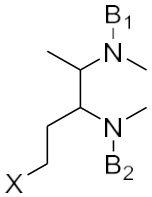
(FF149)



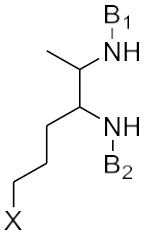
(FF150)



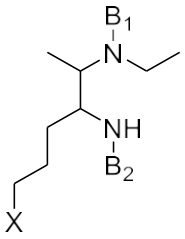
(FF151)



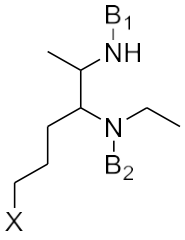
(FF152)



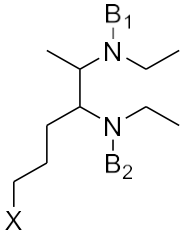
(FF153)



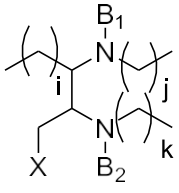
(FF154)



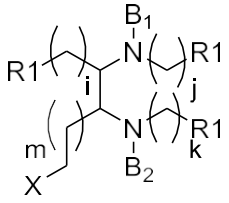
(FF155)



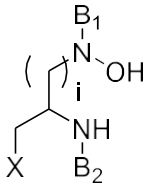
(FF156)



(FF157)

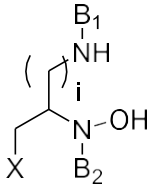


(FF158)



(FF159)

y



(FF160)

;

en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

j es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

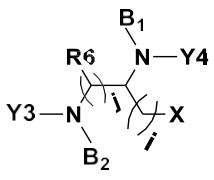
k es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

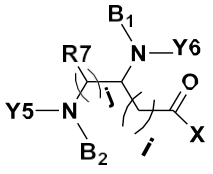
cada R1 se selecciona independientemente de H, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada R1 comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo o arilo; y

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

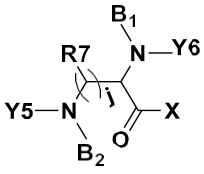
en donde las Fórmulas FF161-FF164 son:



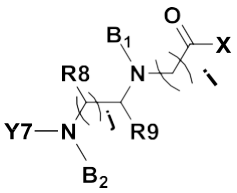
(FF161)



(FF162)



(FF163)



(FF164)

en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

i es 1, 2, 3, 4 o 5;

j es 1, 2, 3, 4, o 5;

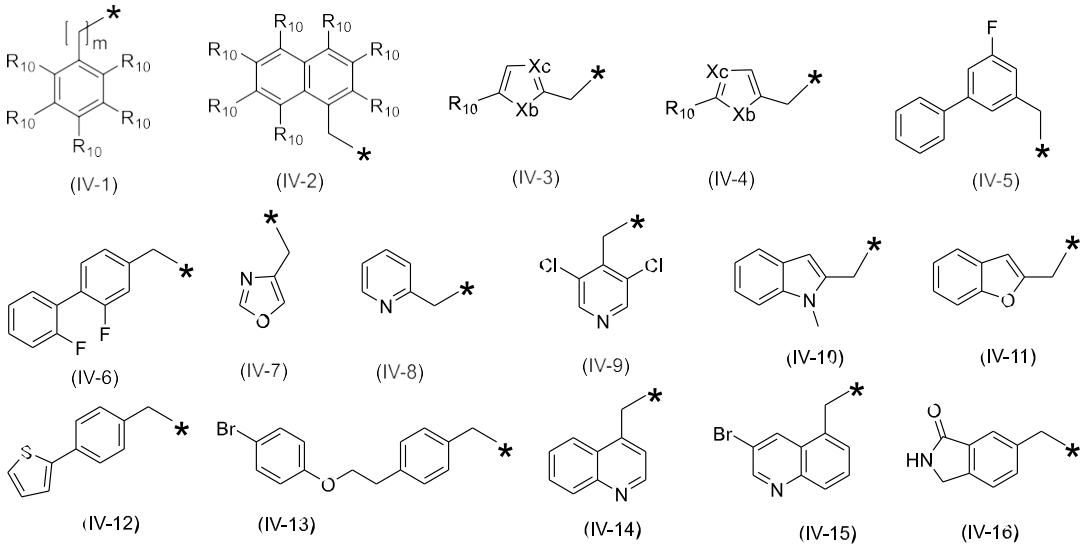
cada R6, R7, R8, y R9 para diferentes valores de j se selecciona independientemente de H, CF_3, CH_3, CHF_2 y $(CH_2)_mCH_3$, en donde m es 1, 2, 3, 4 o 5;

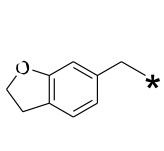
Y3, Y4, Y5, Y6 e Y7 se seleccionan cada uno independientemente de H, CH_2-X4 y las Fórmulas IV-1 a IV-135;

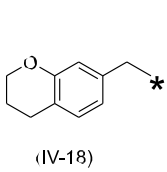
en donde X4 se selecciona de -COOH, -$(CH_2)_m$COOH, un grupo alquilo, un grupo acilo, un grupo cicloalquilo, un grupo haloalquilo, un grupo arilo, y un grupo heteroarilo, cada uno comprende opcionalmente uno o más grupos alquil-haluro, haluro, sulfhidrilo, aldehído, amina, ácido, hidroxilo, alquilo o arilo; en donde m es 1, 2, 3, 4, o 5;

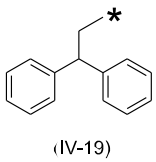
en donde al menos uno de Y5, Y6, e Y7 en las Fórmulas FF162 y FF163 no es H y al menos uno de Y7, R8 y R9 en FF164 no es H; y

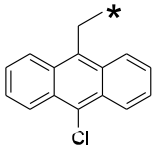
en donde las Fórmulas IV-1 a IV-135 son:

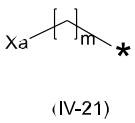


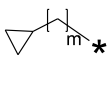

(IV-17)

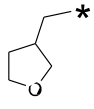

(IV-18)

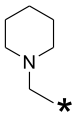

(IV-19)


(IV-20)


(IV-21)

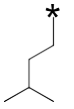

(IV-22)

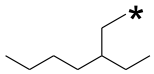

(IV-23)

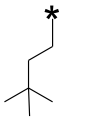

(IV-24)


(IV-25)

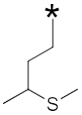

(IV-26)

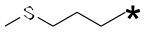

(IV-27)

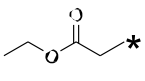

(IV-28)

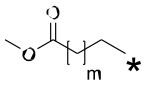

(IV-29)

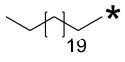

(IV-30)

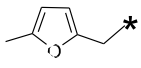

(IV-31)

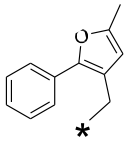

(IV-32)

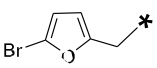

(IV-33)

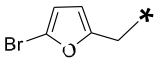

(IV-34)

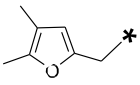

(IV-35)

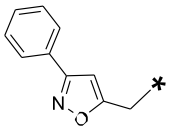

(IV-36)

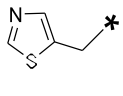

(IV-37)

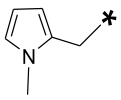

(IV-38)

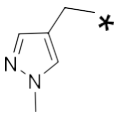

(IV-39)

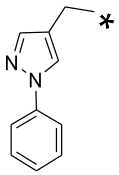

(IV-40)

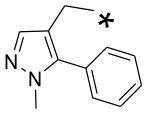

(IV-41)

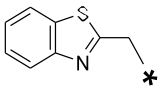

(IV-42)

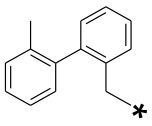

(IV-43)

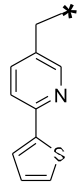

(IV-44)

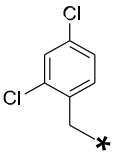

(IV-45)

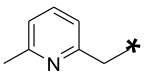

(IV-46)

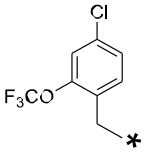

(IV-47)

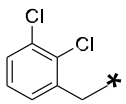

(IV-48)

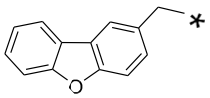

(IV-49)

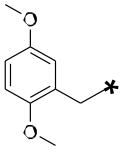

(IV-50)

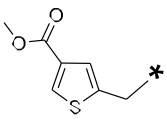

(IV-51)


(IV-52)


(IV-53)


(IV-54)

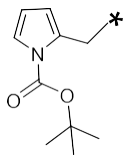

(IV-55)

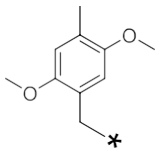

(IV-56)

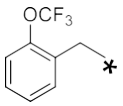
(IV-57)

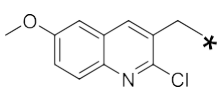
(IV-58)

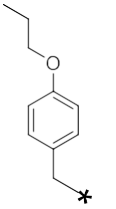
(IV-59)

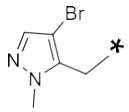

(IV-60)

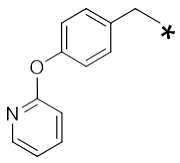

(IV-61)

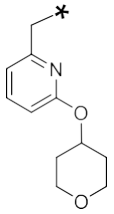

(IV-62)

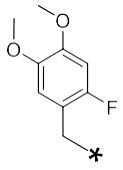

(IV-63)

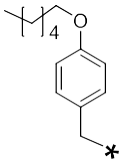

(IV-64)

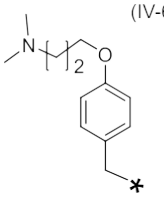

(IV-65)

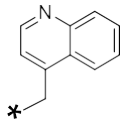

(IV-66)

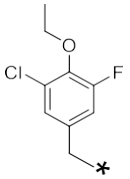

(IV-67)

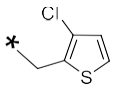

(IV-68)

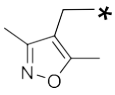

(IV-69)

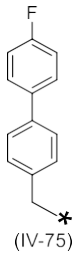

(IV-70)

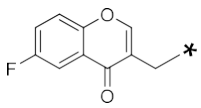

(IV-71)

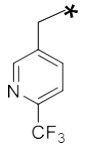

(IV-72)

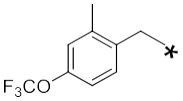

(IV-73)

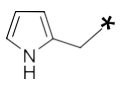

(IV-74)

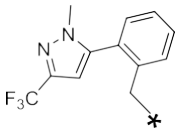

(IV-75)

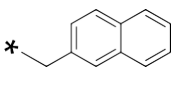

(IV-76)

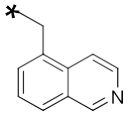

(IV-77)

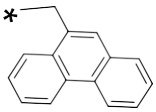

(IV-78)

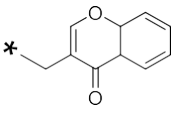

(IV-79)

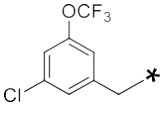

(IV-80)

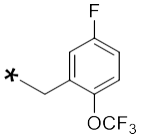

(IV-81)

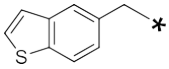

(IV-82)

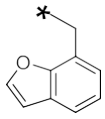

(IV-83)

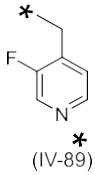

(IV-84)

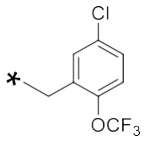

(IV-85)

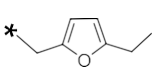

(IV-86)

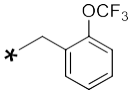

(IV-87)

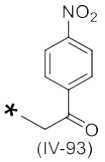

(IV-88)

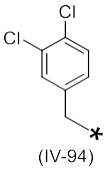

(IV-89)

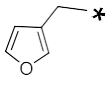

(IV-90)

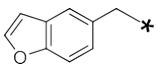

(IV-91)

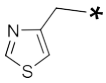

(IV-92)

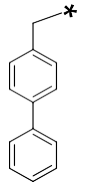

(IV-93)

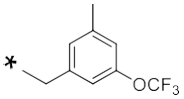

(IV-94)


(IV-95)


(IV-96)


(IV-97)


(IV-98)

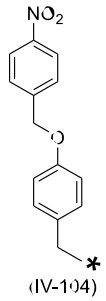

(IV-99)

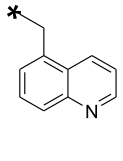
(IV-100)

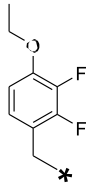
(IV-101)

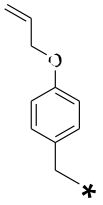
(IV-102)

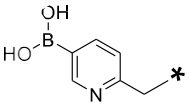
(IV-103)

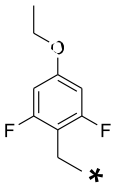

(IV-104)

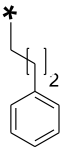

(IV-105)

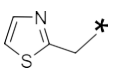

(IV-106)

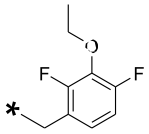

(IV-107)

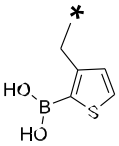

(IV-108)

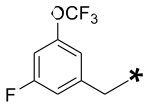

(IV-109)

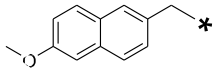

(IV-110)

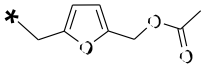

(IV-111)

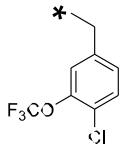

(IV-112)

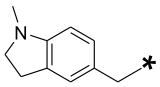

(IV-113)

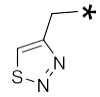

(IV-114)

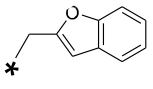

(IV-115)

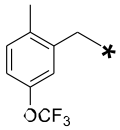

(IV-116)

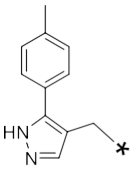

(IV-117)

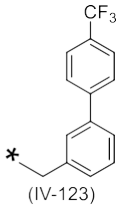

(IV-118)

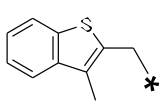

(IV-119)

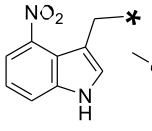

(IV-120)

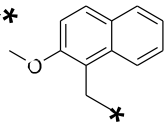

(IV-121)

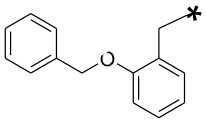

(IV-122)

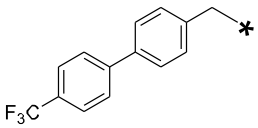

(IV-123)

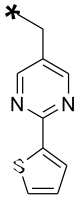

(IV-124)


(IV-125)

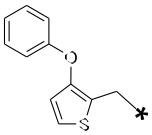

(IV-126)

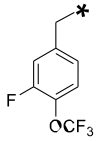

(IV-127)

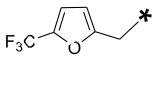

(IV-128)

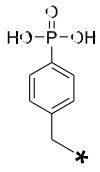

(IV-129)

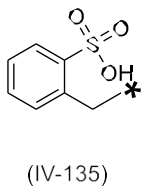

(IV-130)


(IV-131)


(IV-132)


(IV-133)


(IV-134)

y 
(IV-135) ;

en donde:

Xa representa CH=O, CHF_2, CF_3, CH_2SH, COOH, CH_2OH, CH_2NO_2, CH_2NH_2, CH_3, $C(CH_3)_3$, $CH(CH_3)_2$, $CH((CH_2)_3\ CH_3)_2$, o $CH(CH_2\ CH_3)_2$;

Xb representa O, NH, CH_2, o S;

Xc representa CH o N;

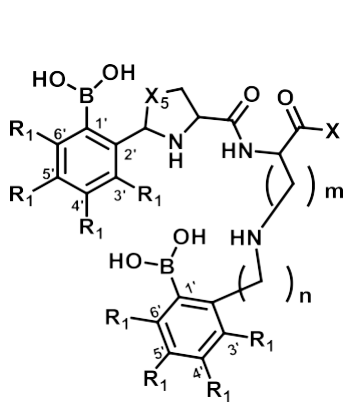
cada R_{10} se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, CH_3, CF_3, CH=O, OH, COOH, y $(CH_2)_nCH_3$,

m es 1, 2, 3, 4, o 5; y n es 1, 2, 3, 4, o 5;

B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

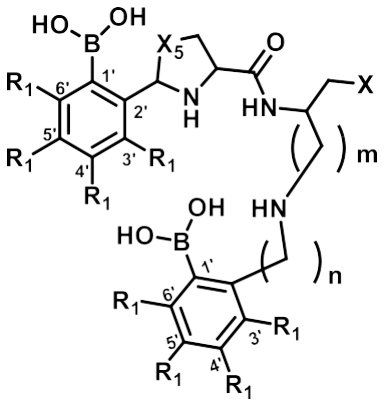
* en las Fórmulas IV-1 a IV-135 representa el punto de unión a las Fórmulas FF161-164 correspondientes; y

en donde las Fórmulas FF165-FF166 son:



(FF165)

y



(FF166)

;

en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

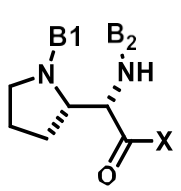
m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

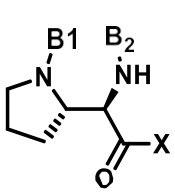
n es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

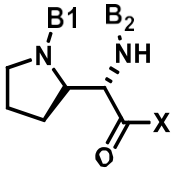
X5 es S, O, o NH; y

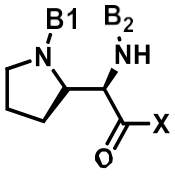
cada R_1 se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7; y

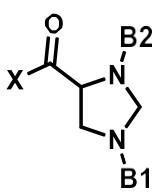
en donde las Fórmulas FF167-FF192 son:

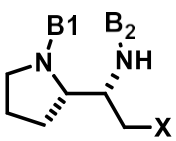

(FF167)

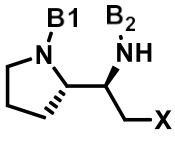

(FF168)

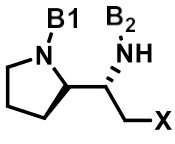

(FF169)

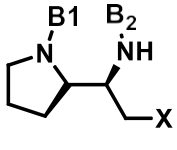

(FF170)

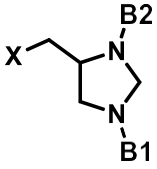

(FF171)

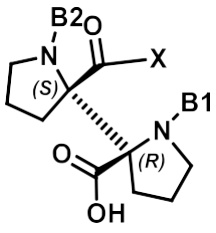

(FF172)

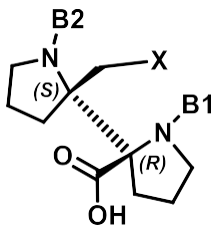

(FF173)

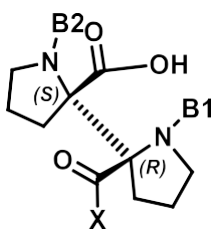

(FF174)

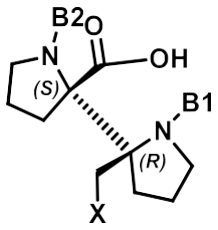

(FF175)

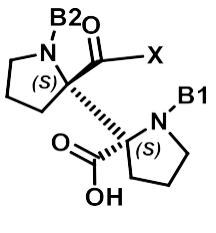

(FF176)

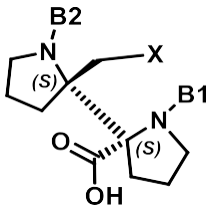

(FF177)

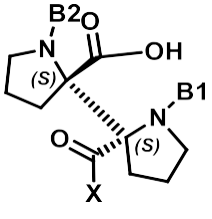

(FF178)

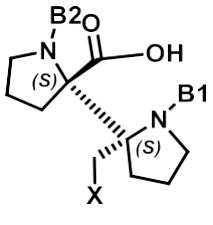

(FF179)

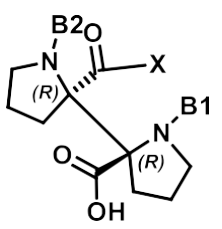

(FF180)


(FF181)

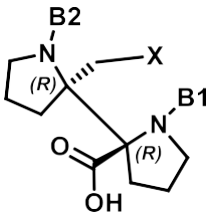

(FF182)


(FF183)

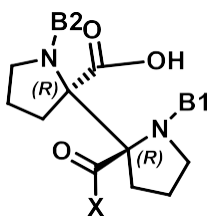

(FF184)



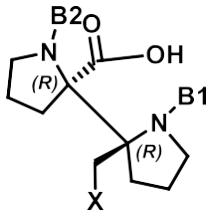
(FF185)



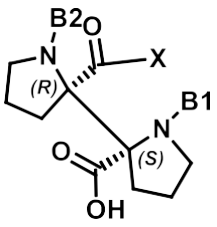
(FF186)



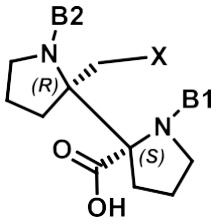
(FF187)



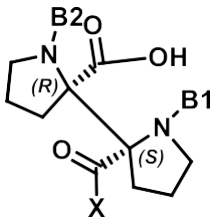
(FF188)



(FF189)

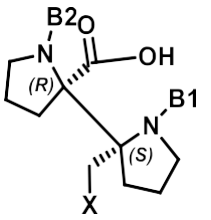


(FF190)



(FF191)

y

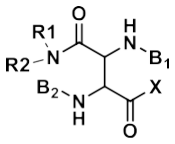


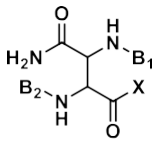
(FF192) ;

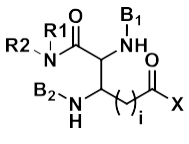
en donde X se selecciona de una maleimida, amina, OH, y halógeno;

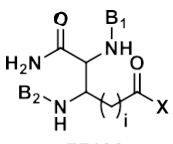
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro, y

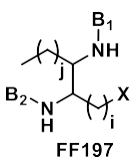
en donde las Fórmulas FF193-FF209 son:

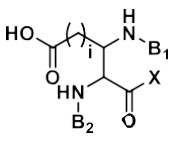

FF193

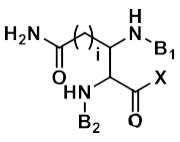

FF194

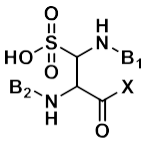

FF195

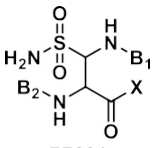

FF196

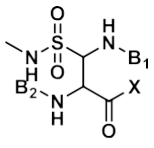

FF197

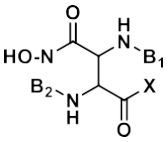

FF198

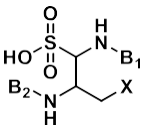

FF199

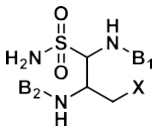

FF200

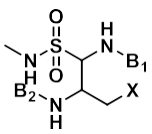

FF201

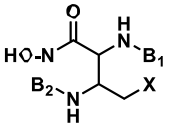

FF202

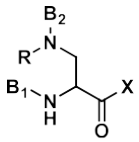

FF203

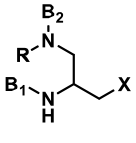

FF204


FF205


FF206


FF207


FF208


FF209

;

en donde R en FF208 y FF209 es un alquilo, arilo o haluro que se conjuga covalentemente a través de al menos un grupo CH_2 con el grupo amino en la cadena lateral de FF208 o FF209;

R1 y R2 se seleccionan independientemente de H, CH_3, alquilo y las Fórmulas IV-1 a IV-135;

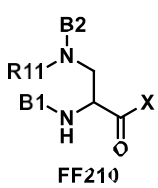
i es 1, 2, 3, 4 o 5;

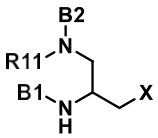
j es 1, 2, 3, 4, o 5; y

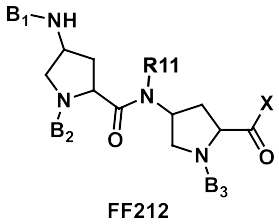
en donde X se selecciona de maleimida, una amina, OH, y halógeno; y

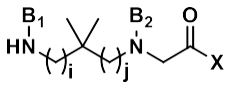
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, representan cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro;

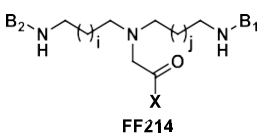
en donde las Fórmulas FF210-FF224 son:

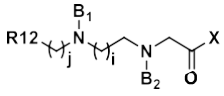

FF210

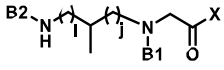

FF211

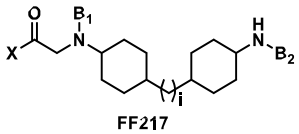

FF212

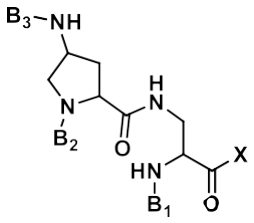

FF213

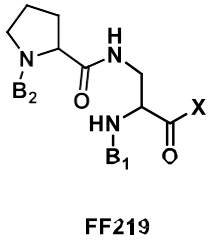

FF214

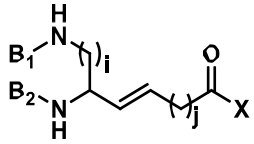

FF215

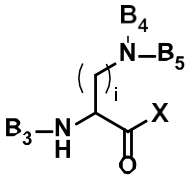

FF216

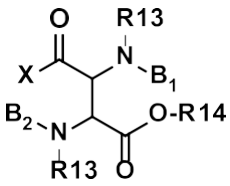

FF217

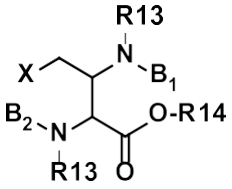

FF218


FF219


FF220


FF221


FF222


FF223


, y FF224;

en donde R11 en FF210 a FF212 se selecciona independientemente de las Fórmulas IV-1 a IV-135 y R12 se selecciona de una amina, un hidroxilo, un alquilo, y un grupo haluro;

en donde cada R13 se seleccionan independientemente de H, CH_3, alquilo, arilo y las Fórmulas IV-1 a IV-135; R14 se selecciona de H, CH_3, alquilo, arilo, o heteroarilo;

en donde X se selecciona independientemente de maleimida, una amina, OH, y halógeno;

X'' es una amina;

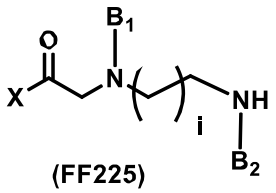
i es 1, 2, 3, 4 o 5;

j es 1, 2, 3, 4, o 5;

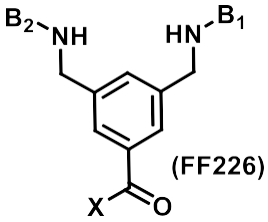
y

B_1, B_2, B_3, B_4, B_5 y B_6 representa cada uno independientemente un grupo aromático que contiene boro, en donde, en cada estructura FF que contiene grupos B1, B2 y B3, al menos dos de los grupos B1, B2 y B3 son independientemente un grupo aromático que contiene boro; y

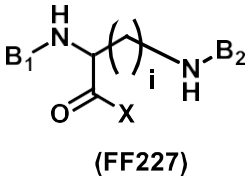
en donde las Fórmulas FF225-FF231 son:



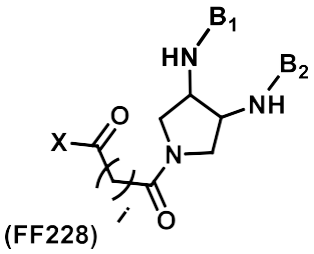
(FF225)



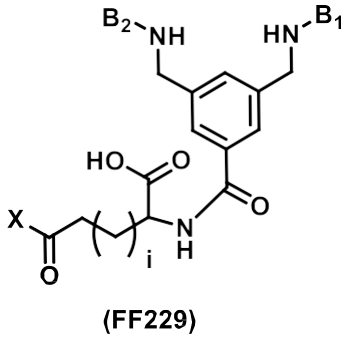
(FF226)



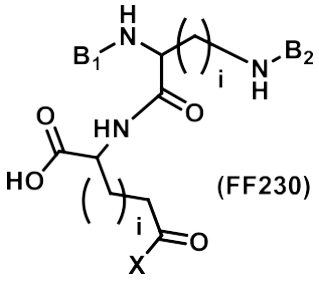
(FF227)



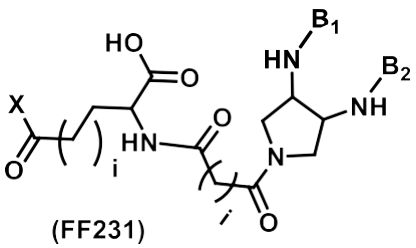
(FF228)



(FF229)



(FF230)



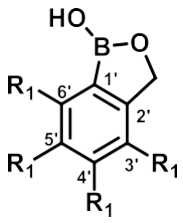
(FF231)

en donde X se selecciona de una maleimida, amina, OH, y halógeno;

i es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

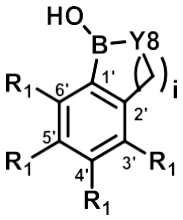
B_1 y B_2, que pueden ser idénticos o diferentes, cada uno representa independientemente un grupo aromático que contiene boro, en donde B_1 y B_2 en las Fórmulas FF225-FF231 no son un ácido borónico o un grupo aromático que contiene boro F2 o F6,

en donde las Fórmulas F2 y F6 son:



(F2)

y



(F6)

;

R_1 en la posición 5' representa (C=O)---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de FF225-FF231;

cero, uno, o dos R_1 representa F, Cl, CF_2, CF_3, SF_5, OCF_3, SO_2CH_3, y/o SO_2CF_3, y cada R_1 restante representa H;

Y8 es O; y

i es 1; y

cada R_1 restante es H;

Y8 es O; y

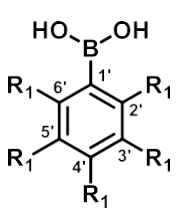
i es 1; y

en donde al menos una amina primaria o secundaria en FF1-FF223 y FF225-FF231 se conjuga covalentemente con B_6; y

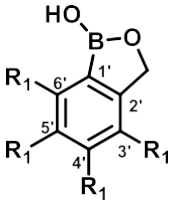
cuando X es una amina en una cualquiera de las Fórmulas FF1 a FF223 y FF225-FF231, X está opcionalmente acetilado o alquilado.

157. El compuesto de la reivindicación 156, en donde el compuesto comprende al menos uno de B_1, B_2 y B_3 seleccionados independientemente de las Fórmulas F1-F11 o en donde el compuesto comprende al menos uno de B_4, B_5 y B_6 seleccionados independientemente de las Fórmulas F1-F11,

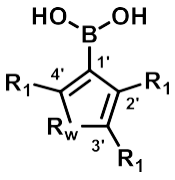
en donde las Fórmulas F1-F11 son:



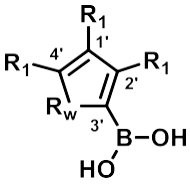
(F1)



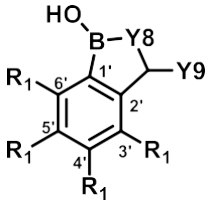
(F2)



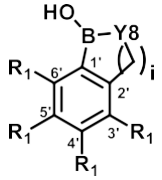
(F3)



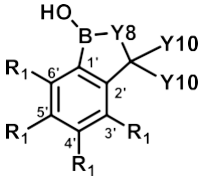
(F4)



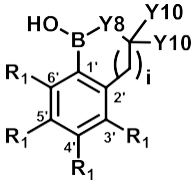
(F5)



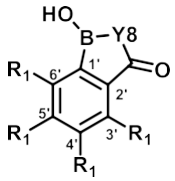
(F6)



(F7)



(F8)

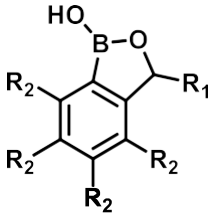


(F9)

, 

(F10)

, y



(F11)

en donde para B_1, B_2, B_3:

un R_1 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---* o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa el punto de unión al resto de Z1c, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_4, B_5:

un R_1 para B_4 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa el punto de unión (que representa un enlace covalente) a una amina en X1 y un R_1 para B_5 representa (C=O)---*, S(=O)(=O)---*, $(CH_2)_m$(C=O)---*, o $(CH_2)_m$---*, en donde ---* representa el punto de unión a la misma amina en X1, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

en donde para B_6:

un R_1 para B_6 representa $(CH_2)_m$---ø, en donde ---ø representa un punto de unión (que representa un enlace covalente) al resto del compuesto, y m es 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

cada R_1 o R_2 restante se selecciona independientemente de H, F, Cl, Br, OH, CH_2-NH_2, NH_2, (C=O)-NH_2, CH=O, SO_2CH_3, SO_2CF_3, CF_3, CHF_2, NO_2, CH_3, OCH_3, $O(CH_2)_mCH_3$, —(SO_2)NH CH_3, —$(SO_2)NH(CH_2)_mCH_3$, y OCF_3, en donde m es 1, 2, 3, 4, 5, 6, o 7;

para las Fórmulas F3-F4:

R_w es O o S;

para las Fórmulas F5-F10:

cuando Y8 es O, i es 2, 3, 4, o 5; o

cuando Y8 es NR, R es un grupo alquilo o H, e i es 1, 2, 3, 4, o 5;

Y9 es H, CH_3 o un grupo alquilo, siempre que, cuando Y8 es O, Y9 sea un CH_3 o un grupo alquilo; y cada Y10 se selecciona independientemente de H, CH_3, F, CF_3, y OCH_3, con la condición de que al menos un Y10 no sea H.

153. El compuesto de la reivindicación 156 o 157, en donde el compuesto se selecciona de:

N-(3-(3-borono-5-nitrobenzamido)propil)-N-(3-borono-5-nitrobenzoil)glicina (DS01);

N-(4-((4-(3-borono-5-nitrobenzamido)ciclohexil)metil)ciclohexil)-N-(3-borono-5-nitrobenzoil)glicina (DS02);

N-(3-((3-borono-5-nitrobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-5-nitrobenzoil)glicina (DS03);

N-(3-((3-borono-5-nitrobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-5-nitrobenzoil)glicina (DS04);

N-(4-(3-borono-5-nitrobenzamido)butil)-N-(3-borono-5-nitrobenzoil)glicina (DS05);

N-(3-(3-borono-5-fluorobenzamido)propil)-N-(3-borono-5-fluorobenzoil)glicina (DS06);

N-(3-(3-borono-5-fluorobenzamido)-2,2-dimetilpropil)-N-(3-borono-5-fluorobenzoil)glicina (DS07);

bis(3-(3-borono-5-fluorobenzamido)propil)glicina (DS08);

N-(4-((3-borono-5-fluorobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-5-fluorobenzoil)glicina (DS09);

N-(3-((3-borono-5-fluorobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-5-fluorobenzoil)glicina (DS10);

N-(2-(3-borono-5-fluorobenzamido)ciclohexil)-N-(3-borono-5-fluorobenzoil)glicina (DS11);

N-(3-(3-borono-4-fluorobenzamido)propil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS12);

N-(4-((4-(3-borono-4-fluorobenzamido)ciclohexil)metil)ciclohexil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS13);

N-(3-(3-borono-4-fluorobenzamido)-2,2-dimetilpropil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS14);

N-(4-((3-borono-4-fluorobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS15);

N-(3-((3-borono-4-fluorobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS16);

N-((1S,2R)-2-(3-borono-4-fluorobenzamido)ciclohexil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS17);

N-((1S,2S)-2-(3-borono-4-fluorobenzamido)ciclohexil)-N-(3-borono-4-fluorobenzoil)glicina (DS18);

N-(3-(3-borono-5-bromobenzamido)propil)-N-(3-borono-5-bromobenzoil)glicina (DS19);

N-(4-((4-(3-borono-5-bromobenzamido)ciclohexil)metil)ciclohexil)-N-(3-borono-5-bromobenzoil)glicina (DS20);

bis(3-(3-borono-5-bromobenzamido)propil)glicina (DS21);

N-(4-((3-borono-5-bromobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-5-bromobenzoil)glicina (DS22);

N-(3-((3-borono-5-bromobenzamido)metil)bencil)-N-(3-borono-5-bromobenzoil)glicina (DS23);

N-(2-(3-borono-5-bromobenzamido)ciclohexil)-N-(3-borono-5-bromobenzoil)glicina (DS24);

N-(3-(4-borono-3-fluorobenzamido)propil)-N-(4-borono-3-fluorobenzoil)glicina (DS25);

N-(4-((4-(4-borono-3-fluorobenzamido)ciclohexil)metil)ciclohexil)-N-(4-borono-3-fluorobenzoil)glicina (DS26);

N-(3-(4-borono-3-fluorobenzamido)-2,2-dimetilpropil)-N-(4-borono-3-fluorobenzoil)glicina (DS27);

bis(3-(4-borono-3-fluorobenzamido)propil)glicina (DS28);

N-(4-((4-borono-3-fluorobenzamido)metil)bencil)-N-(4-borono-3-fluorobenzoil)glicina (DS29);

N-(3-((4-borono-3-fluorobenzamido)metil)bencil)-N-(4-borono-3-fluorobenzoil)glicina (DS30);

N-((1S,2R)-2-(4-borono-3-fluorobenzamido)ciclohexil)-N-(4-borono-3-fluorobenzoil)glicina (DS31);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(3-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2])oxaborol-6-carboxamido)propil)glicina (DS32);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carbonil)-*N*-(5-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2])oxaborol-6-carboxamido)pentil)glicina (DS33);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(3-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2])oxaborol-6-carboxamido)-2,2-dimetilpropil)glicina (DS34);

bis(3-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)propil)glicina (DS35);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(3-((1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]]oxaborol-6-carboxamido)metil)bencil)glicina (DS36);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-((1S,2R)-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)ciclohexil)glicina (DS37);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2])oxaborol-6-carboxamido)butil)glicina (DS38);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-((1S,2S)-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)ciclohexil)glicina (DS39);

(R)-N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)propil)glicina (DS40);

(S)-N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)propil)glicina (DS41);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2])oxaborol-6-carboxamido)ciclohexil)glicina (DS42);

N-(3-(4-borono-3,5-difluorobenzamido)propil)-N-(4-borono-3,5-difluorobenzoil)glicina (DS43);

N-(3-(4-borono-2-fluorobenzamido)propil)-N-(4-borono-2-fluorobenzoil)glicina (DS44);

N-(2-(N-etil-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)etil)-N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)glicina (DS45);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(2-(1-hidroxi-N-(2-hidroxietil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)etil)glicina (DS46);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(5-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2])oxaborol-6-carboxamido)hexil)glicina (DS47);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-N-(4-((4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)ciclohexil)metil)ciclohexil)glicina (DS48);

((2S,4S)-1-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS49);

((2S,4S)-4-(3-borono-4-fluorobenzamido)-1-(3-borono-4-fluorobenzoil)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS50);

((2S,4S)-4-(3-borono-5-nitrobenzamido)-1-(3-borono-5-nitrobenzoil)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS51);

((2S,4S)-4-(5-borono-2-fluorobenzamido)-1-(5-borono-2-fluorobenzoil)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS52);

(S)-(1,4-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)piperazin-2-carbonil)glicina (DS53);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-N-bencil-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS54);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-(4-(trifluorometil)bencil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS55);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-N-etil-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS56);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-propil-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS57);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-isobutil-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS58);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-((5-(tiofen-2-il)piridin-2-il)metil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS59);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-isopentil-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS60);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-(quinolin-5-ilmetil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS61);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-(2-(trifluorometoxi)bencil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS62);

(S)-N-(3-amino-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-3-oxopropil)-1-hidroxi-N-(4-(metilsulfonil)bencil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS63);

ácido (3-((2S,4S)-4-(5-borono-2-(metilsulfonil)benzamido)-2-carbamoilpirrolidin-1-carbonil)-4-(metilsulfonil)fenil)borónico (DS64);

ácido (4-(((3S,5S)-1-(4-borono-2,6-difluorobenzoil)-5-carbamoilpirrolidin-3-il)carbamoil)-3,5-difluorofenil)borónico (DS65);

ácido (R,E)-4,5-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pent-2-enoico (DS66);

(2S,4S)-1-(1-hidroxi-4-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-4-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carboxamida (DS67);

N,N'-((2S,3S)-1-amino-1-oxobutan-2,3-diil)bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida) (DS68);

ácido (R)-3,4-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)butanoico (DS69);

ácido 3-((2S,4S)-1-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carboxamido)propanoico (DS70);

ácido (S)-3-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-5-carboxamido)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)butanoico (DS71);

ácido (R)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-5-carboxamido)-5-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pentanoico (DS72);

ácido (2S,4R)-1-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carboxílico (DS73);

ácido (2S,4R)-1-(1-hidroxi-4-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-4-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carboxílico (DS74);

ácido (2S,3S)-3-(1-hidroxi-4-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-2-(1-hidroxi-7-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-5-carboxamido)butanoico (DS75);

ácido (R)-5-(1-hidroxi-4-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-4-(1-hidroxi-7-(trifluorometil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-5-carboxamido)pentanoico (DS76);

((2S,4S)-1-(5-borono-2-nitrobenzoil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS77);

((2S,4S)-1-(5-borono-2-(metilsulfonil)benzoil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS78);

((2S,4S)-1-(3-borono-2,6-difluorobenzoil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carbonil)glicina (DS79);

ácido (S)-(3-((3-borono-4-fluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-nitrofenil)borónico (DS80);

ácido (S)-(3-((4-borono-3,5-difluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-nitrofenil)borónico (DS81);

ácido (S)-(3-((3-boronobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-nitrofenil)borónico (DS82);

ácido (S)-(3-((4-borono-2-metoxibencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-nitrofenil)borónico (DS83);

ácido (S)-(3-((4-borono-2-(trifluorometil)bencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-nitrofenil)borónico (DS84);

ácido (S)-(5-((3-borono-N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-4-fluorobenzamido)metil)-2-fluorofenil)borónico (DS85);

ácido (S)-(5-((4-borono-3,5-difluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS86);

ácido (S)-(3-((3-borono-N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-4-fluorobenzamido)metil)fenil)borónico (DS87);

ácido (S)-(5-((4-borono-2-metoxibencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS88);

ácido (S)-(5-((4-borono-3-(trifluorometil)bencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS89);

ácido (S)-(4-((3-borono-4-fluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS90);

ácido (S)-(4-((4-borono-3,5-difluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS91);

ácido (S)-(4-((3-boronobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS92);

ácido (S)-(4-((4-borono-2-metoxibencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS93);

ácido (S)-(4-((4-borono-2-(trifluorometil)bencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-2-fluorofenil)borónico (DS94);

ácido (S)-(5-((3-borono-5-bromo-N-(5,6-diamino-6-oxohexil)benzamido)metil)-2-fluorofenil)borónico (DS95);

ácido (S)-(3-((4-borono-3,5-difluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-bromofenil)borónico (DS96);

ácido (S)-(3-((3-borono-5-bromo-N-(5,6-diamino-6-oxohexil)benzamido)metil)fenil)borónico (DS97);

ácido (S)-(3-((3-borono-5-bromo-N-(5,6-diamino-6-oxohexil)benzamido)metil)-5-metoxifenil)borónico (DS98);

ácido (S)-(3-((4-borono-2-(trifluorometil)bencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-bromofenil)borónico (DS99);

ácido (S)-(3-((3-borono-4-fluorobencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-fluorofenil)borónico (DS100);

ácido (S)-(3-((4-borono-3-metoxibencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-fluorofenil)borónico (DS101);

ácido (S)-(3-((4-borono-2-(trifluorometil)bencil)(5,6-diamino-6-oxohexil)carbamoil)-5-fluorofenil)borónico (DS102);

ácido (S)-(4-((N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)metil)-2-fluorofenil)borónico (DS103);

ácido (S)-(4-((N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)metil)-2,6-difluorofenil)borónico (DS104);

ácido (S)-(3-((N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)metil)fenil)borónico (DS105);

ácido (S)-(4-((N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)metil)-3-metoxifenil)borónico (DS106);

(S)-N-(5,6-diamino-6-oxohexil)-1-hidroxi-N-((1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-il)metilo)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS107);

(S)-N-(4-amino-3-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-4-oxobutil)-1-hidroxi-N-((1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-il)metil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS108);

(S)-N-(6-amino-5-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamido)-6-oxohexil)-1-hidroxi-N-((1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-il)metil)-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-6-carboxamida (DS109);

ácido (2*S*,4*S*)-1-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-2-carboxílico (DS110);

ácido (2*S*,3*S*)-2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-5-carboxamido)-3-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)butanoico (DS111);

ácido (2*S*,4*R*)-1-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carbonil)-4-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidina-2-carboxílico (DS112);

N-(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carbonil)-*N*-(2-(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)etil)glicina (DS113);

N-(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carbonil)-*N*-(2-(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)etil)glicina (DS114);

N-(2-(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)etil)-*N*-(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetil)glicina (DS115);

N-(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carbonil)-*N*-(2-(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)etil)glicina (DS116);

N-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carbonil)-*N*-(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)etil)glicina (DS117);

ácido 3,5-bis((1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)metil)benzoico (DS118);

ácido 3,5-bis((1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)metil)benzoico (DS119);

ácido 3,5-bis((2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)metil)benzoico (DS120);

ácido 3,5-bis((1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)metil)benzoico (DS121);

ácido 3,5-bis((1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)metil)benzoico (DS122);

ácido (*S*)-3-(2,3-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)propanamido)propanoico (DS123);

ácido (*S*)-3-(2,3-bis(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)propanamido)propanoico (DS124);

ácido (*S*)-3-(2,3-bis(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)propanamido)propanoico (DS125);

ácido (*S*)-3-(2,3-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)propanamido)propanoico (DS126);

ácido 3-((2*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)propanamido)propanoico (DS127);

ácido (3,5-bis((1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)metil)benzoil)glutámico (DS128);

ácido (3,5-bis((1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)metil)benzoil)glutámico (DS129);

ácido (3,5-bis((2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)metil)benzoil)glutámico (DS130);

ácido (3,5-bis((1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)metil)benzoil)glutámico (DS131);

ácido (3,5-bis((1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)metil)benzoil)glutámico (DS132);

ácido 4-(3,4-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoico (DS133);

ácido 4-(3,4-bis(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoico (DS134);

ácido 4-(3,4-bis(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoico (DS135);

ácido 4-(3,4-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[c][1,2]oxaborol-7-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoico (DS136);

ácido 4-(3,4-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoico (DS137);

ácido ((*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)propanoil)-*L*-glutámico (DS138);

ácido ((*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)propanoil)-*L*-glutámico (DS139);

ácido ((*S*)-2,3-bis(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)propanoil)-*L*-glutámico (DS140);

ácido ((*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)propanoil)-*L*-glutámico (DS141);

ácido ((2*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)propanoil)-*L*-glutámico (DS142);

ácido (4-(3,4-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoil)-*L*-glutámico (DS143);

ácido (4-(3,4-bis(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoil)-*L*-glutámico (DS144);

ácido (4-(3,4-bis(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoil)-*L*-glutámico (DS145);

ácido (4-(3,4-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoil)-*L*-glutámico (DS146);

ácido (4-(3,4-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)pirrolidin-1-il)-4-oxobutanoil)-*L*-glutámico (DS147);

ácido (*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-3,4-dihidro-1*H*-benzo[*c*][1,2]oxaborinina-7-carboxamido)propanoico (DS149);

ácido (*S*)-2,3-bis(2-(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-il)acetamido)propanoico (DS150);

ácido (*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-3,3-dimetil-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-7-carboxamido)propanoico (DS151); y

ácido (2*S*)-2,3-bis(1-hidroxi-1,3-dihidrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-3-carboxamido)propanoico (DS152).

159. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150 y 156-158, en donde el compuesto se usa como un intermedio en la elaboración de una sustancia farmacológica o un producto terapéutico de un compuesto profiláctico.

160. Un análogo de insulina humano, que comprende una cadena A y una cadena B, en donde la secuencia de la cadena A comprende:

$X_{aa'}X_{bb'}X_{cc'}X_{dd'}X_{ee'}X_{ff'}X_{gg'}$VEQCC$X_{hh'}X_{ii'}$ICSLYQLENYCN$X_{jj'}X_{kk'}X_{ll'}X_{mm'}X_{nn'}X_{oo'}X_{pp'}$ (sec. con núm. de ident.:24015); y

en donde la secuencia de la cadena B comprende:

(i)

$X_{aa}X_{bb}X_{cc}X_{dd}$K$X_{ee}X_{ff}X_{gg}X_{hh}X_{ii}X_{jj}KX_{kk}X_{ll}X_{mm}X_{nn}$QHLCGSHLVEALYLVC$X_{oo}X_{pp}X_{qq}$GFFYT$X_{rr}X_{ss}X_{tt}X_{uu}X_{vv}X_{ww}$ (sec. con núm. de ident.: 24016),

en donde cada uno de $X_{aa'}$, $X_{bb'}$, $X_{cc'}$, $X_{dd'}$,$X_{ee'}$, $X_{ff'}$, $X_{gg'}$, $X_{hh'}$, $X_{ii'}$, $X_{jj'}$, $X_{kk'}$, $X_{ll'}$, $X_{mm'}$, $X_{nn'}$, $X_{oo'}$, $X_{pp'}$, X_{aa}, X_{bb}, X_{cc}, X_{dd}, X_{ee}, X_{ff}, X_{gg}, X_{hh}, X_{ii}, X_{jj}, X_{kk}, X_{ll}, X_{mm}, X_{nn}, X_{oo}, X_{pp}, X_{qq}, X_{rr}, X_{ss}, Xtt, X_{uu}, X_{vv}, y X_{ww} está independientemente ausente o se selecciona de los residuos de aminoácidos A, D, E, F, G, H, I, K, L, N, P, Q, R, S, T, V, Y y W,

(ii)

$X_{aa}X_{bb}X_{cc}X_{dd}$KP$X_{ee}X_{ff}X_{gg}X_{hh}X_{ii}X_{jj}X_{kk}X_{ll}X_{mm}X_{nn}$QHLCGSHLVEALYLVC$X_{oo}X_{pp}X_{qq}$GFFYT$X_{rr}X_{ss}X_{tt}X_{uu}X_{vv}X_{ww}$ (sec. con núm. de ident.: 24017),

en donde cada uno de $X_{aa'}$, $X_{bb'}$, $X_{cc'}$, $X_{dd'}$,$X_{ee'}$, $X_{ff'}$, $X_{gg'}$, $X_{hh'}$, $X_{ii'}$, $X_{jj'}$, $X_{kk'}$, $X_{ll'}$, $X_{mm'}$, $X_{nn'}$, $X_{oo'}$, $X_{pp'}$, X_{aa}, X_{bb}, X_{cc}, X_{dd}, X_{ff}, X_{gg}, X_{hh}, X_{ii}, X_{jj}, X_{kk}, X_{ll}, X_{mm}, X_{nn}, X_{oo}, X_{pp}, X_{qq}, X_{rr}, X_{ss}, Xtt, X_{uu}, X_{vv}, y X_{ww} está independientemente ausente o se selecciona de los residuos de aminoácidos A, D, E, F, G, H, I, K, L, N, P, Q, R, S, T, V, Y y W, y en donde X_{ee} se selecciona de los residuos de aminoácidos A, E, F, H, I, K, L, N, P, Q, R, S, T, V, Y y W,

(iii)

$X_{aa}X_{bb}X_{cc}X_{dd}KX_{ee}X_{ff}X_{gg}X_{hh}X_{ii}X_{jj}KX_{kk}X_{ll}X_{mm}X_{nn}$QHLCGSHLVEALYLVC$X_{oo}X_{pp}X_{qq}$GFFYT$X_{rr}$ $X_{ss}X_{tt}X_{uu}X_{vv}X_{ww}$ (sec. con núm. de ident.: 24018),

en donde cada uno de $X_{aa'}$, $X_{bb'}$, $X_{cc'}$, $X_{dd'}$,$X_{ee'}$, $X_{ff'}$, $X_{gg'}$, $X_{hh'}$, $X_{ii'}$, $X_{jj'}$, $X_{kk'}$, $X_{ll'}$, $X_{mm'}$, $X_{nn'}$, $X_{oo'}$, $X_{pp'}$, X_{aa}, X_{bb}, X_{cc}, X_{dd}, X_{ee}, X_{ff}, X_{gg}, X_{hh}, X_{ii}, X_{jj}, X_{kk}, X_{ll}, X_{mm}, X_{nn}, X_{oo}, X_{pp}, X_{qq}, X_{rr}, X_{ss}, X_{tt}, X_{uu}, X_{vv}, y X_{ww} está independientemente ausente o se selecciona de los residuos de aminoácidos A, D, E, F, G, H, I, K, L, N, P, Q, R, S, T, V, Y, W y al menos uno de X_{ee},X_{ff},X_{gg},X_{hh},X_{ii},X_{jj} está presente y al menos uno de X_{ee},X_{ff},X_{gg},X_{hh},X_{ii},X_{jj} es G,

(iv)

$X_{aa}X_{bb}X_{cc}X_{dd}KX_{ee}X_{ff}X_{gg}X_{hh}X_{ii}X_{jj}KX_{kk}X_{ll}X_{mm}X_{nn}$QHLCGSHLVEALYLVC$X_{oo}X_{pp}X_{qq}$GFFYT$X_{rr}$ $X_{ss}X_{tt}X_{uu}X_{vv}X_{ww}$ (sec. con núm. de ident.: 24019),

en donde cada uno de $X_{aa'}$,$X_{bb'}$,$X_{cc'}$, $X_{dd'}$,$X_{ee'}$, $X_{ff'}$, $X_{gg'}$, $X_{hh'}$, $X_{ii'}$, $X_{jj'}$, $X_{kk'}$, $X_{ll'}$, $X_{mm'}$, $X_{nn'}$, $X_{oo'}$, $X_{pp'}$, X_{aa}, X_{bb}, X_{cc}, X_{dd}, X_{ee}, X_{ff}, X_{gg}, X_{hh}, X_{ii}, X_{jj}, X_{kk}, X_{ll}, X_{mm}, X_{nn}, X_{oo}, X_{pp}, X_{qq}, X_{rr}, X_{ss}, X_{tt}, X_{uu}, X_{vv}, y X_{ww} está independientemente ausente o se selecciona de los residuos de aminoácidos A, D, E, F, G, H, I, K, L, N, P, Q, R, S, T, V, Y, W y al menos uno de X_{ee},X_{ff},X_{gg},X_{hh},X_{ii},X_{jj} está presente y al menos uno de X_{ee},X_{ff},X_{gg},X_{hh},X_{ii},X_{jj} es S, o

(v)

$X_{aa}X_{bb}X_{cc}X_{dd}KX_{ee}X_{ff}X_{gg}X_{hh}X_{ii}X_{jj}KX_{kk}X_{ll}X_{mm}X_{nn}$QHLCGSHLVEALYLVC$X_{oo}X_{pp}X_{qq}$GFFYT$X_{rr}$ $X_{ss}X_{tt}X_{uu}X_{vv}X_{ww}$ (sec. con núm. de ident.: 24020),

en donde cada uno de $X_{aa'}$,$X_{bb'}$,$X_{cc'}$, $X_{dd'}$,$X_{ee'}$, $X_{ff'}$, $X_{gg'}$, $X_{hh'}$, $X_{ii'}$, $X_{jj'}$, $X_{kk'}$, $X_{ll'}$, $X_{mm'}$, $X_{nn'}$, $X_{oo'}$, $X_{pp'}$, X_{aa}, X_{bb}, X_{cc}, X_{dd}, X_{ee}, X_{ff}, X_{gg}, X_{hh}, X_{ii}, X_{jj}, X_{kk}, X_{ll}, X_{mm}, X_{nn}, X_{oo}, X_{pp}, X_{qq}, X_{rr}, X_{ss}, Xtt, X_{uu}, X_{vv}, y X_{ww} está independientemente ausente o se selecciona de los residuos de aminoácidos A, D, E, F, G, H, I, K, L, N, P, Q, R, S, T, V, Y, W y al menos dos de X_{ee},X_{ff},X_{gg},X_{hh},X_{ii},X_{jj} están presentes y al menos uno de X_{ee},X_{ff},X_{gg},X_{hh},X_{ii},X_{jj} es S y otro es G.

161. La insulina de la reivindicación 160, en donde la cadena A comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 1 y 3 a 33, y opcionalmente se adjunta en el terminal N y/o en el terminal C por al menos uno seleccionado de KA, KD, KE., KF, KG, KH, KI, KL, KN, KP, KQ, KR, KS, KT, KY, KAA, KAD, KAE, KAF, KAG, KAH, KAI, KAL, KAN, KAQ, KAR, KAS, KAT, KAY, KDA, KDD, KDE, KDF, KDG, KDH, KDI, KDL, KDN, KDQ, KDR, KDS, KDT, KDY, KEA, KED, KEE, KEF, KEG, KEH, KEI, KEL, KEN, KEQ, KER, KES, KET, LLAVE, KFA, KFD, KFE, KFF, KFG, KFH, KFI, KFL, KFN, KFQ, KFR, KFS, KFT, KFY, KGA, KGD, KGE, KGF, KGG, KGH, KGI, KGL, KGN, KGQ, KGR, KGS, KGT, KGY, KHA, KHD, KHE, KHF, KHG, KHH, KHI, KHL, KHN, KHQ, KHR, KHS, KHT, KHY, KIA, KID, KIE, KIF, KIG, KIH, KII, KIL, KIN, KIQ, KIR, KIS, KIT, KIY, KLA, KLD, KLE, KLF, KLG, KLH, KLI, KLL, KLN, KLQ, KLR, KLS, KLT, KLY, KNA, KND, KNE, KNF, KNG, KNH, KNI, KNL, KNN, KNQ, KNR, KNS, KNT, KNY, KPA, KPD, KPE, KPF, KPG, KPH, KPI, KPL, KPN, KPQ, KPR, KPS, KPT, KPY, KQA, KQD,

KQE, KQF, KQG, KQH, KQI, KQL, KQN, K QQ, KQR, KQS, KQT, KQY, KRA, KRD, KRE, KRF, KRG, KRH, KRI, KRL, KRN, KRQ, KRR, KRS, KRT, KRY, KSA, KSD, KSE, KSF, KSG, KSH, KSI, KSL, KSN, KSQ, KSR, KSS, KST, KSY, KTA, KTD, KTE, KTF, KTG, KTH, KTI, KTL, KTN, KTQ, KTR, KTS, KTT, KTY, KYA, KYD, KYE, KYF, KYG, KYH, KYI, KYL, KYN, KYQ, KYR, KYS, KYT, KYY, sec. con núm. de ident. 75 a 24014, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050), GKGSKK (sec. con núm. de ident.: 24045), GKKPGKK (sec. con núm. de ident.: 24046), GKGPSK (sec. con núm. de ident.: 24044), GKPSHKP (sec. con núm. de ident.: 24043) y GSHKGSHK (sec. con núm. de ident.: 24042); y

en donde la cadena B comprende una secuencia seleccionada de las sec. con núms. de ident.: 2 y 34 a 74, 24047 y 24048, y está opcionalmente unida al extremo terminal N y/o al extremo terminal C por al menos uno seleccionado de KA, KD, KE, KF, KG, KH, KI, KL, KN, KP, KQ, KR, KS, KT, KY, KAA, KAD, KAE, KAF, KAG, KAH, KAI, KAL, KAN, KAQ, KAR, KAS, KAT, KAY, KDA, KDD, KDE, KDF, KDG, KDH, KDI, KDL, KDN, KDQ, KDR, KDS, KDT, KDY, KEA, KED, KEE, KEF, KEG, KEH, KEI, KEL, KEN, KEQ, KER, KES, KET, KEY, KFA, KFD, KFE, KFF, KFG, KFH, KFI, KFL, KFN, KFQ, KFR, KFS, KFT, KFY, KGA, KGD, KGE, KGF, KGG, KGH, KGI, KGL, KGN, KGQ, KGR, KGS, KGT, KGY, KHA, KHD, KHE, KHF, KHG, KHH, KHI, KHL, KHN, KHQ, KHR, KHS, KHT, KHY, KIA, KID, KIE, KIF, KIG, KIH, KII, KIL, KIN, KIQ, KIR, KIS, KIT, KIY, KLA, KLD, KLE, KLF, KLG, KLH, KLI, KLL, KLN, KLQ, KLR, KLS, KLT, KLY, KNA, KND, KNE, KNF, KNG, KNH, KNI, KNL, KNN, KNQ, KNR, KNS, KNT, KNY, KPA, KPD, KPE, KPF, KPG, KPH, KPI, KPL, KPN, KPQ, KPR, KPS, KPT, KPY, KQA, KQD, KQE, KQF, KQG, KQH, KQI, KQL, KQN, KQQ, KQR, KQS, KQT, KQY, KRA, KRD, KRE, KRF,

KRG, KRH, KRI, KRL, KRN, KRQ, KRR, KRS, KRT, KRY, KSA, KSD, KSE, KSF, KSG, KSH, KSI, KSL, KSN, KSQ, KSR, KSS, KST, KSY, KTA, KTD, KTE, KTF, KTG, KTH, KTI, KTL, KTN, KTQ, KTR, KTS, KTT, KTY, KYA, KYD, KYE, KYF, KYG, KYH, KYI, KYL, KYN, KYQ, KYR, KYS, KYT, KYY, sec. con núm. de ident.: 75 a 24014, KGSH (sec. con núm. de ident.: 24049), GKGSH (sec. con núm. de ident.: 24050), GKGSKK (sec. con núm. de ident.: 24045), GKKPGKK (sec. con núm. de ident.: 24046), GKGPSK (sec. con núm. de ident.: 24044), GKPSHKP (sec. con núm. de ident.: 24043), y GSHKGSHK (sec. con núm. de ident.: 24042).

162. La insulina de la reivindicación 160, en donde no se añaden o eliminan más de 4 residuos de la cadena A y/o la cadena B.

163. La insulina de la reivindicación 160, en donde un residuo K está presente en el terminal N de la cadena A y/o la cadena B, y/o en donde no más de tres residuos K están presentes en el terminal N de la cadena A y/o la cadena B, y/o

en donde (i) la tirosina en A14 se reemplaza con ácido glutámico, y/o (ii) la tirosina en B16 se reemplaza con histidina, y/o (iii) la fenilalanina en B25 se reemplaza con una histidina, y/o

en donde de uno a tres residuos seleccionados de los residuos B20, B21, y B22-B29 de la cadena B, el residuo A4 o A8 de la cadena A y los residuos de un polipéptido opcionalmente extendido son residuos de lisina, y/o

en donde solo un residuo de K está presente a una distancia de 10 residuos o menos del terminal N de la cadena B.

164. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 101-150 y 156-159, en donde X1 comprende la insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163.

165. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde un grupo amino de las cadenas laterales de uno a cuatro residuos de lisina se conjuga covalentemente cada uno independientemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102.

166. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde la insulina se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102,

n'=0 y el terminal C de Z1a se conjuga directamente con el terminal N de la cadena B de la insulina mediante un enlace peptídico;

Z1a comprende al menos un aminoácido seleccionado de K, P, E, G, S, T, A, y R, de tal manera que la secuencia comprende al menos una lisina, al menos una prolina, y al menos un aminoácido seleccionado de H, R, A y T; y

el grupo amino de al menos una cadena lateral de lisina en Z1a está conjugado covalentemente como se describe en la fórmula.

167. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde la insulina se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102,

Z1a comprende un polipéptido que comprende la secuencia $(XA_1A_2A_3X)_m$ (sec. con núm. de ident.: 24022), en donde:

A_1, A_2 y A_3 son cada uno independientemente un aminoácido L o D;

m es un número entero en el rango de 1 a 4;

cada X es K o KP; y

el grupo amina épsilon de al menos una cadena lateral de lisina en Z1a se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula.

168. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde la insulina se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102,

Z1a comprende un polipéptido que comprende una secuencia seleccionada de (XA1X)m(GGGGS)n (sec. con núm. de ident.: 24023), (XA1A2X)m (GGGGS)n (sec. con núm. de ident.: 24024), (XA1A2A3X)m(GGGGS)n (sec. con núm. de ident.: 24025), (XA1X)m(GGGGS)n (XA2X)o (sec. con núm. de ident.: 24026) y (XA1A2X)m(GGGGS)n (XA3A4X)o (sec. con núm. de ident.: 24027), en donde:

A_1, A_2, A_3 y A_4 son cada uno independientemente un aminoácido L o D;

m es un número entero en el rango de 1 a 4;

n es un número entero en el rango de 1 a 4;

o es un número entero en el rango de 1 a 4;

cada X es K o KP; y

el grupo amina épsilon de cada cadena lateral de lisina de al menos una cadena lateral de lisina en Z1a se conjuga además covalentemente como se describe en la fórmula.

169. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde la insulina se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102,

Z1a comprende un polipéptido que comprende la secuencia $(GX)_m$, en donde:

X es KV;

m es un número entero en el rango de 1 a 4, y

el grupo amina épsilon de al menos una cadena lateral de lisina en Z1a se conjuga además covalentemente como se describe en la fórmula.

170. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde la insulina se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102,

Z1a comprende un polipéptido que comprende una secuencia seleccionada de: (GXA1KGEA2XT)m(GGSGSSS)n (GXGXA3GSSSGSSSXT)o (sec. con núm. de ident.: 24028), (GXA1ESA2LYL)m (sec. con núm. de ident.: 24029), (TXEX)m(GPGS)n (sec. con núm. de ident.: 24030), (GXESA1VA)m (KA2K)n (sec. con núm. de ident.: 24031), (GXEA1A2)m(GGS)n (TYA3XXT)o (sec. con núm. de ident.:24032) y (TXAXYT)m(TSSS)n (sec. con núm. de ident.: 24033), en donde:

cada X es KV o KP;

A_1, A_2, A_3 son cada uno independientemente un aminoácido L o D;

m es un número entero en el rango de 1 a 4;

n es un número entero en el rango de 1 a 4; y

o es un número entero en el rango de 1 a 4; y

el grupo amina épsilon de al menos una cadena lateral de lisina en Z1a se conjuga además covalentemente como se describe en la fórmula.

171. La insulina de una cualquiera de las reivindicaciones 160-163, en donde la insulina se conjuga covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102,

Z1a comprende un polipéptido que comprende una secuencia seleccionada de (TKPYA1KEVETA2GSGS)m (GGGGS)n (sec. con núm. de ident.: 24034), (YTPLEA1KPYSTSYKPYSEA1L)m(GKPTSLEA2FLVEA2LYTKP)n (sec. con núm. de ident.: 24035), y (GKEALYLTPLESALYKP)m(TKPLEALYLKPEILSLKPESLA)n(GKPGSSSKPDTSSSGTPKTAAGS)o (sec. con núm. de ident.: 24036), en donde:

A_1 y A_2 son cada uno independientemente un aminoácido L o D;

m es un número entero en el rango de 1 a 4;

n es un número entero en el rango de 1 a 4; y

el grupo amina épsilon de al menos una cadena lateral de lisina en Z1a se conjuga además covalentemente como se describe en la fórmula.

172. La insulina de la reivindicación 160, en donde (i) la secuencia de la cadena A y/o B de la insulina está unida al terminal N o al terminal C mediante KX'K, KX' o X'K en donde X' representa una secuencia continua de 2, 3, 4, o 5 residuos seleccionados del interior de la cadena A silvestre (sec. con núm. de ident.: 1) y la cadena B silvestre (sec. con núm. de ident.: 2), o

(ii) en donde X' es un polipéptido de hasta 30 residuos con aminoácidos independientemente seleccionados de: K, G, S, E, H, E, N, Q, D, A, P, R y C, y

en donde, en (i) y (ii), cada residuo de K está opcional e independientemente conjugado covalentemente como se describe en la fórmula de la reivindicación 102.