



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3313832 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 403/12 (2006.01)
A61K 31/41 (2006.01)
A61K 31/4184 (2006.01)
A61K 31/428 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 407/14 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/10 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.06.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.02.24
(86)	European Application Nr.	16734151.0
(86)	European Filing Date	2016.06.24
(87)	The European Application's Publication Date	2018.05.02
(30)	Priority	2015.06.26, WO, PCT/CN15/082514
(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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	Merck Sharp & Dohme Corp., 126 East Lincoln Avenue, Rahway, NJ 07065-0907, USA
(72)	Inventor	BENNETT, Frank, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA JIANG, Jinlong, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA PASTERNAK, Alexander, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA DONG, Shuzhi, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA GU, Xin, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA SCOTT, Jack, D., 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA TANG, Haiqun, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA ZHAO, Zhiqiang, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA HUANG, Yuhua, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA YANG, Dexi, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA

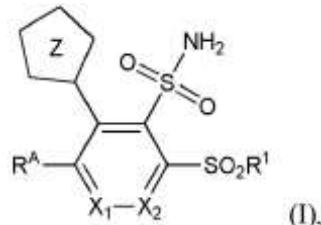
YOUNG, Katherine, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA
XIAO, Li, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, USA
ZHANG, Zhibo, 6 Tai-He RoadBDA, Beijing 100176, Kina
FU, Jianmin, 6 Tai-He RoadBDA, Beijing 100176, Kina

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **3-TETRAZOLYL-BENZENE-1,2-DISULFONAMIDE DERIVATIVES AS METALLO-BETA-LACTAMASE INHIBITORS**

(56) References
Cited: WO-A1-2015/112441
WALTER FAST ET AL: "Metallo-[beta]-lactamase: Inhibitors and reporter substrates", BIOCHIMICA ET BIOPHYSICA ACTA (BBA) - PROTEINS & PROTEOMICS, vol. 1834, no. 8, 1 August 2013 (2013-08-01), pages 1648-1659, XP055296815, Netherlands ISSN: 1570 -9639, DOI: 10.1016/j.bbapap.2013.04.024 cited in the application
TONEY J H ET AL: "Structure -activity relationships of biphenyl tetrazoles as metallo -beta-lactamase inhibitors", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 9, no. 18, 20 Septe mber 1999 (1999-09-20), pages 2741-2746, XP004179963, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/S0960-894X(99)00458-8
JOHN D BUYNAK: "[beta]-Lactamase inhibitors: a review of the patent literature (2010- 2013)", EXPERT OPINION ON THERAPEUTIC PATENTS, vol. 23, no. 11, 1 November 2013 (2013-11-01), pages 1469-1481, XP055163546, ISSN: 1354-3776, DOI: 10.1517/13543776.2013.831071

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/>

Patentkrav**1. Forbindelse av formel I**

5

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,

hvor:

X¹ er N eller CH;

X² er N eller CH;

- 10 Z er tetrazolyl, hvori Z er forbundet gjennom en karbon- til karbonbinding til den seksleddede kjerneringen som har X₁ og X₂;
- R^A er -(CH₂)_n-aryA1, -(CH₂)_n-HetA1, -(CH₂)_n-C₄-C₆sykloalkyl eller -(CH₂)_n-C₄-C₆sykloalkenyl, hvori -(CH₂)_n-C₄-C₆sykloalkylet og -(CH₂)_n-C₄-C₆sykloalkenylet eventuelt substitueres med 1, 2 eller 3 substituenter uavhengig valgt fra -NH₂, -OH, -F og -NR^aC(O)C₁-C₆alkyl eventuelt substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra -F, -CF₃, -NR^aR^b og -OR^a;
- 15 R¹ er
- 1) -NH₂;
- 2) -NR^a-C₁-C₆alkyl eventuelt substituert med 1, 2, 3 eller 4 substituenter uavhengig valgt fra: -F, -CF₃, C₁-C₆alkyl, -CH(NH₂)C(O)NH₂, -C(O)NR^aR^b, -C(O)OH, -(CH₂)₁₋₂NH₂, -NR^a(CH₂)₂₋₃NH₂, -NR^aR^b, -N⁺R^aR^bCH₃, -NHCH₂CH₂OCH₃, -OR^a og -O(CH₂)₂₋₃NH₂;
- 20 3) -NR^aC(O)C₁-C₆alkyl eventuelt substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra: -F, -CF₃, -C(O)NR^aR^b, -C(O)OH, -NR^aR^b, -N⁺R^aR^bCH₃, -NHCH₂CH₂OCH₃, -OR^a og -O(CH₂)₂₋₃NH₂;
- 25 4) -NR^a(CH₂)_n-C₃-C₆sykloalkyl, hvori C₃-C₆sykloalkylet eventuelt substitueres med -CH₂OH eller -NH₂;
- 30 5) et nitrogenforbundet 4-6-leddet monosyklig heterosykloalkyl med 0, 1 eller 2 ytterligere heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N, O og S, eller et nitrogenforbundet 6- til 10-leddet bisyklig heterosykloalkyl med 0, 1, 2 eller 3 ytterligere heteroatomringatomer valgt fra N, O og S hvori den bisykliske ringen kan være brodannet, sammensmeltet eller spirosyklig, hvori det 4-6-leddede monosykliske heterosykloalkylet og det 6- til 10-leddede bisykliske heterosykloalkylet eventuelt substitueres med én til tre substituenter, uavhengig valgt fra: -F, -NR^aR^b, okso,

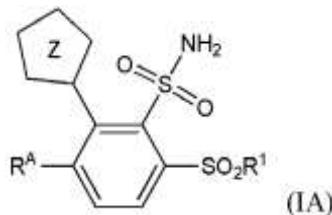
- $(\text{CH}_2)_{1-2}\text{OH}$, - CH_2NH_2 , - SO_2CH_3 og $\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$ og hvori et ringsvovelatom eventuelt substitueres med ett eller to okso;
- 6) - $\text{NR}^{\text{a}}\text{-(C}_1\text{-C}_3\text{alkyl})_n\text{-AryB1}$, hvori $\text{C}_1\text{-C}_3\text{alkyl}$ et eventuelt substitueres med - NH_2 ; og
 7) - $\text{NR}^{\text{a}}\text{-(C}_1\text{-C}_3\text{alkyl})_n\text{-HetB1}$;
- 5 AryA1 er et aromatisk ringsystem valgt fra:
 1) en 5–6-leddet monosyklig ring med 0, 1, 2 eller 3 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N, O og S, eventuelt substituert med 1, 2 eller 3 substituenter uavhengig valgt fra:
 a) halogen,
 10 b) - $\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$,
 c) -CN,
 d) - CH_2OH ,
 e) - $\text{C(O)NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$,
 f) - $\text{C(O)NH(CH}_2)_2\text{-4NH}_2$ eventuelt substituert med én eller to substituenter uavhengig
 15 valgt fra - $\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$ og - $(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{\text{a}}$,
 g) - C(O)OR^{a} ,
 h) - $(\text{CH}_2)_p\text{NHR}^{\text{a}}$ eventuelt substituert med én eller to substituenter uavhengig valgt fra - $\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$ eller - OR^{a} ,
 i) - $(\text{CH}_2)_p\text{NR}^{\text{a}}\text{C(=NH)NH}_2$,
- 20 j) - $\text{NR}^{\text{a}}\text{C(O)C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$ eventuelt substituert med én eller to substituenter uavhengig valgt fra - $\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$ eller - OR^{a} ,
 k) - $\text{NR}^{\text{a}}\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$,
 l) - $\text{NR}^{\text{a}}\text{SO}_2\text{-syklopropyl}$,
 m) - OR^{a} ,
 25 n) okso,
 o) - $\text{SC}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$ eventuelt substituert med én eller to substituenter uavhengig valgt fra - $\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$ eller - OR^{a} ;
 p) - $\text{SO}_2\text{R}^{\text{a}}$,
 q) - $\text{SO}_2\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$,
 30 r) - $\text{SO}_2\text{NH-syklopropyl}$,
 s) -AryA2,
 t) - $(\text{CH}_2)_n\text{NR}^{\text{a}}\text{AryA2}$,
 u) - $\text{C(O)NR}^{\text{a}}\text{HetA2}$ og
 v) - HetA2 , og
 35 2) en 8- til 10-leddet bisyklig ring med 1, 2, 3 eller 4 heteroatomringatomer valgt fra N, O og S, hvori et S-atom eventuelt har én eller to oksosubstituenter og et N-atom er eventuelt i form av et N-oksid, og hvori ringen eventuelt substitueres med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra

- a) halogen;
- b) C₁-C₆alkyl eventuelt substituert med én eller to substituenter uavhengig valgt fra -NR^aR^b, -F og -OR^a;
- c) -(CH₂)_nCF₃;
- 5 d) -C(=NH)NH₂;
- e) -CN;
- f) -C(O)CF₃;
- g) -C(O)NR^aR^b;
- h) -C(O)NHCH₂C(O)OR^a;
- 10 i) -C(O)NH-C₂-C₄alkyl-NH₂,
- j) -C(O)OR^a;
- k) -NR^aR^b;
- l) -NHCH₂SO₃H;
- m) -(CH₂)_nNHC(=NH)NH₂;
- 15 n) -NHC(O)C₁-C₆alkyl;
- o) -NHC(O)NH₂;
- p) -NHC(O)OR^a;
- q) -NHSO₂CH₃;
- r) -OR^a;
- 20 s) okso;
- t) -SO₂R^a,
- u) -CH₂-fenyl-OCH₃; og
- v) -HetA2;
- HetA1 er dihydrotiopyranyl eller tetrahydropyranyl;
- 25 AryA2 er en 5–6-leddet aromatisk monosyklig ring med 1, 2 eller 3 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N, N som et kvaternært salt, og S- eller 4 N-ringatomer, eventuelt substituert med -CH₂OH, -COOH, -CONH₂, -C(O)OC₁-C₆alkyl og -(CH₂)_pNHR^a eventuelt substituert med én eller to substituenter uavhengig valgt fra -NR^aR^b og -OR^a;
- 30 HetA2 er en 4–6-leddet mettet monosyklig ring med 1 eller 2 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N, O og S, hvori S eventuelt substitueres med to oksogrupper, og hvori ringen eventuelt substitueres med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra C₁-C₆alkyl, -CN, -OH og okso;
- AryB1 er en aromatisk ring valgt fra:
- 35 1) en 5–6-leddet monosyklig aromatisk ring med 0, 1, 2 eller 3 N-ringatomer, eventuelt substituert med 1 substituent valgt fra -CF₃, C₁-C₆alkyl, -(CH₂)_nNH₂ og -OCH₃; eller
2) en 9-leddet bisyklig ring med 2 N-ringatomer;
- HetB1 er en mettet ring valgt fra:

- 1) en 4–6-leddet mettet monosyklig ring med 1 eller 2 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N, O og S, hvori et N-ringatom eventuelt er i form av et kvaternært amin, hvori S substitueres med to oksogrupper, og hvori ringen eventuelt substitueres med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra -F, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆hydroksyalkyl,
- 5 -C(O)OR^a, -(CH₂)_kNR^aR^b, -OR^a, og okso; eller
- 2) en 6–10-leddet bisyklig ring med 1 eller 2 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N og O, eventuelt substituert med -OH eller -NH₂, hvori den bisyklike ringen er brodannet eller smeltet;
- R^a og R^b er uavhengig H eller C₁-C₆alkyl;
- 10 k er 0, 1, 2, 3 eller 4;
- hver n er uavhengig 0 eller 1; og
- hver p er uavhengig 0, 1, 2 eller 3.

2. Forbindelsen ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori X¹ og X² er CH.

3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, som har formelen IA

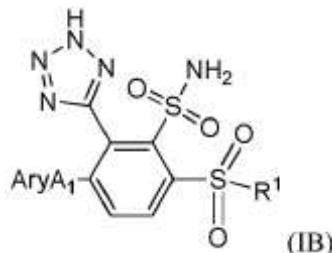


- 20 hvor:
- R^A er AryA1, C₄-C₆sykloalkyl eller C₄-C₆sykloalkenyl, hvori C₄-C₆sykloalkylet og C₄-C₆sykloalkenylet eventuelt substitueres med -NH₂ eller NHC(O)(CH₂)₁₋₃NH₂; AryA1 er et aromatisk ringsystem valgt fra:
- 1) en 5–6-leddet monosyklig ring med 0, 1 eller 2 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N og S, eventuelt substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra:
- 25 a) F,
- b) -C₁-C₆alkyl,
- c) -CN,
- d) -CH₂OH,
- 30 e) -C(O)NR^aR^b,
- f) -C(O)NH(CH₂)₂₋₄NH₂,
- g) -C(O)OR^a,
- h) -(CH₂)_nNHR^a,
- i) -NHC(=NH)NH₂;

- j) $-\text{NHC(O)CH}_3$;
- k) $-\text{NR}^{\text{a}}\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$,
- l) $-\text{NSO}_2\text{-syklopropyl}$,
- m) $-\text{OR}^{\text{a}}$,
- 5 n) $-\text{SO}_2\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$,
- o) $-\text{SC}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$,
- p) $-\text{SO}_2\text{NH-syklopropyl}$,
- q) $-\text{AryA2}$,
- r) $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^{\text{a}}\text{AryA2}$,
- 10 s) $-\text{C(O)NR}^{\text{a}}\text{HetA2}$ og
- t) $-\text{HetA2}$, og
- 2) en 8- til 10-leddet bisyklig ring med 1, 2, 3 eller 4 heteroatomringatomer valgt fra N, O og S, hvori et S-atom eventuelt substitueres med én eller to okso-substituenter og et N-atom eventuelt er i form av et N-oksid, og hvori ringen eventuelt substitueres med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra F, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{C(=NH)NH}_2$, $-\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$, -CN, $-\text{C(O)CF}_3$, $-\text{C(O)NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$, $-\text{C(O)NHCH}_2\text{C(O)OR}^{\text{a}}$, $-\text{C(O)OR}^{\text{a}}$, $-(\text{CH}_2)_{0-2}\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$, $-\text{NHC(O)CH}_3$, $-\text{NHC(O)NH}_2$, $-\text{NHC(O)OR}^{\text{a}}$, $-\text{NHCH}_2\text{SO}_3\text{H}$, $-\text{NSO}_2\text{CH}_3$, $-\text{OR}^{\text{a}}$, okso, $-\text{CH}_2\text{-fenyl-OCH}_3$ og $-\text{HetA2}$; og
alle de andre variablene er som definert i krav 1.
- 20
- 4.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, eller et farmasøytsk akseptabelt salt derav, hvori R^{A} er AryA1.
- 25
- 5.** Forbindelsen ifølge krav 4, eller et farmasøytsk akseptabelt salt derav, hvori AryA1 er
- 1) pyridyl eventuelt substituert med $-\text{NH}_2$, 2) benzoimidazolyl substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra F, $-\text{CH}_3$ og $-(\text{CH}_2)_n\text{NH}_2$; eller 3) benzotiazolyl substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra $-\text{CH}_3$ og $-(\text{CH}_2)_n\text{NH}_2$.
- 30
- 6.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, eller et farmasøytsk akseptabelt salt derav, hvori R^1 er:
- 1) $-\text{NH}_2$;
- 2) $-\text{NR}^{\text{a}}\text{-C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$ eventuelt substituert med 1, 2, 3 eller 4 substituenter uavhengig valgt fra $-\text{F}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$, $-\text{CH}(\text{NH}_2)\text{C(O)NH}_2$, $-\text{C(O)NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$, $-\text{C(O)OH}$, $-(\text{CH}_2)_{1-2}\text{NH}_2$, $-\text{NR}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}$, $-\text{N}^+\text{R}^{\text{a}}\text{R}^{\text{b}}\text{CH}_3$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{OR}^{\text{a}}$, $-\text{NR}^{\text{a}}(\text{CH}_2)_{2-3}\text{NH}_2$ og $-\text{O}(\text{CH}_2)_{2-3}\text{NH}_2$;
- 35
- 3) $-\text{NR}^{\text{a}}(\text{CH}_2)_n\text{-C}_3\text{-C}_6\text{sykloalkyl}$, hvori $\text{C}_3\text{-C}_6\text{sykloalkylet}$ eventuelt substitueres med $-\text{CH}_2\text{OH}$ eller $-\text{NH}_2$;
- 4) $-\text{NR}^{\text{a}}\text{-(C}_1\text{-C}_3\text{alkyl)}_n\text{-AryB1}$, hvori $\text{C}_1\text{-C}_3\text{alkylet}$ eventuelt substitueres med $-\text{NH}_2$; og
- 5) $-\text{NR}^{\text{a}}\text{-(C}_1\text{-C}_3\text{alkyl)}_n\text{-HetB1}$.

7. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori R¹ er: -NH₂, -NH-HetB1 eventuelt substituert med -NH₂ eller -NH-C₂-C₃alkylNH₂, eventuelt substituert med -CH₃, -OH eller -NH₂.

- 5 **8.** Forbindelsen ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, som har formelen IB:



hvor:

AryA1 er et aromatisk ringsystem valgt fra:

- 10 1) en 5–6-leddet monosyklig ring med 0 eller 1 N-ringatomer substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra F, -C₁-C₆alkyl, -CONH-C₂-C₄alkyl-NH₂ eller -NHR^a; eller
2) en 9-leddet bisyklig ring med 2 heteroatomringatomer uavhengig valgt fra N og S, hvorri ringen eventuelt substitueres med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra F, C₁-C₆alkyl og -(CH₂)_xNR^aR^b;

15 R¹ er

- 1) -NH₂;
2) -NR^a-C₁-C₆alkyl eventuelt substituert med 1 eller 2 F-substituenter og eventuelt substituert med 1 eller 2 substituenter uavhengig valgt fra -CF₃, -CH(NH₂)C(O)NH₂; -C(O)NR^aR^b; -C(O)OH; -NR^a(CH₂)₂₋₃NH₂, -NR^aR^b, -N⁺R^aR^bCH₃, -NHCH₂CH₂OCH₃, -OR^a og

20 -O(CH₂)₂₋₃NH₂;

- 3) -NR^a(CH₂)_n-C₃-C₆sykloalkyl, hvorri C₃-C₆sykloalkylet eventuelt substitueres med -CH₂OH eller -NH₂;

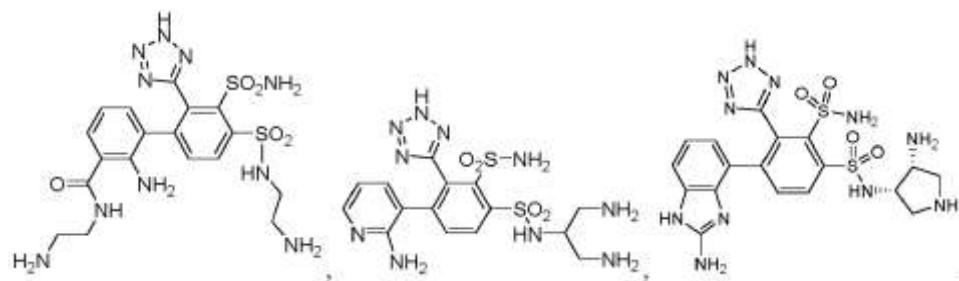
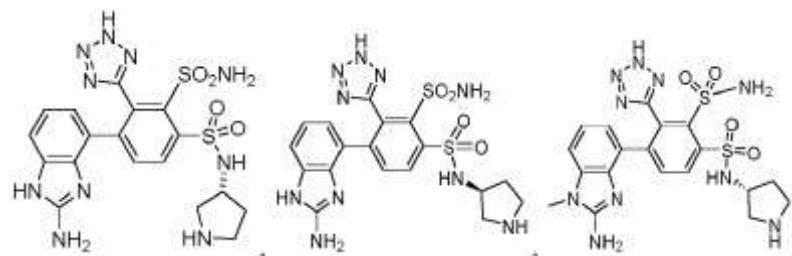
4) -NR^a-(C₁-C₃alkyl)_n-AryB1; og

5) -NR^a-(C₁-C₃alkyl)_n-HetB1;

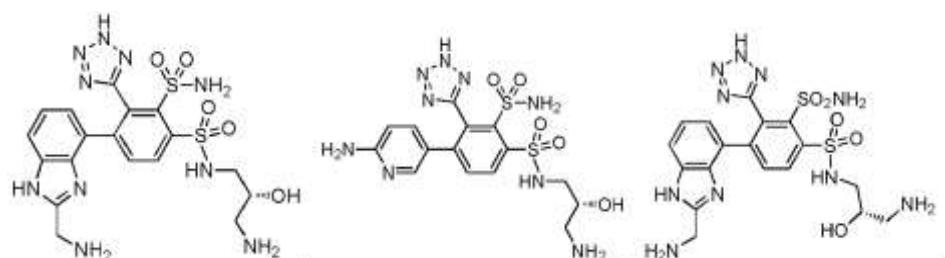
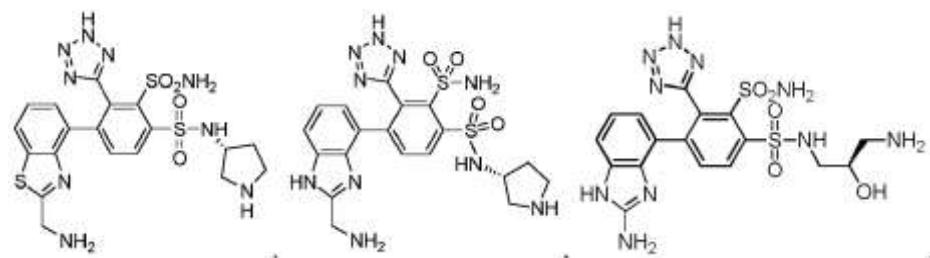
25 R^a og R^b er H eller -CH₃; og

x er 0, 1 eller 2.

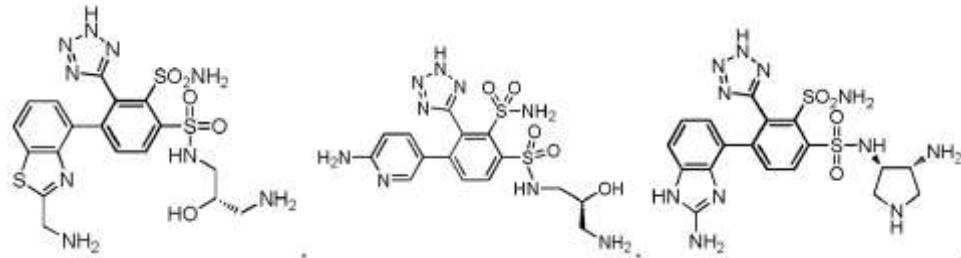
9. Forbindelse ifølge krav 1, som har strukturen

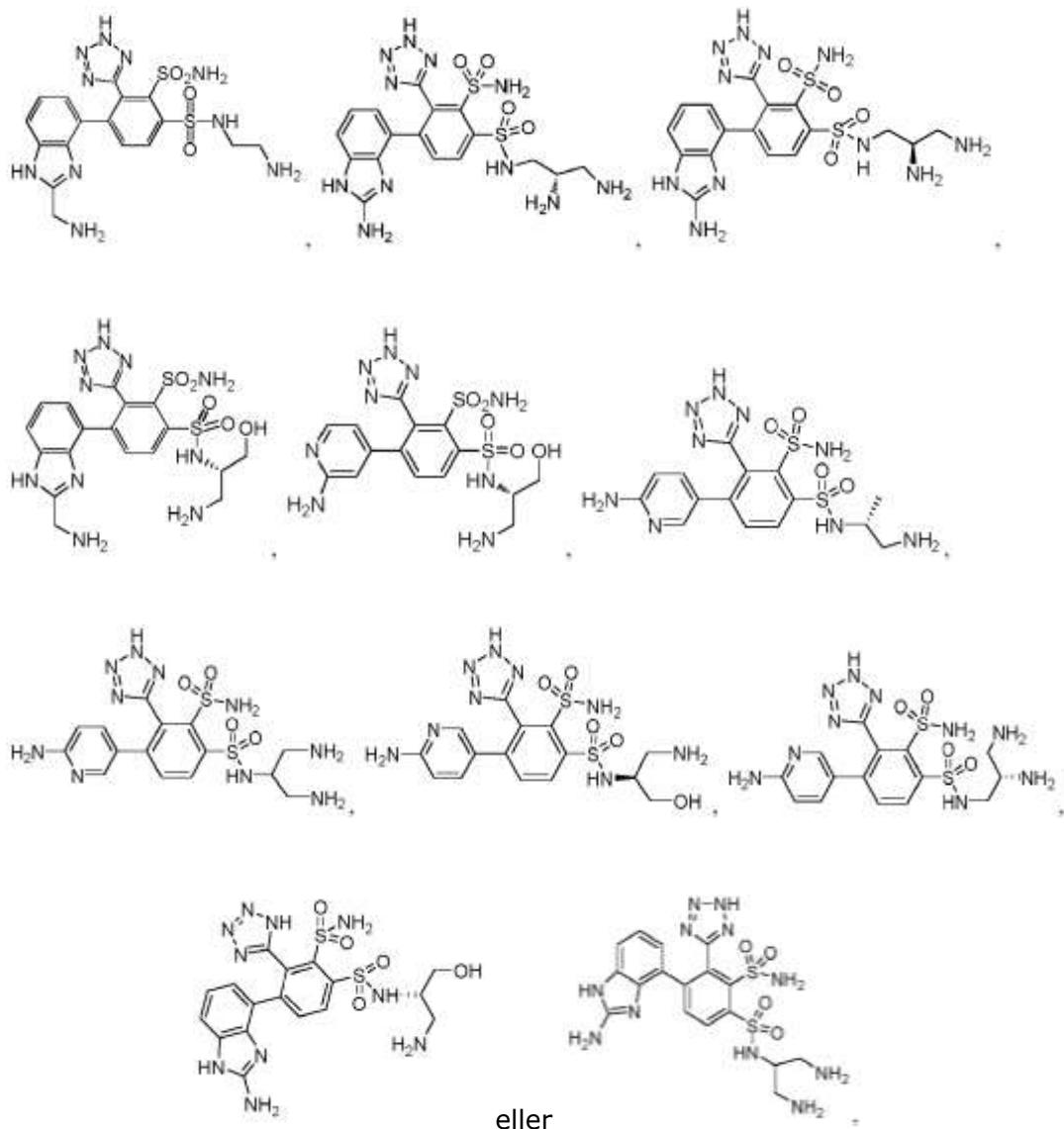


5



10

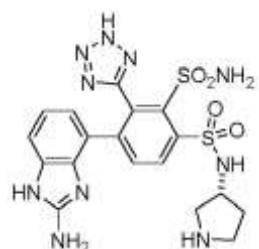




eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

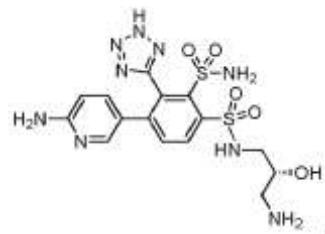
- 10 **10.** Zwitterion av forbindelsen ifølge krav 9, der tetrazolet bærer en negativ ladning og aminet bærer en positiv ladning.

- 11.** Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen



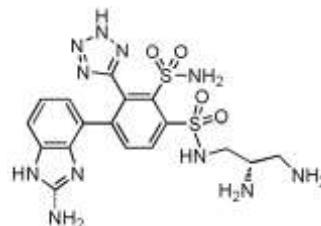
- 15 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

12. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen



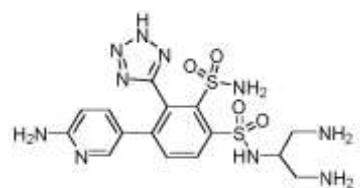
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5 **13.** Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

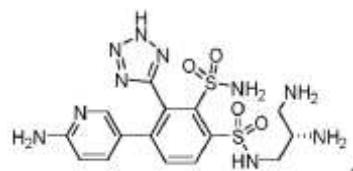
14. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen



10

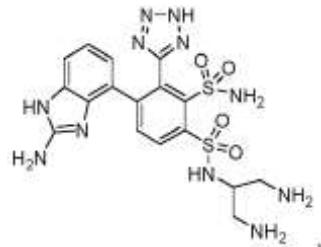
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen



15 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

16. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

17. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 16, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

18. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 17, som videre omfatter en effektiv mengde av et beta-laktam-antibiotisk middel.

10 **19.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 17 eller 18, som videre omfatter en effektiv mengde av én eller flere beta-laktamaseinhibitorforbindelser.

15 **20.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 19, hvor i sammensetningen omfatter en beta-laktamaseinhibitorforbindelse valgt fra gruppen som består av: rebebaktam-, avibaktam-, vaborbaktam-, tazobaktam-, sulbaktam- og klavulansyre.

21. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 20, hvor i beta-laktamaseinhibitorforbindelsen er tazobaktam og beta-laktamantibiotikumet er ceftolozan.

20 **22.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 20, hvor i beta-laktamaseinhibitorforbindelsen er rebebaktam.

25 **23.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 18–20, hvor i beta-laktamantibiotikumet er valgt fra gruppen som består av imipenem, ertapenem, meropenem, doripenem, biapenem, panipenem, ticarcillin, ampicillin, amoksicillin, karbenicillin, piperacillin, azlocillin, mezlocillin, cefoperazon, cefotaksim, ceftriakson, cefipim, ceftolozan og ceftazidim.

30 **24.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 18–20 og 22–23, hvor i beta-laktamantibiotikumet er imipenem.

25. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 24, videre omfattende cilastatin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

35 **26.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–16 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandling av menneskekroppen ved

behandling.

27. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 16, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, i kombinasjon med et beta-laktamantibiotikum eller en

5 farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 17 til 25 for anvendelse ved behandling av en bakterieinfeksjon.

28. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 27, hvori beta-laktamantibiotikumet er valgt fra gruppen som består av imipenem, ertapenem, meropenem, doripenem, biapenem,

10 panipenem, ticarcillin, ampicillin, amoksicillin, karbenicillin, piperacillin, azlocillin, mezlocillin, cefoperazon, cefotaksim, ceftriakson, cefipim, ceftolozan og ceftazidim.

29. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 27, hvori beta-laktamantibiotikumet er imipenem.

15

30. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 16, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en terapeutisk effektiv mengde av imipenem, cilastatin og relebaktam for anvendelse ved behandling av en bakterieinfeksjon.

20 **31.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 27–30, hvori bakterieinfeksjonen skyldes *Pseudomonas spp.*, *Klebsiella spp.*, *Enterobacter spp.*, *Escherichi spp.*, *Morganella spp.*, *Citrobacter spp.*, *Serratia, spp.* eller *Acinetobacter spp.*