



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2748165 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/08 (2006.01)
A61K 31/439 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.02.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.11.02
(86)	European Application Nr.	12772808.7
(86)	European Filing Date	2012.08.24
(87)	The European Application's Publication Date	2014.07.02
(30)	Priority	2011.08.27, IN, MM24122011
(84)	Designated Contracting States:	AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR
(73)	Proprietor	Wockhardt Limited, D-4, MIDC Area Chikalthana, Aurangabad 431210, IN-India
(72)	Inventor	PATEL, Mahesh Vithalbhay, Plot No. 157Opp. Saint Meera SchoolIN-3 Cidco, Aurangabad 431 003, IN-India DESHPANDE, Prasad Keshav, B-3Saraswati Bhuvan Colony (W)Aurangpura, Aurangabad 431003, IN-India BHAWSAR, Satish, "Smit Residency"Flat No.101 Plot No.225N-1 Sector-BCidco, Aurangabad 431005, IN-India BHAGWAT, Sachin, Row House No.C-2"Nilgiris"Khivansara Park(E)Behind Ramayana Cultural HallUlkanagari, Aurangabad, IN-India JAFRI, Mohammad Alam, Plot No.180Arif ColonyGhati Road, Aurangabad 431001, IN-India MISHRA, Amit, House No: 4 / 168Vivek Khand - 4Gomti NagarLucknow, LucknowUttar Pradesh 226010, IN-India PAVASE, Laxmikant, 15 August ColonyR.No. 09 Datta ChowkBhushannagarPost Kedgaon, Ahmednagar 414005, IN-India GUPTA, Sunil, S/o V.B. GuptaOpp. Sindhi DharmshalaShivaji NagarBhim-mandi, Kota 324002, IN-India KALE, Rajesh, 25 Pramod ColonyRaja Peth, Amravati 444606, IN-India JOSHI, Sanjeev, Row House No.H-5Kasliwal VishwaBehind Sant Eknath HospitalKhivansara LawnsUlkanagari, Aurangabad, IN-India
(74)	Agent or Attorney	Larsen & Birkeholm A/S, Banegårdspladsen 1, DK-1570 KØBENHAVN V, Danmark

(54) Title **1,6-DIAZABICYCLO[3,2,1]OCTAN-7-ONE DERIVATIVES AND THEIR USE IN THE TREATMENT OF BACTERIAL INFECTIONS**

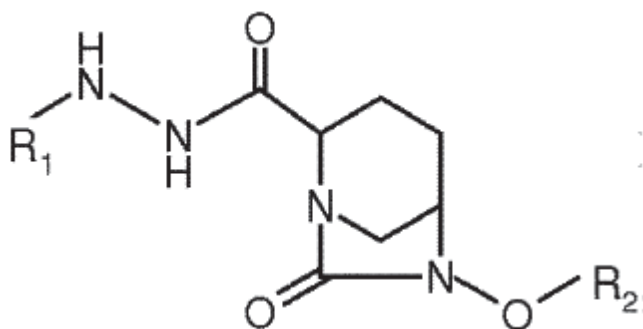
(56) References
Cited: WO-A2-2009/091856
 US-A1- 2010 093 784

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/>

1,6-DIAZABISYKLO[3,2,1]OKTAN-7-ONE-DERIVATER OG DERES ANVENDELSE I BEHANDLINGEN AV BAKTERIELLE INFEKSJONER

Patentkrav

5 1. Forbindelse av formel (I)



Formel (I)

eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R₁ er:

- 10 (a) hydrogen,
(b) (CO)_n-R₃,
(c) COOR₄, eller
(d) COCH₂COR₃
n er 0, 1 eller 2,

15 R₂ er:

- (a) SO₃M,
(b) SO₂NH₂,
(c) PO₃M,
(d) CH₂COOM,
20 (e) CF₂COOM,
(f) CHF₂COOM, eller
(g) CF₃:

M er hydrogen eller et kation,

R₃ er:

- 25 (a) hydrogen,

(b) C₁-C₆-alkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra halogen, OR₅, CN, COOR₅, CONR₆R₇, NR₆R₇, NR₅COR₆, NR₅CONR₆R₇, heterosykl, heteroaryl, sykloalkyl eller aryl,

(c) CN,

5 (d) NR₆R₇,

(e) CONR₆R₇,

(f) NHCONR₆R₇,

10 (g) aryl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl eller NHCONR₆R₇,

(h) heterosykl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, NHC(NH)NR₆R₇ eller NHCONR₆R₇,

15 (i) heteroaryl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl eller NHCONR₆R₇,

(j) sykloalkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl eller NHCONR₆R₇,

20 (k) sykloalkyl substituert med C₁-C₆-alkyl hvori C₁-C₆-alkyl er ytterligere substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, eller CONR₆R₇, eller

(l) OR₆,

R₄ er:

25 (a) hydrogen,

(b) C₁-C₆-alkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra halogen, OR₅, CN, COOR₅, CONR₆R₇, NR₆R₇, NR₅COR₈, heterosykl, heteroaryl, sykloalkyl eller aryl,

30 (c) aryl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₆R₇,

(d) heterosykl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₆R₇,

(e) heteroaryl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₆R₇, eller

5 (f) sykloalkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₆R₇, halogen, CN, CONR₆R₇, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₆R₇,

R₅ og R₈ er hver uavhengig:

(a) hydrogen, eller

10 (b) C₁-C₆-alkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, CONR₆R₇, NR₆R₇, heterosyklyl, heteroaryl, sykloalkyl eller aryl,

R₆ og R₇ er hver uavhengig:

(a) hydrogen,

15 (b) C₁-C₆-alkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra halogen, OR₅, CN, COOR₅, CONR₅R₈, NR₅R₆, NR₅COR₈, heterosyklyl, heteroaryl, sykloalkyl eller aryl,

(c) aryl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₅R₈, halogen, CN, CONR₅R₈, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₅R₈,

20 (d) heterosyklyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₅R₈, halogen, CN, CONR₅R₈, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₅R₈,

(e) heteroaryl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₅R₈, halogen, CN, CONR₅R₈, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₅R₈,

25 (f) sykloalkyl eventuelt substituert med én eller flere substituenten uavhengig valgt fra C₁-C₆-alkyl, OR₅, NR₅R₈, halogen, CN, CONR₅R₈, SO₂-alkyl, SO₂-aryl, OSO₂-alkyl, OSO₂-aryl, eller NHCONR₅R₈, eller

(g) R₆ og R₇ er sammenbundet og danner en fire- til syvleddet ring.

30 **2. Forbindelse ifølge krav 1, valgt fra:**

trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,

trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(R)-piperidin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diksa-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,

35 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(R)-pyrrolidin-3-karbonyl]-hydrazinykarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,

trans-{7-okso-2-[N'-((R)-piperidin-3-karbonyl)-hydrazinokarbonyl]-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]-okt-6-yloksy}-eddijsyre,
trans-difluor-{7-okso-2-[N'-((R)-piperidin-3-karbonyl)-hydrazinokarbonyl]-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]-okt-6-yloksy}-eddijsyre,
5 trans-svovelsyre-mono-[2-hydrazinokarbonyl-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(amino-acetyl)hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(3-amino-propioyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
10 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(4-amino-butanoyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((2S)-2-amino-3-hydroksy-propioyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
15 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(2S,4S)-4-fluor-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(2S,4R)-4-methoksy-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(piperidin-4-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
20 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((RS)-piperidin-3-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((S)-piperidin-3-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
25 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((RS)-piperidin-2-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((S)-piperidin-2-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((R)-piperidin-2-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
30 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(piperazin-4-yl-acetyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((RS)-1-amino-1-fenyl-acetyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
35 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((RS)-3-amino-butanoyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(3-amino-2,2-dimetyl-propionyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(1-aminomethyl-syklopropan-1-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
40 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(2-amino-4-karboksamido-butanoyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(5-amino-pentanoyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
45 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((2S)-2,6-diamino-heksanoyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,

trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-((2-aminoetoksy)-acetyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[azetidin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 5 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[pyrrolidin-1-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(R)-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-3-pyrrolidin-2-yl]-propionyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 10 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(RS)-pyrrolidin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-pyrrolidin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 15 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(2S,4R)-4-hydroksy-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(2S,4S)-4-amino-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(2S,4S)-4-guanidino-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 20 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(RS)-3-piperidin-2-yl-propionyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(RS)-piperazin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 25 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-morfolin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(3-okso-3-piperazin-1-yl-propionyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(RS)-1-amino-1-pyridin-2-yl-acetyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 30 trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(2-amino-tiazol-4-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

3. Forbindelse ifølge krav 1, valgt fra:

Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(cyano-acetyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 40 Natriumsalt av trans-N'-(7-okso-6-sulfooksy-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]oktan-2-karboksylysyre)-hydrazinkarboksylysyre-tert-butylester,
 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(morfolin-4-yl-acetyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(6-karboksamido-pyridin-2-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 45 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(morfolin-4-okso-karbonyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,

Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-1-karbamoyl-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(2S,4S)-1-karbamoyl-4-fluor-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 5 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-1-metansulfonyl-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-(cyano-dimetyl-acetyl)-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester:
 Natriumsalt av trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(S)-5-okso-pyrrolidin-2-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester,
 10 eller en stereoisomer deriv.

4. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3.

5. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, ytterligere omfattende minst én beta-laktamasehemmer valgt fra sulbaktam, tazobaktam, klavulansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat, solvat, polymorf eller enantiomer deriv.

6. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 eller 5, ytterligere omfattende minst ett antibakterielt middel eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat, solvat, polymorf eller enantiomer deriv.

7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori det antibakterielle midlet er valgt fra en gruppe som består av aminoglykosider, ansamyciner, karbacefemer, cefalosporiner, cefamyciner, linkosamider, lipopeptider, makrolider, monobaktamer, nitrofuraner, penicilliner, polypeptider, kinoloner, sulfonamider, tetrasykliner, eller oksazolidinon-antibakterielle midler.

8. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori det antibakterielle midlet er et beta-laktam-antibakterielt middel.

9. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori det antibakterielle midlet er valgt fra en gruppe som består av penicilliner, penemer, karbapenemer, cefalosporiner, og monobaktamer.

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori det antibakterielle midlet er et cefalosporin-antibiotikum valgt fra en gruppe som består av cefalotin, cefaloridin, cefaclor, cefadroksil, cefamandol, cefazolin, cefaleksin, cefradin, ceftizoksim, cefoksitin, cefacetil, cefotiam, cefotaksim, cefsulodin, cefoperazon, ceftizoksim, cefmenoksim, cefmetazol, cefaloglysin, cefonicid, cefodizim, cefpirom, ceftazidim, ceifriakson, cefpiramid,

cefbuperazon, cefozopran, cefepim, cefoselis, cefluprenam, cefuzonam, cefpimizol, cefklidin, cefiksim, ceftibuten, cefdinir, cefpodoxime axetil, cefpodoxime proxetil, cefteteram pivoxil, cefetamet pivoxil, cefcapene pivoxil eller cefditoren pivoxil, cefuroksim, cefuroksim aksetil, loracarbacef, ceftarolin og latamoksef.

5

11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori det antibakterielle midlet er valgt fra en gruppe som består av ceftazidim, cefepim, cefpirom, piperacillin doripenem, meropenem, imipenem, caftarolin og ceftolozan.

10 **12.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori det antibakterielle midlet er valgt fra en gruppe som består av aminoglykosider, ansamyciner, karbacefemer, cefalosporiner, cefamyciner, linkosamider, lipopeptider, makrolider, monobaktamer, nitrofuraner, penicilliner, polypeptider, kinoloner, sulfonamider, tetrasykliner, eller oksazolidinon-antibakterielle midler.

15

13. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, omfattende (a) trans-svovelsyre-mono-[2-(N'-[(R)-piperidin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]ester eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og (b) sulbaktam eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrate, solvat, polymorf eller enantiomer derav.

20

14. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, omfattende (a) trans-svovelsyremono-[2-(N'-[(R)-pyrrolidin-3-karbonyl]-hydrazinokarbonyl)-7-okso-1,6-diaza-bisyklo[3.2.1]okt-6-yl]-ester eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og (b) sulbaktam eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrate, solvat, polymorf eller enantiomer derav.

25

15. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, eller en farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4 til 14 i forebygging eller behandling av bakteriell infeksjon hos et individ.

30 **16.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, eller en farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 4 til 14 for anvendelse ved forebygging eller behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ ifølge krav 15, idet infeksjonen forårsakes av bakterier som produserer ett eller flere beta-laktamaseenzymer.

35 **17.** Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved forebygging eller behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ, idet anvendelsen er omfattende administrering til individet av en farmasøytisk effektiv mengde av (a) en forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og (b) minst ett antibakterielt middel eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrate, solvat, polymorf eller enantiomer

40

derav.

5 **18.** Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ved forebygging eller behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ, idet anvendelsen er omfattende administrering til individet av en farmasøytisk effektiv mengde, ifølge krav 17: (a) en forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og (b) et antibakterielt middel, som er i det minste en beta-laktamasehemmer valgt fra sulbaktam, tazobaktam, klavulansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat, solvat, polymorf eller enantiomer
10 derav.

15 **19.** Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved forebygging eller behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ, idet anvendelsen er omfattende administrering til individet av en farmasøytisk effektiv mengde av, ifølge krav 18: (a) en forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, (b) et antibakterielt middel, som er i det minste en beta-laktamasehemmer valgt fra sulbaktam, tazobaktam, klavulansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat, solvat, polymorf eller enantiomer derav, og (c) minst ett antibakterielt middel eller et farmasøytisk akseptabelt
20 salt, hydrat, solvat, polymorf eller enantiomer derav, for anvendelse ved forebygging eller behandling av bakteriell infeksjon hos et individ.

20. Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 17, 18 eller 19, ved forebygging eller
25 behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ, idet infeksjonen forårsakes av bakterier som produserer ett eller flere beta-laktamaseenzymer.

21. Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 eller en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse i stigende antibakterielle virkning av et antibakterielt
30 middel hos et individ.