



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2978771 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07K 7/08 (2006.01)**  
**C07K 7/64 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                |
|------|----------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                      | 2019.12.16                                                                                                                                                                                                                                                     |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2019.07.24                                                                                                                                                                                                                                                     |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 14714670.8                                                                                                                                                                                                                                                     |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2014.03.28                                                                                                                                                                                                                                                     |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2016.02.03                                                                                                                                                                                                                                                     |
| (30) | Priority                                                                   | 2013.03.30, EP, 13001656                                                                                                                                                                                                                                       |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR                                                              |
|      | Designated Extension<br>States:                                            | BA ; ME                                                                                                                                                                                                                                                        |
| (73) | Proprietor                                                                 | Polyphor AG, Hegenheimermattweg 125, 4123 Allschwil, Sveits                                                                                                                                                                                                    |
| (72) | Inventor                                                                   | OBRECHT, Daniel, Im Eichacker 21, CH-4112 Bättwil, Sveits<br>LUTHER, Anatol, Max-Brombacher-Weg 10, 79589 Binzen, Tyskland<br>BERNARDINI, Francesca, 6, Rue des Peupliers, F-68220 Héisingue, Frankrike<br>ZBINDEN, Peter, Föhrenweg 9, CH-4312 Magden, Sveits |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | ONSAGERS AS, Postboks 1813, Vika, 0123 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                             |

---

|      |                      |                                      |
|------|----------------------|--------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>BETA-HAIRPIN PEPTIDOMIMETICS</b>  |
| (56) | References<br>Cited: | WO-A2-2007/079605<br>WO-A1-02/070547 |

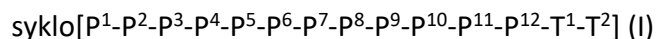
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

## EP 2 978 771 B1

## BETA-HÅRNÅL-PEPTIDOMIMETIKA

## Patentkrav

1. Forbindelse av den generelle formelen (I),



hvor de enkle elementene T eller P kobles i enten den ene eller andre retningen fra festepunktet til karbonyl (C=O) med nitrogenet (N) til den neste elementet og hvori

T<sup>1</sup> er <sup>D</sup>Pro;

T<sup>2</sup> er Pro; Pro((3S)OH); Pro((4S)OBn); Pic; eller Tic(7OH);

P<sup>1</sup> er Ala(CF<sub>3</sub>); Ala(2ClPhUr); Ala(4ClPhUr); Leu; Ile; Val; Nva; Trp; Phe, Tyr; Tza; eller Thr;

P<sup>2</sup> er Ala; Abu; Ala(2ClPhUr); Ala(3PyrMeUr); Ala(4butoksyPhUr); Ala(*i*PrUr);

Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl);

Dap(AcThr); Dap(*i*Pr); Dap(Thr); Ser; Ser(Me); Hse; Thr; *allo*Thr; Asp; Asn; eller Gly;

P<sup>3</sup> er Chg; Cha; *t*BuGly; Phe; Phe (4NH<sub>2</sub>); Phe(4F); Tyr(3F); Phe(4CF<sub>3</sub>); Tyr;

Tyr(Me); eller Trp;

P<sup>4</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; eller Arg;

P<sup>5</sup> er Lys; Orn; Orn(*i*Pr); Dap; Dab; eller Arg;

P<sup>6</sup> er Dab; <sup>D</sup>Dab; eller Pip;

P<sup>7</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; Arg; eller <sup>D</sup>Dab;

P<sup>8</sup> er Trp;

P<sup>9</sup> er Hse; Dab; Dap; Arg; eller Lys;

P<sup>10</sup> er *t*BuGly; Ile; Val; Nva; Chg; Cha; Trp; Tyr; Tyr(Me); eller Phg;

P<sup>11</sup> er Ala; Ser; Ser(Me); Tza; Agp; Tyr; Dab; Thr; Asn; Asp; eller <sup>D</sup>Ala; og

P<sup>12</sup> er Ser; Thr; Dap; Ala(*i*PrUr); Leu; eller Tyr;

**EP 2 978 771 B1**

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav;  
 med betingelsen at hvis P2 er Ala(2ClPhUr); Ala(3PyrMeUr); Ala(4butoxyPhUr);  
 Ala(*i*PrUr); Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl);  
 Dap(AcThr); Dap(*i*Pr); Dap(Thr); Ser(Me); Asp; eller Asn;  
 da er P11 Ala; Ser; Ser(Me); Thr; Asn; Asp; eller <sup>D</sup>Ala.

**2.** Forbindelse ifølge krav 1, hvori

T<sup>1</sup> er <sup>D</sup>Pro;  
 T<sup>2</sup> er Pro; Pro((3S)OH); Pro((4S)OBn); Pic; eller Tic(7OH);  
 P<sup>1</sup> er Ala(CF<sub>3</sub>); Ala(2ClPhUr); Ala(4ClPhUr); Leu; Ile; Val; Nva; Trp; Phe; Tyr; eller  
 Tza;  
 P<sup>2</sup> er Ala; Abu; Ala(2ClPhUr); Ala(3PyrMeUr); Ala(4butoksyPhUr); Ala(*i*PrUr);  
 Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl);  
 Dap(AcThr); Dap(*i*Pr); Dap(Thr); Ser; Ser(Me); Hse; Thr; *allo*Thr; Asp; eller Asn;  
 P<sup>3</sup> er Chg; Cha; *t*BuGly; Phe; Phe (4NH<sub>2</sub>); Phe(4F); Tyr(3F); Phe(4CF<sub>3</sub>); Tyr;  
 Tyr(Me); eller Trp;  
 P<sup>4</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; eller Arg;  
 P<sup>5</sup> er Lys; Orn; Orn(*i*Pr); Dap; Dab; eller Arg;  
 P<sup>6</sup> er Dab; <sup>D</sup>Dab; eller Pip;  
 P<sup>7</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; eller Arg;  
 P<sup>8</sup> er Trp;  
 P<sup>9</sup> er Hse; Dab; Dap; Arg; eller Lys;  
 P<sup>10</sup> er *t*BuGly; Ile; Val; Nva; Chg; Cha; Trp; Tyr; Tyr(Me); eller Phg;  
 P<sup>11</sup> er Ala; Ser; Ser(Me); Tza; Agp; Tyr; Dab; Thr; eller Asn; og  
 P<sup>12</sup> er Ser; Thr; Dap; eller Ala(*i*PrUr);

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav;

**EP 2 978 771 B1**

med betingelsen at hvis P<sup>2</sup> er Ala(2ClPhUr); Ala(3PyrMeUr); Ala(4butoxyPhUr);  
Ala(*i*PrUr); Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl);  
Dap(AcThr); Dap(*i*Pr); Dap(Thr); Ser(Me); Asp; eller Asn;  
da er P<sup>11</sup> Ala; Ser; Ser(Me); eller Thr.

**3.** Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvori

T<sup>1</sup> er <sup>D</sup>Pro;

T<sup>2</sup> er Pro; Pro((3S)OH); Pro((4S)OBn); Pic; eller Tic(7OH);

P<sup>1</sup> er Ala(CF<sub>3</sub>); Leu; Ile; Val; Nva; Trp; Phe; Tyr; Tza; eller Thr;

P<sup>2</sup> er Ala; Abu; Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl); Dap(AcThr); Dap(*i*Pr);

Dap(Thr); Ser; Ser(Me); Hse;

Thr; *allo*Thr; Asp; Asn; eller Gly;

P<sup>3</sup> er Chg; Cha; *t*BuGly; Phe; Phe (4NH<sub>2</sub>); Phe(4F); Tyr(3F); Phe(4CF<sub>3</sub>); Tyr;

Tyr(Me); eller Trp;

P<sup>4</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; eller Arg;

P<sup>5</sup> er Lys; Orn; Orn(*i*Pr); Dap; Dab; eller Arg;

P<sup>6</sup> er Dab; <sup>D</sup>Dab; eller Pip;

P<sup>7</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; Arg; eller <sup>D</sup>Dab;

P<sup>8</sup> er Trp;

P<sup>9</sup> er Hse; Dab; Dap; Arg; eller Lys;

P<sup>10</sup> er *t*BuGly; Ile; Val; Nva; Chg; Cha; Trp; Tyr; Tyr(Me); eller Phg;

P<sup>11</sup> er Ala; Ser; Ser(Me); Tza; Agp; Tyr; Dab; Thr; Asn; Asp; eller <sup>D</sup>Ala; og

P<sup>12</sup> er Ser; Thr; Dap; Leu; eller Tyr;

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav;

med betingelsen at hvis P<sup>2</sup> er Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl); Dap(AcThr);

Dap(*i*Pr); Dap(Thr); Ser(Me); Asp; eller Asn;

da er P<sup>11</sup> Ala; Ser; Ser(Me); Thr; Asn; Asp; eller <sup>D</sup>Ala.

**EP 2 978 771 B1****4.** Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori

T<sup>1</sup> er <sup>D</sup>Pro;

T<sup>2</sup> er Pro; Pro((3S)OH); Pro((4S)OBn); Pic; eller Tic(7OH);

P<sup>1</sup> er Ala(CF<sub>3</sub>); Leu; Ile; Val; Nva; Trp; Phe; Tyr; eller Tza;

P<sup>2</sup> er Ala; Abu; Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl); Dap(AcThr); Dap(*i*Pr);

Dap(Thr); Ser; Ser(Me); Hse;

Thr; *allo*Thr; Asp; eller Asn;

P<sup>3</sup> er Chg; Cha; *t*BuGly; Phe; Phe(4NH<sub>2</sub>); Phe(4F); Tyr(3F); Phe(4CF<sub>3</sub>); Tyr;

Tyr(Me); eller Trp;

P<sup>4</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; eller Arg;

P<sup>5</sup> er Lys; Orn; Orn(*i*Pr); Dap; Dab; eller Arg;

P<sup>6</sup> er Dab; <sup>D</sup>Dab; eller Pip;

P<sup>7</sup> er Dab; Dab(2PyrMe); Dap; Orn; eller Arg;

P<sup>8</sup> er Trp;

P<sup>9</sup> er Hse; Dab; Dap; Arg; eller Lys;

P<sup>10</sup> er *t*BuGly; Ile; Val; Nva; Chg; Cha; Trp; Tyr; Tyr(Me); eller Phg;

P<sup>11</sup> er Ala; Ser; Ser(Me); Tza; Agp; Tyr; Dab; Thr; eller Asn; og

P<sup>12</sup> er Ser; Thr; eller Dap;

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav;

med betingelsen at hvis P<sup>2</sup> er Dab(2PyrMe); Dap; Dap(2,3-OHpropionyl); Dap(AcThr);

Dap(*i*Pr); Dap(Thr); Ser(Me); Asp; eller Asn;

da er P<sup>11</sup> Ala; Ser; Ser(Me); eller Thr.

**5.** Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kraven 1 til 4, som velges fra

syklo(-Trp-Ser-Cha-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

syklo(-Trp-Ser(Me)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

**EP 2 978 771 B1**

syklo(-Trp-Ala-Chg-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ala-Cha-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser(Me)-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser(Me)-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Tza-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap(*i*Pr)-Cha-Dab-Orn(*i*Pr)-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap(*i*Pr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Hse-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap-Cha-Dab(2PyrMe)-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dab(2PyrMe)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap(2,3-OHpropionyl)-Cha-Dab-Orn-DDab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap(Thr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap(AcThr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Hse-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dap-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Tyr-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Tza-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Agp-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Lys-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr(Me)-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Phe-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Nva-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Tyr-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Tyr(Me)-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Trp-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

**EP 2 978 771 B1**

syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Trp-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Val-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Hse-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Hse-*t*BuGly-Ala-Dap-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Val-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Val-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Val-Ser-Tyr-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Val-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Val-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Tyr-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 syklo(-Val-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 syklo(-Leu-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 syklo(-Leu-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Alb-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 syklo(-Leu-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Alb-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 syklo(-Trp-Dap-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Tic(7OH)-);  
 syklo(-Trp-Dap-Cha-Dab-Orn-Pip-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Dap-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pic-);  
 syklo(-Trp-Ala-Cha-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((4S)OBn)-);  
 syklo(-Trp-Ala-Chg-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro((3S)OH)-);  
 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

**6.** Forbindelse av formelen

syklo(-Trp-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser(Me)-Ser-<sup>D</sup>Pro-Oic-)

**EP 2 978 771 B1**

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

7. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kraven 1 til 4, som velges fra
- syklo(-Tyr-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Nva-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Tyr-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Nva-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Val-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Tyr-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ser-Tyr-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ala-Trp-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ala-Tyr-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Ala-Tyr-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Trp-Dap-Trp-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Nva-Ser-Trp-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Ile-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Ile-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Ile-Ser-Tyr-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Ile-Ser-Phe(4NH<sub>2</sub>)-Dab-Orn-DDab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Ile-Thr-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Ile-Asn-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Ile-*allo*Thr-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Leu-Ser-Tyr-Orn-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Thr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Nva-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Val-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);
- syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dap-Orn-DDab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

**EP 2 978 771 B1**

syklo(-Val-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Dap-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Dab-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Arg-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Arg-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Orn-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Lys-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dap-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Arg-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dap-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Phe(4F)-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Tyr(3F)-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Phe(4CF3)-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Phg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Trp-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Trp-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Trp-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Trp-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Trp-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Asp-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Tyr-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Thr-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Tyr-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Asp-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Dab-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Thr-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Dab-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Thr-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Asn-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Asn-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-tBuGly-Thr-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

**EP 2 978 771 B1**

syklo(-Leu-Asn-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Asn-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Thr-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Thr-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Asp-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Asn-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Thr-Tyr-Dab-Dab-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Thr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Abu-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Tyr-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Thr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ala-Tyr-Dab-Dab-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ser-Thr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ala-Tyr-Dab-Dab-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Thr-Thr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-*t*BuGly-Dab-Lys-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Val-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-*t*BuGly-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Cha-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ser-Cha-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Cha-Dab-Orn-Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Nva-Ser-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Dap-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Dap-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Dap-Trp-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Dap-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Thr-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Dap-Tyr-Dab-Dab-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Thr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

**EP 2 978 771 B1**

syklo(-Nva-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-Chg-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ile-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ser-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ala(CF<sub>3</sub>)-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Phe-Dap-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

**8.** Forbindelse ifølge krav 1 eller 3, som velges fra

syklo(-Tyr-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Tyr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-DAla-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-DDab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Gly-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Dab-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Thr-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Tyr-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Dab-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Asp-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Thr-Ser-Tyr-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Leu-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

**9.** Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, som velges fra

syklo(-Trp-Ala(3PyrMeUr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ala(*i*PrUr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Trp-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ala(*i*PrUr)-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala(2ClPhUr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala(3PyrMeUr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Aia(*i*PrUr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Leu-Ala(4butoxyPhUr)-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
 syklo(-Ala(2ClPhUr)-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);

**EP 2 978 771 B1**

syklo(-Ala(4ClPhUr)-Ala-Cha-Dab-Orn-<sup>D</sup>Dab Dab-Dab-Trp-Dab-*t*BuGly-Ala-Ser-<sup>D</sup>Pro-Pro-);  
eller farmasøytisk akseptable salter derav.

- 10.** Diastereomer eller epimer av en forbindelse av formel **(I)** som definert i krav 1, basert på ett eller flere kirale sentre ikke uttrykkelig spesifisert i formel **(I)** eller enantiomer av en forbindelse av formel **(I)**.
- 11.** Farmasøytisk sammensetning som inneholder en forbindelse eller en blanding av forbindelser ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10 og minst én farmasøytisk inert bærer.
- 12.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 11, i en form som er egnet til oral, topikal, transdermal, injeksjons-, bukkal, transmukosal, rektal, pulmonær eller inhalasjonsadministrasjon, spesielt med formen tabletter, dragert, kapsler, løsninger, væsker, geler, plast, kremer, salver, sirup, slurryer, suspensjoner, spray, forstøvere eller stikkpiller.
- 13.** Forbindelse av formel **(I)** ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav til anvendelse som medikament.
- 14.** Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, til anvendelse som et farmasøytisk aktivt stoff med antibiotisk aktivitet.
- 15.** Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller en sammensetning ifølge krav 11 eller 12, til anvendelse ved behandling av eller forebygging mot infeksjoner og sykdommer i forbindelse med slike infeksjoner; spesielt infeksjoner i forbindelse med luftveissykdommer eller hud- eller mykvevssykdommer eller mage- og tarmsykdommer eller øyesykdommer eller øresykdommer eller CNS-sykdommer eller beinsykdommer eller hjerte- og karsykdommer eller kjønnsorganiske sykdommer, eller nosokomiale

**EP 2 978 771 B1**

infeksjoner, eller kateterrelaterte og ikke-kateterrelaterte infeksjoner, eller urinveisinfeksjoner eller infeksjoner i blodet.

16. Anvendelsen av forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 9 eller en sammensetning ifølge krav 11 eller 12 som desinfeksjonsmiddel eller konserveringsmiddel i mat, kosmetikk, medikamenter eller andre stoffer som inneholder næringsstoff.
17. Fremgangsmåte for å fremstille en forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10 som omfatter

- (a) koble en passende funksjonalisert fast støtte med et passende N-beskyttet derivat av den aminosyren som i det ønskede sluttproduktet, er i posisjon T<sup>1</sup> eller T<sup>2</sup> eller P<sup>1</sup> til P<sup>12</sup> som definert ovenfor; en hvilken som helst funksjonell gruppe som kan være tilstede i det N-beskyttede aminosyrederivatet som også er passende beskyttet;
- (b) fjerne den N-beskyttende gruppen fra produktet som ble skaffet i trinn (a);
- (c) kople produktet som ble skaffet slik, med et passende N-beskyttet derivativ av den aminosyren som i det ønskede sluttproduktet er i posisjonen til det neste elementet (T eller P), følger sekvensen mot uret eller med uret, ifølge den generelle formelen (I) i -COOH til -NH<sub>2</sub> retning; en hvilken som helst funksjonell gruppe som kan være tilstede i det N-beskyttede aminosyrederivatet som også er passende beskyttet;
- (d) fjerne den N-beskyttende gruppen fra produktet som skaffes slik;
- (e) gjenta trinn (c) og (d) til alle aminosyresrester er blitt innført;
- (f) hvis ønskelig, selektivt avbeskytte én eller flere beskyttede funksjonelle grupper som er tilstede i molekylet og transformere den/de reaktive gruppen(e) som dermed frigis, kjemisk;
- (g) kople produktet som dermed skaffes, fra den faste støtten;

**EP 2 978 771 B1**

- (h) syklisere produktet som spaltes, fra den faste støtten;
- (i) fjerne eventuelle beskyttende grupper som er tilstede på funksjonelle grupper til hvilket som helst medlem av kjeden med aminosyrerester og om ønskelig, hvilken/hvilke som helst gruppe(r) som eventuelt er tilstede i molekylet;
- (j) om ønskelig, implementere flere kjemiske transformasjoner av én eller flere reaktive grupper som er tilstede i molekylet; og
- (k) om ønskelig, konvertere produktet som dermed skaffes til et farmasøytisk akseptabelt salt eller konvertere et farmasøytisk akseptabelt eller uakseptabelt salt som dermed skaffes, til den korresponderende frie forbindelsen i formen (i) eller til et annet farmasøytisk akseptabelt salt.

- 18.** Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10 til behandling a en infeksjon, spesielt infeksjoner som nosokomiale infeksjoner, kateterrelaterte og ikke-kateterrelaterte infeksjoner, urinveisinfeksjoner, infeksjoner i blodet, eller en sykdom eller lidelse forbundet med en infeksjon, spesielt sykdommer eller lidelser som ventilatorassosiert pneumoni (VAP), sykehuservervet pneumoni (HAP), helsetjeneste-assosiert pneumoni (HCAP), cystisk fibrose, emfysem, astma, pneumoni, epidemisk diaré, nekrotiserende enterokolitt, tyflitt, gastroenteritt, pankreatitt, keratitt, endoftalmitt, otitt, cerebral abscess, meningitt, encefalitt, osteochondritis, perikarditt, epididymitt, prostatitt, uretritt, kirurgiske sår, traumatiske sår, brannsåre.