

1

**JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.**  
**ABOGADOS**

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**No. 13-037941- -00002-0000**

Fecha: 2013-05-07 16:38:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 22

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. \_\_\_\_\_ S. \_\_\_\_\_ D. \_\_\_\_\_

Re: PI.-**REMPEX PHARMACEUTICALS, INC.**-Solicitud de Patente de  
Invencción en Fase Nacional para "**DERIVADOS ÉSTER DE ÁCIDO**  
**BORÓNICO CÍCLICO Y SUS USOS TERAPÉUTICOS**".-Clase  
**C07F 5/02.-Expediente número 13-037.941.-**

1. Me refiero al Oficio No. **4998** dictado por ese Despacho y notificado por fijación en lista de 12 de Marzo de 2013.

2. Atentamente me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar, en forma voluntaria, un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al originalmente presentado, el cual ahora consta de **54** reivindicaciones, y en el que se han realizado las siguientes modificaciones:

- Las reivindicaciones **1** a **35** del nuevo capítulo reivindicatorio, corresponden a las reivindicaciones **1** a **35** respectivamente, del capítulo reivindicatorio originalmente presentado.
- Las reivindicaciones **36** a **54** del nuevo capítulo reivindicatorio, corresponden a las reivindicaciones **59** a **77** respectivamente, del capítulo reivindicatorio originalmente presentado.
- Las reivindicaciones **36** a **58**, y **78** del capítulo reivindicatorio originalmente presentado, han sido **eliminadas**.

En relación con este nuevo capítulo reivindicatorio, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que el mismo **no amplía** de manera alguna el alcance de la presente invención, tal como fue originalmente

presentada, toda vez que este solamente se presenta con el fin de definir en forma más clara y concisa el objeto de la presente invención.

Adicionalmente, dicho nuevo capítulo reivindicatorio se encuentra perfectamente sustentado en el capítulo reivindicatorio actualmente presentado para la solicitud, tal como se expuso anteriormente.

3. Por otra parte, atentamente me permito allegar los recibos de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones **11** a **54** del nuevo capítulo reivindicatorio, el cual deberá ser estudiado junto con la presente solicitud.

4. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de correcciones y modificaciones;
- (b) Recibo número 13-0037594, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones causadas por la presentación del nuevo capítulo reivindicatorio;
- (c) Recibo número 13-0037690, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa correspondiente a las reivindicaciones **11** a **54**; y
- (d) Copia de las páginas **176** a **193** que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de **54** reivindicaciones.

5. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,

  
ALICIA LLORED A RICAURTE

T.P. 53.215

|                                                                                                                                             |                                                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|
| <br><b>Industria y Comercio</b><br><b>SUPERINTENDENCIA</b> | Espacio reservado para el adhesivo de radicación |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|

**DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES  
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES**

1. Identificación del Trámite

☐ Error material ☒ Modificación a una Solicitud en trámite

☒ Patente de Invención

☐ Patente de Modelo de Utilidad

☐ Registro de Diseño Industrial

☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del Solicitante:

Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒

**REMPEX PHARMACEUTICALS, INC**  
Nombre o Denominación / Nombre o Razón Social Completa

**ALICIA LLOREDA RICAURTE**  
Nombre Representante Legal

Tipo de Empresa                      Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☒

Documento de Identificación    ☒ C.C.    ☐ C.E.    ☐ NIT    ☐ Otro Número    **39.690.713**

|                                               |                                                                                  |                   |
|-----------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------|-------------------|
| Nacionalidad / País de Constitución           | Dirección y Domicilio del Titular                                                | Ciudad            |
| Estado de Delaware, Estados Unidos de América | 11535 Sorrento Valley Road, San Diego, CA 92121-1309, Estados Unidos de América. | San Diego         |
| Dirección Electrónica                         | Fax                                                                              | Número Telefónico |
| Notificaciones patentes@lloredacamacho.com    | 6069701                                                                          | 3264270           |

☒ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del Apoderado:

**LLOREDA RICAURTE ALICIA**                      **C.C. 39.690.713**                      **53.215**  
Apellidos y Nombre                      Documento de Identificación                      Tarjeta Profesional

|                                           |         |                   |
|-------------------------------------------|---------|-------------------|
| Dirección y Domicilio                     |         | Ciudad            |
| Calle 72 No. 5-83 Piso 5º                 |         | Bogotá D.C.       |
| Dirección Electrónica                     | No. Fax | Número Telefónico |
| notificacionespatentes@lloredacamacho.com | 6069701 | 3264270           |

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general \_\_\_\_\_

4. Datos del Trámite

Corrección:

Expediente No. 13-037.941

Aparece

Debe ser

Modificación:

☒ Modificación al Capítulo Reivindicatorio.

☐ Modificación al Capítulo Descriptivo.

☐ Modificación al Resumen.

☐ Modificación a los Dibujos.

☐ Modificación al Solicitante.

5. Anexos

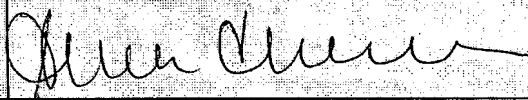
☒ Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación.

☐ Poder, si fuere el caso.

☒ Documento que contiene las modificaciones o correcciones.

☐ Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma

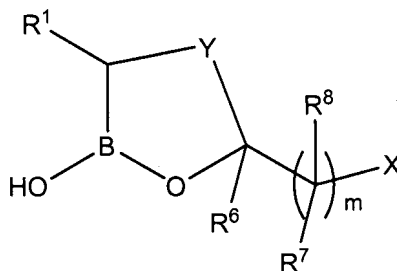
|                         |  |                                                                                      |
|-------------------------|--|--------------------------------------------------------------------------------------|
| Nombre y apellidos      |  | Firma                                                                                |
| ALICIA LLOREDA RICAURTE |  |  |
| Representante Apoderado |  |                                                                                      |
| C.C. 39.690.713         |  | Tarjeta Profesional 53.215                                                           |

|                                                                                                                                         |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|------------------------------------------------------------|----------------|------------------------------------------|---------------|
| SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO<br>NIT : 800.176.089-2<br>- / -                                                                |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| <br><b>Industria y Comercio</b><br>SUPERINTENDENCIA    | RECIBO DE CAJA                                   |                                                            |                | <b>No. 13 - 0037594</b>                  |               |
|                                                                                                                                         |                                                  |                                                            |                | Bogotá D.C., Abril 23 de 2013 - 08:20:33 |               |
| RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.                                                                                                       |                                                  |                                                            |                | NI 830.022.145                           |               |
| *** Soporte del Pago ***                                                                                                                |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| TIPO PAGO                                                                                                                               | BANCO                                            | CUENTA                                                     | No. PAGO       | FECHA PAGO                               | VR. PAGO      |
| CONSIGNACION                                                                                                                            | BANCO DE BOGOTA                                  | 062754387                                                  | 534292732      | 22/04/2013                               | 19.279.000.00 |
| *** Conceptos Pagados ***                                                                                                               |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| CANT.                                                                                                                                   | RENTISTICO                                       | CONCEPTO                                                   | Vr. UNIDITARIO | Vr. CONCEPTO                             |               |
| 1                                                                                                                                       | 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES | 823 SOLICITUD MODIFICACIONES CAMBIO SOLICITANTE POR CESION | 125.000.00     | 125.000.00                               |               |
|                                                                                                                                         |                                                  |                                                            |                | \$125.000.00                             |               |
|                                                                                                                                         |                                                  |                                                            | =====          |                                          |               |
| SON: **CIENTO VEINTICINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***                                                                                 |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Responsable: _____                                                                                                                      |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____                                                                                         |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO                                                                                                |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
|                                                     |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| No. 13-037941- -00002-0000                                                                                                              |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Fecha: 2013-05-07 16:38:04 Dep. 2020 DIR. NUEVASCR                                                                                      |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII                                                                                             |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 22                                                                                                      |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia                                                             |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240 |                                                  |                                                            |                |                                          |               |
| , Abril 23 de 2013 - 08:20:41                                                                                                           |                                                  |                                                            |                |                                          |               |

, Abril 23 de 2013 - 09:17:42

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la estructura de Fórmula I:



I

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

Y es un enlazador alquileo de 1-4 átomos o un alquenileno de 2-4 átomos, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en Cl, F, CN, CF<sub>3</sub>, -R<sup>9</sup>, -OR<sup>9</sup>, -C(=O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, y -C(=O)OR<sup>9</sup>, en donde dicho enlazador alquileo o alquenileno está opcionalmente fusionado a un arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, o heterociclilo opcionalmente sustituido;

R<sup>1</sup> se selecciona de un grupo que consiste en alquilo C<sub>1-9</sub>, alquenilo C<sub>2-9</sub>, alquinilo C<sub>2-9</sub>, -NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, alquilo C<sub>1-9</sub>R<sup>11</sup>, alquenilo C<sub>2-9</sub>R<sup>11</sup>, alquinilo C<sub>2-9</sub>R<sup>11</sup>, -carbociclilo-R<sup>11</sup>, -CH(OH)alquilo C<sub>1-9</sub>R<sup>9</sup>, -CH(OH)alquenilo C<sub>2-9</sub>R<sup>9</sup>, -CH(OH)alquinilo C<sub>2-9</sub>R<sup>9</sup>, -CH(OH)carbociclilo-R<sup>9</sup>, -C(=O)R<sup>9</sup>, -C(=O)alquilo C<sub>1-9</sub>R<sup>9</sup>, -C(=O)alquenilo C<sub>2-9</sub>R<sup>9</sup>, -C(=O)alquinilo C<sub>2-9</sub>R<sup>9</sup>, -C(=O)carbociclilo C<sub>2-9</sub>R<sup>9</sup>, -C(=O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=O)R<sup>9</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=O)OR<sup>9</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=O)C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>9</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=O)C(=CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)R<sup>9</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=O)alquilo C<sub>1-4</sub>.N(R<sup>9</sup>)C(=O)R<sup>9</sup>, -N(R<sup>9</sup>)C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>9</sup>, -C(=NR<sup>10</sup>)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -N=C(R<sup>9</sup>)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -N(R<sup>9</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -N(R<sup>9</sup>)SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -N=CHR<sup>9</sup>, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, carbociclilo sustituido o no sustituido, y heterociclilo sustituido o no sustituido;

R<sup>6</sup> se selecciona de un grupo que consiste en H, alquilo C<sub>1-9</sub>, alquenilo C<sub>2-9</sub>, alquinilo C<sub>2-9</sub>, carbociclilo, -alquilo C<sub>1-9</sub>R<sup>11</sup>, -alquenilo C<sub>2-9</sub>R<sup>11</sup>, -alquinilo C<sub>2-9</sub>R<sup>11</sup>, carbociclilo-R<sup>11</sup>, -C(=O)OR<sup>9</sup>, -alquilo C<sub>1-9</sub>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -alquenilo C<sub>2-9</sub>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -alquinilo C<sub>2-9</sub>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, y -Carbociclilo-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, o alternativamente:

(i) R<sup>6</sup> y un R<sup>7</sup> se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido,

(ii) R<sup>6</sup> y un átomo de carbono en Y se toman juntos con átomos interpuestos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido, o

(iii)  $R^6$  está ausente cuando el átomo de carbono al que está unido es un átomo de un anillo en un anillo arilo o heteroarilo;

cada  $R^7$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H, halo, -alquilo  $C_{1-9}$ , -alquenilo  $C_{2-9}$ , -alquinilo  $C_{2-9}$ ,  $-NR^9R^{10}$ ,  $-OR^9$ , -alquilo  $C_{1-9}CO_2R^9$ , -alquenilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , -alquinilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , y -carbociclilo- $CO_2R^9$ , o independientemente:

(i)  $R^6$  y un  $R^7$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido,

(ii)  $R^7$  y un  $R^8$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido,

(iii) un  $R^7$  y un átomo de carbono en Y se toman juntos con átomos interpuestos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido,

(iv) cada una de las siguientes condiciones se cumple:

(a) Y es un enlazador alquileo de 3-4 átomos o alquenileno de 3-4 átomos,

(b)  $R^6$  está ausente,

(c)  $R^7$  y un átomo de carbono en Y se toman juntos con átomos interpuestos para formar un arilo sustituido o no sustituido o un heteroarilo sustituido o no sustituido, y

(d) cada  $R^8$  unido a un átomo de un anillo que hace parte del arilo sustituido o no sustituido o un heteroarilo sustituido o no sustituido formado por  $R^7$  y Y está ausente;

cada  $R^8$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H, halo, -alquilo  $C_{1-9}$ , -alquenilo  $C_{2-9}$ , -alquinilo  $C_{2-9}$ ,  $-NR^9R^{10}$ ,  $-OR^9$ , -alquilo  $C_{1-9}CO_2R^9$ , -alquenilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , -alquinilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , -carbociclilo- $CO_2R^9$ , o independientemente:

(i) un  $R^7$  y un  $R^8$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido,

(ii) un  $R^7$  y  $R^8$  geminales forman juntos -alquenilenilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , o

(iii) cada  $R^8$  unido a un átomo de un anillo que es parte de un arilo sustituido o no sustituido está ausente;

cada  $R^9$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H, -alquilo  $C_{1-9}$ , -alquenilo  $C_{2-9}$ , -alquinilo  $C_{2-9}$ , carbociclilo, -alquilo  $C_{1-9}R^{11}$ , -alquenilo  $C_{2-9}R^{11}$ , -alquinilo  $C_{2-9}R^{11}$ , -carbociclilo- $R^{11}$ , arilo sustituido o no sustituido,





$R^6$  se selecciona de un grupo que consiste en H, -alquilo  $C_{1-9}$ , -alquenilo  $C_{2-9}$ , -alquinilo  $C_{2-9}$ , -alquilo  $C_{1-9}R^{11}$ , -alquenilo  $C_{2-9}R^{11}$ , -alquinilo  $C_{2-9}R^{11}$ ,  $-C(=O)OR^9$ , y -alquilo  $C_{1-9}CO_2R^9$ , -alquenilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , y -alquinilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , o alternativamente  $R^6$  y un  $R^7$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido;

cada  $R^7$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H,  $-NR^9R^{10}$ ,  $-OR^9$ , y -alquilo  $C_{1-9}CO_2R^9$ , -alquenilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , y -alquinilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , o independientemente,  $R^6$  y un  $R^7$  o independientemente un  $R^7$  y un  $R^8$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido;

cada  $R^8$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H,  $-NR^9R^{10}$ ,  $-OR^9$ , y -alquilo  $C_{1-9}CO_2R^9$ , -alquenilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , y -alquinilo  $C_{2-9}CO_2R^9$ , o independientemente, un  $R^7$  y un  $R^8$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido;

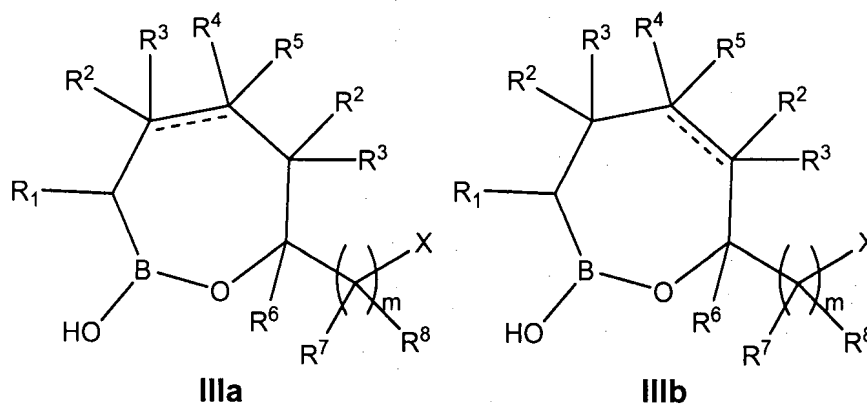
cada  $R^9$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H, -alquilo  $C_{1-9}$ , alquenilo  $C_{2-9}$ , -alquinilo  $C_{2-9}$ , -alquilo  $C_{1-9}R^{11}$ , -alquenilo  $C_{2-9}R^{11}$ , -alquinilo  $C_{2-9}R^{11}$ , arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, sustituido o no sustituido  $-(CH_2)_{0-3}$ carbociclilo, y heterociclilo sustituido o no sustituido;

cada  $R^{10}$  se selecciona independientemente de un grupo que consiste en H, -alquilo  $C_{1-9}$ ,  $-OR^9$ ,  $-CH(=NH)$ , arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, carbociclilo sustituido o no sustituido, y heterociclilo sustituido o no sustituido; y

X se selecciona de un grupo que consiste en  $-CO_2H$  e isómeros del ácido carboxílico.

6. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 2 a 4, en donde n es 1.

7. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene la estructura de fórmula IIIa o IIIb:



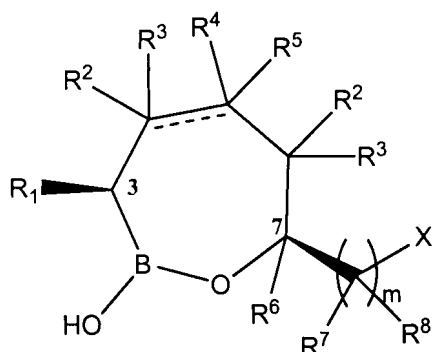
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

el enlace representado por una línea punteada y sólida representa un enlace un enlace seleccionado del grupo que consiste en un enlace sencillo y un enlace doble;

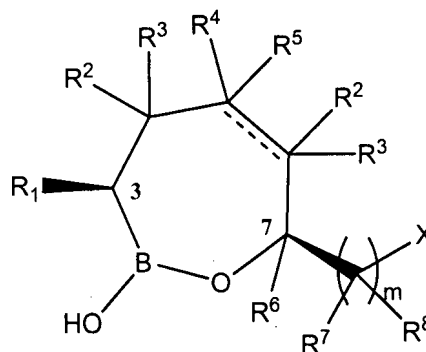
cada  $R^2$  y  $R^4$  se seleccionan independientemente de un grupo que consiste en Cl, F, CN,  $CF_3$ ,  $-R^9$ ,  $-OR^9$ ,  $-C(=O)NR^9R^{10}$ , y  $-C(=O)OR^9$ ; o alternatively, un  $R^2$  y  $R^4$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido;

cada  $R^3$  y  $R^5$  se seleccionan independientemente de un grupo que consiste en Cl, F, CN,  $CF_3$ ,  $-R^9$ ,  $-OR^9$ ,  $-C(=O)NR^9R^{10}$ , y  $-C(=O)OR^9$ , con la condición de que si el enlace representado por una línea punteada y sólida es un doble enlace entonces  $R^3$  y  $R^5$  están ausentes.

8. El compuesto de la reivindicación 7, que tiene la estereoquímica 3,7-cis mostrada en las Fórmulas IIIc y III d:



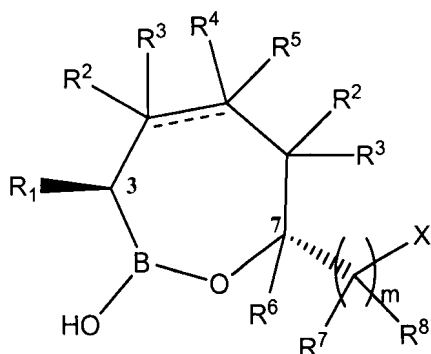
IIIc



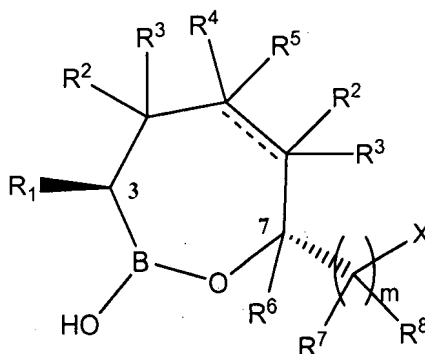
III d

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. El compuesto de la reivindicación 7, que tiene la estereoquímica 3,7-trans mostrada en las Fórmulas IIIe y III f:



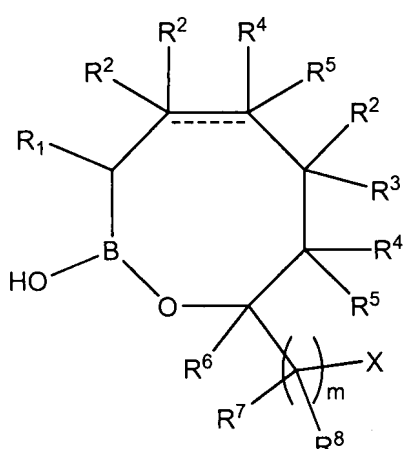
IIIe



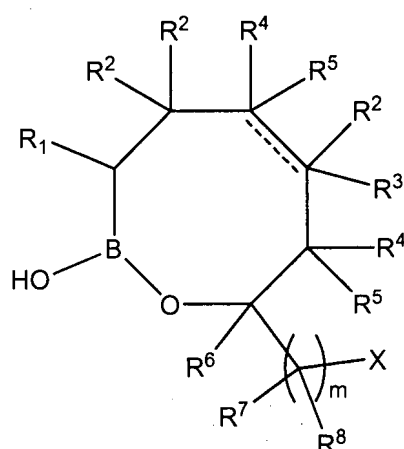
III f

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

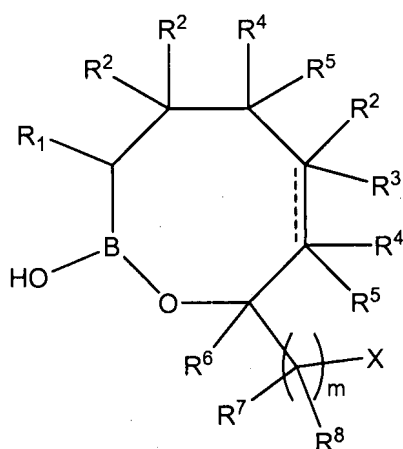
10. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene la estructura de fórmula IVa, IVb, o IVc:



IVa



IVb



IVc

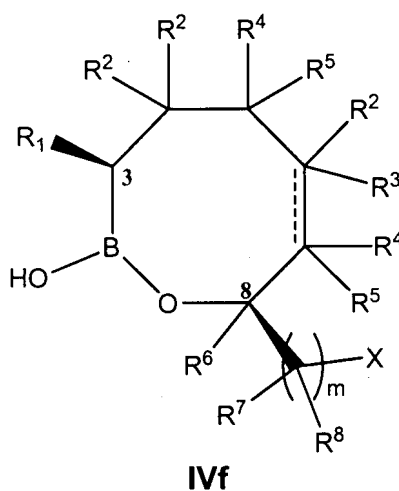
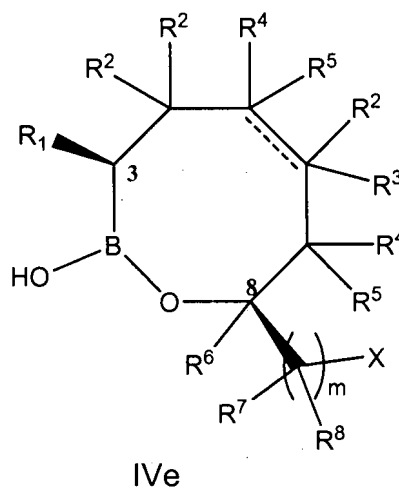
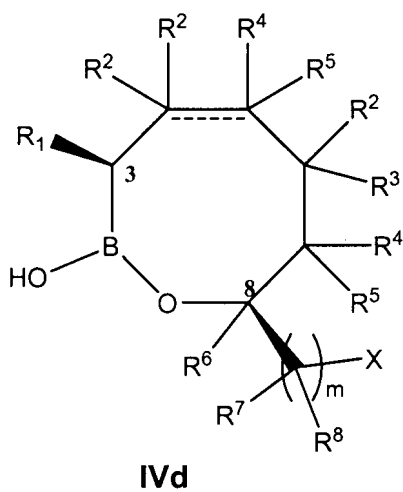
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

el enlace representado por una línea punteada y sólida representa un enlace un enlace seleccionado del grupo que consiste en un enlace sencillo y un enlace doble;

cada  $R^2$  y cada  $R^4$  se seleccionan independientemente de un grupo que consiste en Cl, F, CN,  $CF_3$ ,  $-R^9$ ,  $-OR^9$ ,  $-C(=O)NR^9R^{10}$ , y  $-C(=O)OR^9$ ; o alternativamente, un  $R^2$  y un  $R^4$  se toman juntos con los átomos a los que están unidos para formar un arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, carbociclilo sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido;

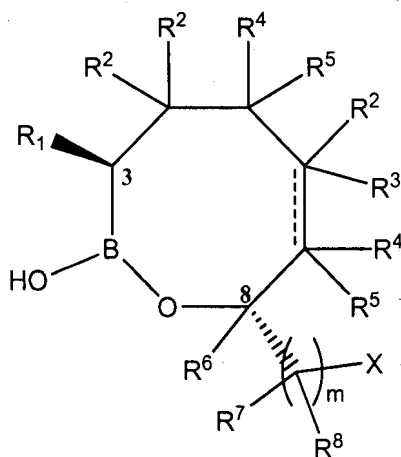
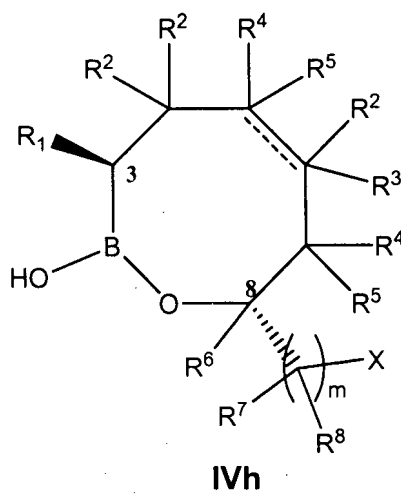
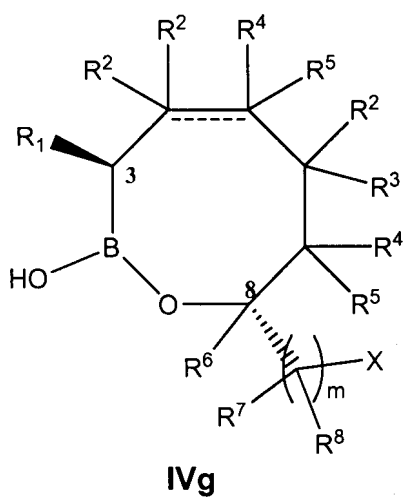
cada  $R^3$  y cada  $R^5$  se seleccionan independientemente de un grupo que consiste en Cl, F, CN,  $CF_3$ ,  $-R^9$ ,  $-OR^9$ ,  $-C(=O)NR^9R^{10}$ , y  $-C(=O)OR^9$ , con la condición de que si el enlace representado por una línea punteada y sólida es un doble enlace entonces  $R^3$  y  $R^5$  unidos a los átomos de carbono que enlazaron ese enlace están ausentes.

11. El compuesto de la reivindicación 10, que tiene la estereoquímica 3,8-cis mostrada en las Fórmulas IVd, IVe, y IVf:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

12. El compuesto de la reivindicación 10, que tiene la estereoquímica 3,8-trans mostrada en las Fórmulas IVg, IVh, y IVi:



## IVi

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

13. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 2-12, en donde cada  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ , y  $R^5$  son hidrógeno.

14. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 2-13, en donde el enlace representado por una línea punteada y sólida es un enlace sencillo.

15. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 2-13, en donde el enlace representado por una línea punteada y sólida es un enlace doble.

16. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-15, en donde  $R^6$  y cada  $R^7$  y  $R^8$  es hidrógeno.

17. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-16, en donde  $R^1$  es  $-NHC(=O)$  alquilo  $C_{1-9}R^{11}$ .

18. El compuesto de la reivindicación 17, en donde  $R^{11}$  es arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido.

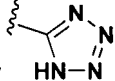
19. El compuesto de la reivindicación 18, en donde  $R^{11}$  es tien-2-ilo.

20. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-19, en donde  $R^1$  es  $-NHC(=O)C(=NOR^9)R^9$ , en donde  $R^9$  se selecciona del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-9}$ , arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, carbociclilo sustituido o no sustituido y heterociclilo sustituido o no sustituido.

21. El compuesto como en cualquiera de las reivindicaciones 1-20, en donde X es  $-CO_2H$ .

22. El compuesto como en cualquiera de las reivindicaciones 1-20, en donde X es un isótero de un ácido carboxílico.

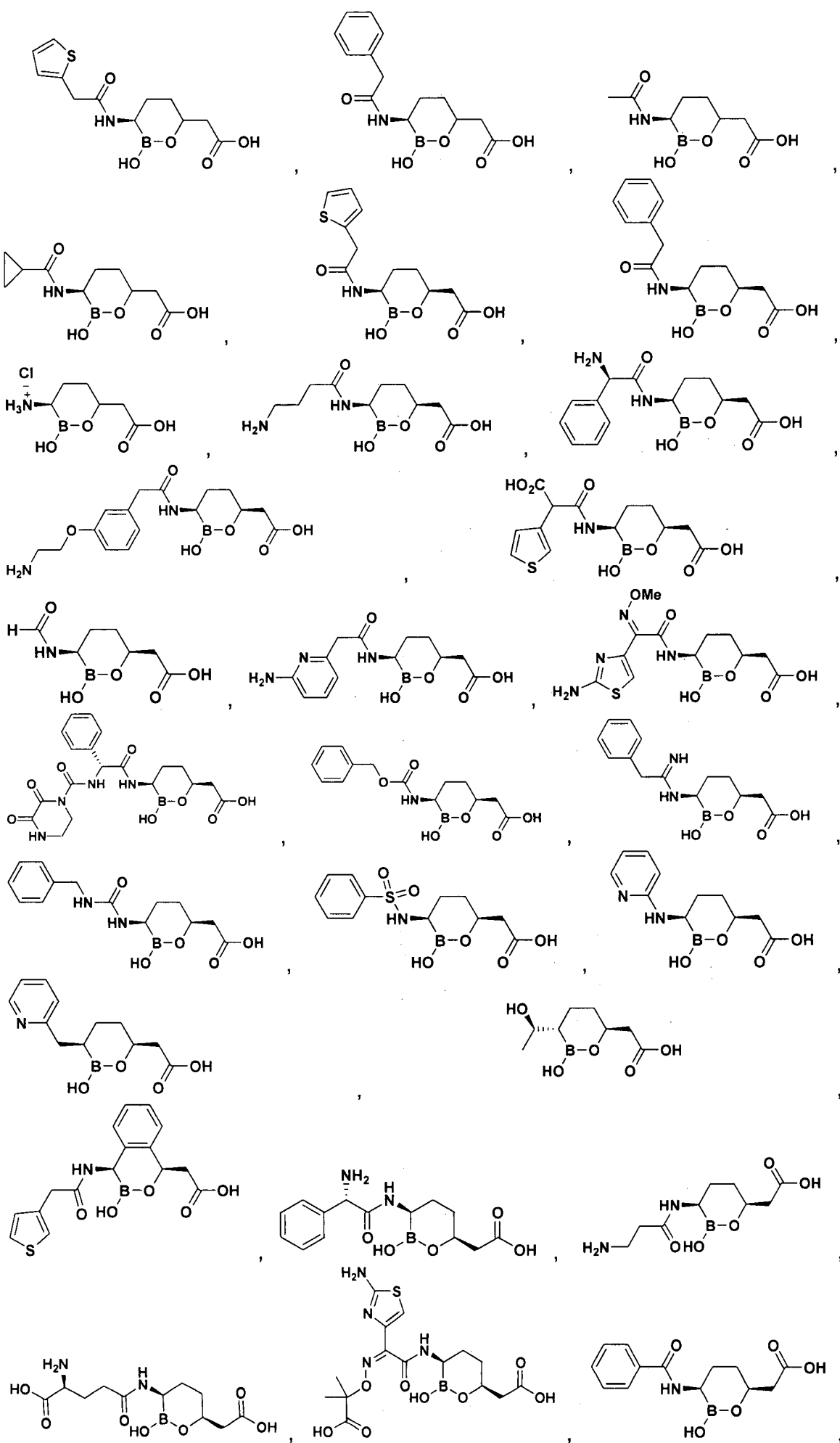
23. El compuesto de la reivindicación 22, en donde el isótero del ácido carboxílico se selecciona del grupo que consiste en  $-P(O)(OR^9)_2$ ,  $-P(O)(R^9)(OR^9)$ ,  $-P(O)(OR^{12'})_2$ ,  $-P(O)(R^9)(OR^{12'})$ ,  $-CON(R^9)OH$ ,  $-SO_3H$ ,  $-$

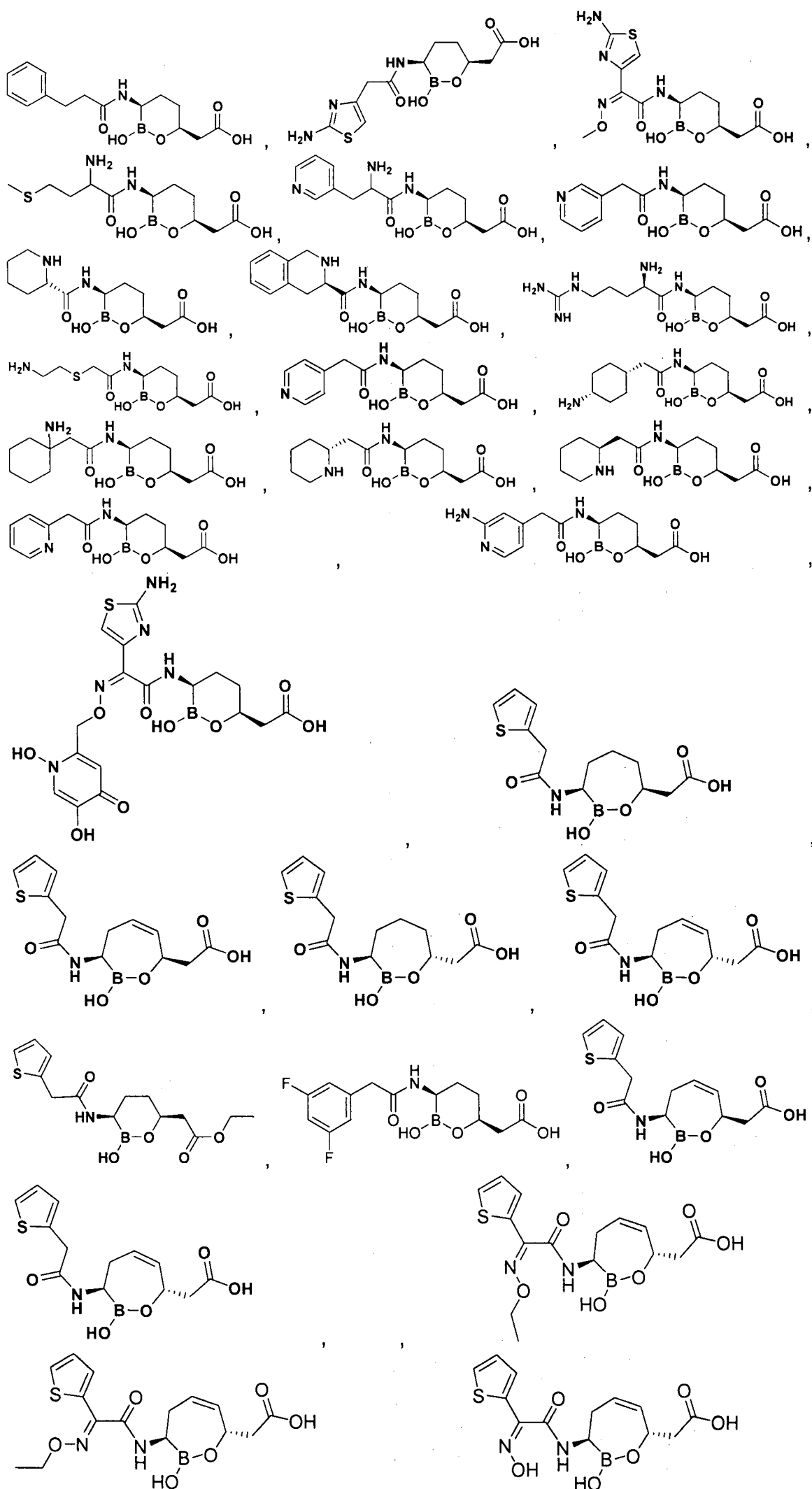
$SO_2N(R^9)OH$ , y , en donde  $R^{12'}$  se selecciona del grupo que consiste en H,  $R^{11}$ ,  $-C(R^{13})_2OC(O)$ alquilo  $C_{1-9}$ ,  $-C(R^{13})_2OC(O)R^{11}$ ,  $-C(R^{13})_2OC(O)O$  alquilo  $C_{1-9}$  y  $-C(R^{13})_2OC(O)OR^{11}$ .

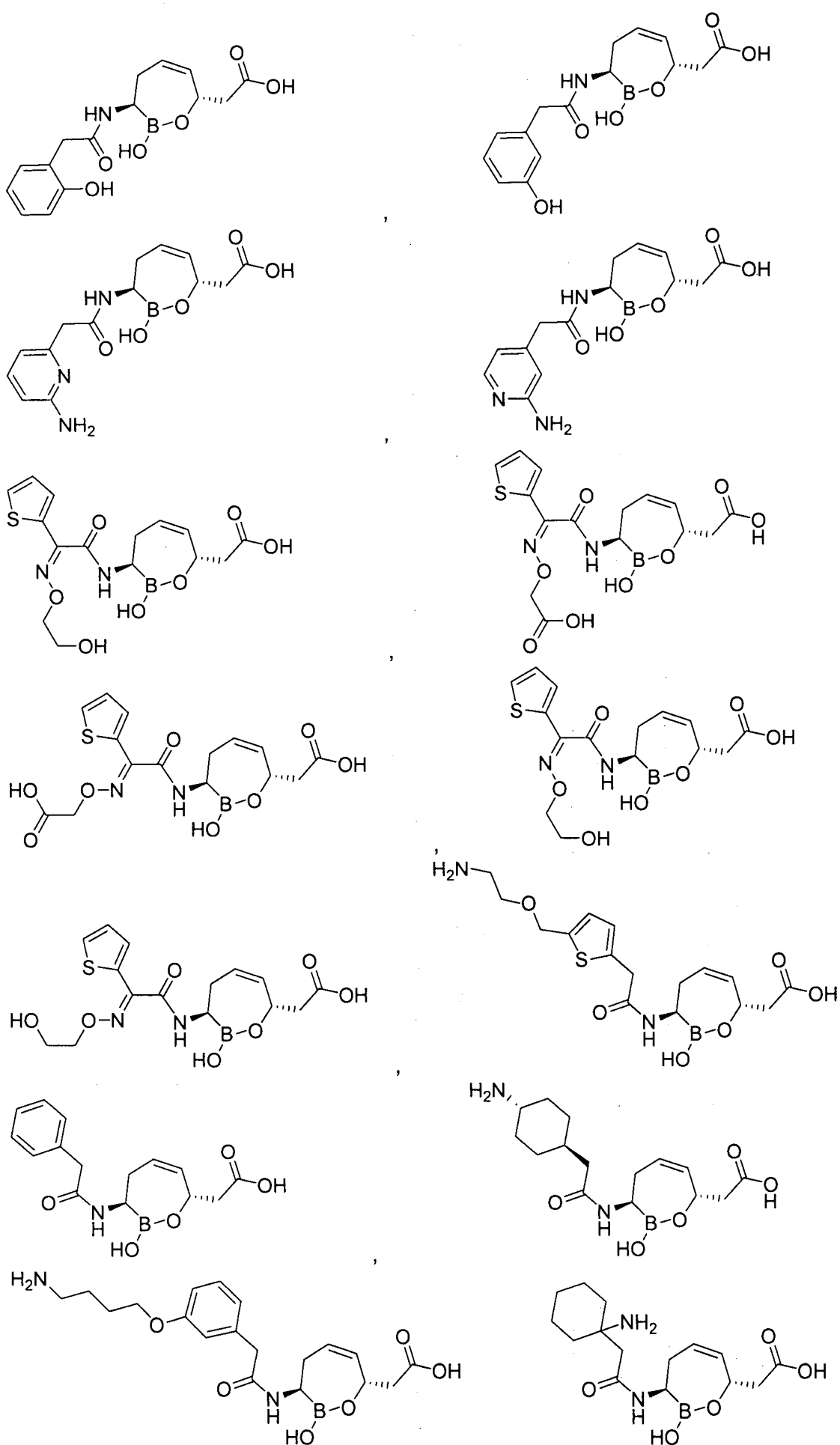
24. El compuesto como en cualquiera de las reivindicaciones 1-23, en donde m es 1.

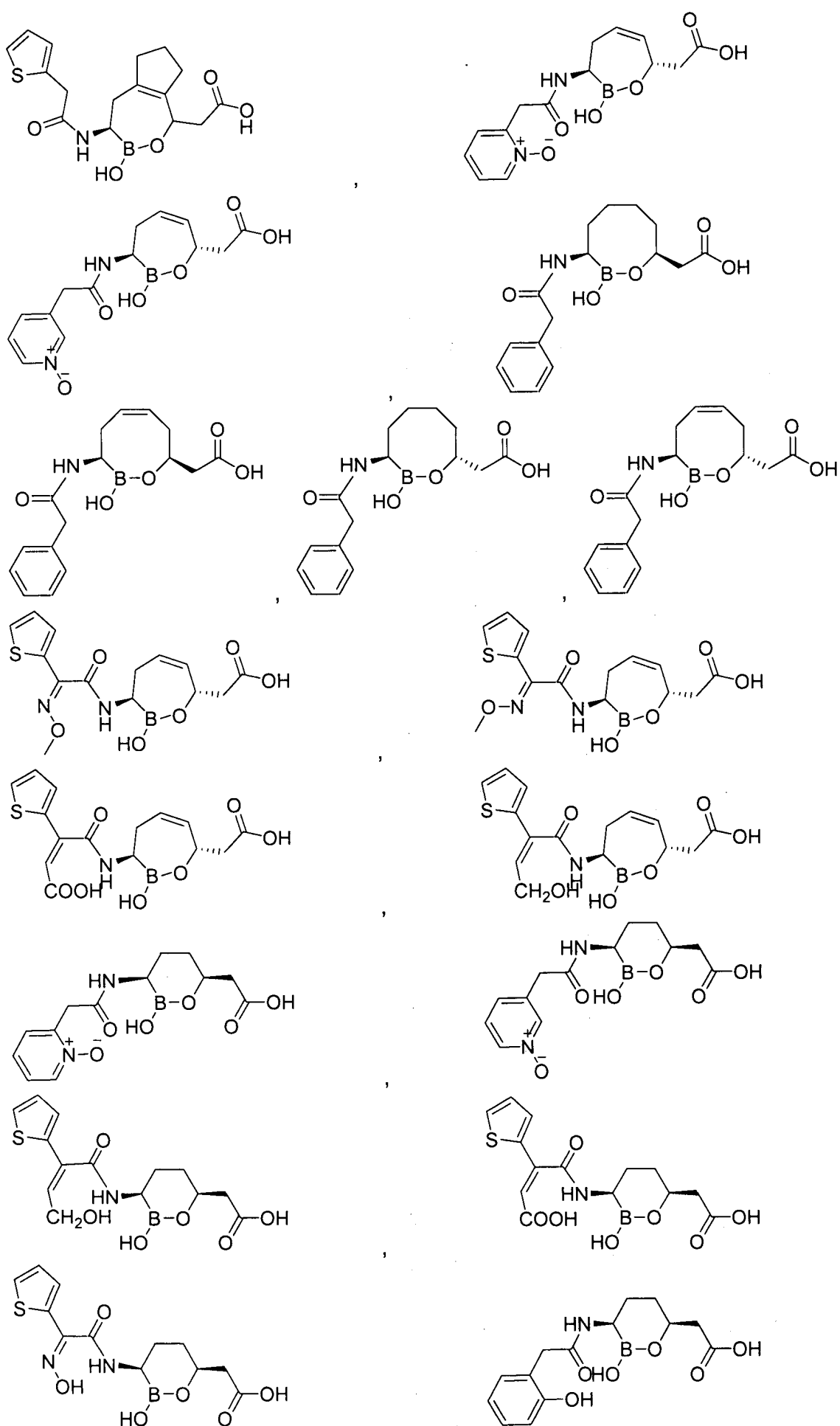
25. El compuesto como en cualquiera de las reivindicaciones 1-24, en donde  $R^6$ ,  $R^7$  y  $R^8$  son H.

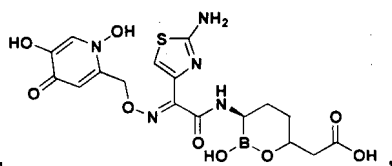
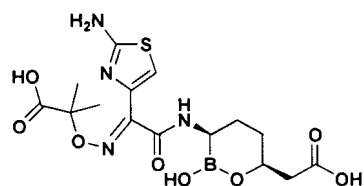
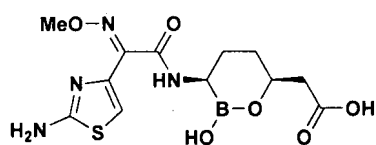
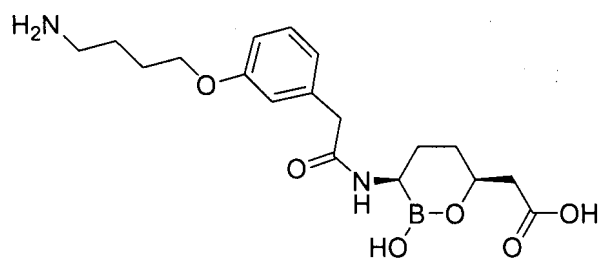
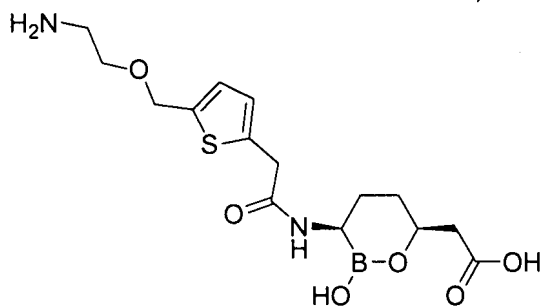
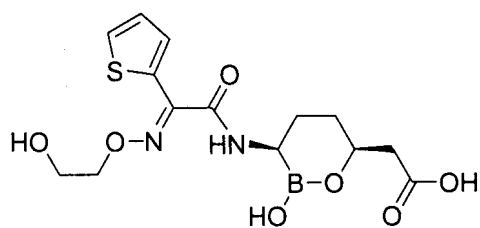
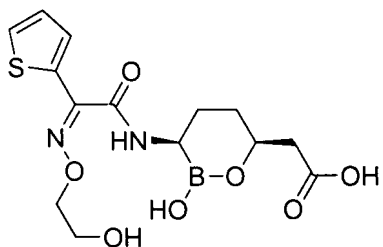
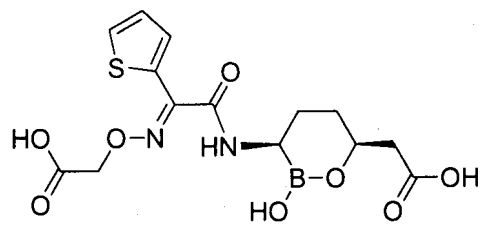
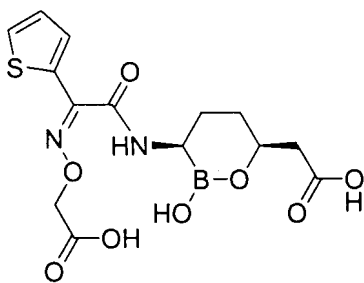
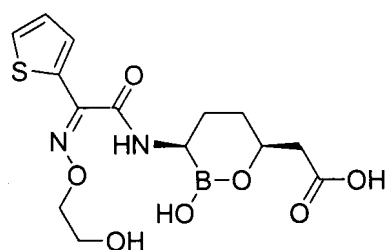
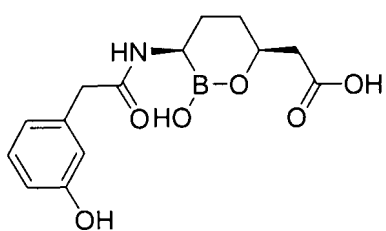
26. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene una estructura seleccionada del grupo que consiste en:

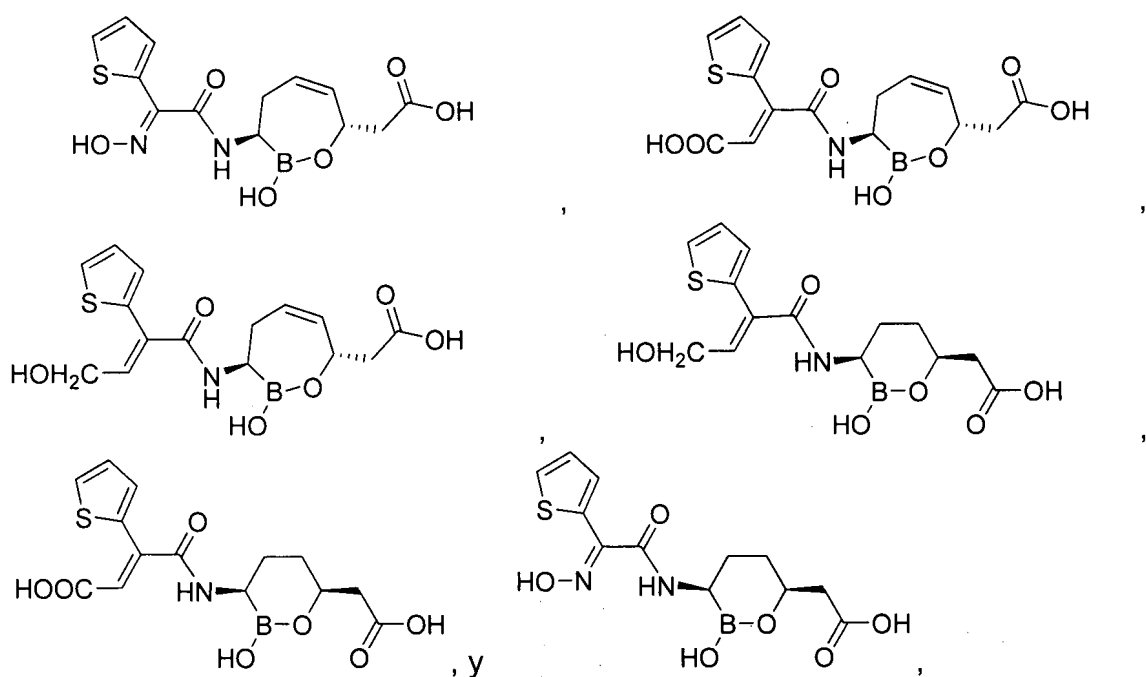






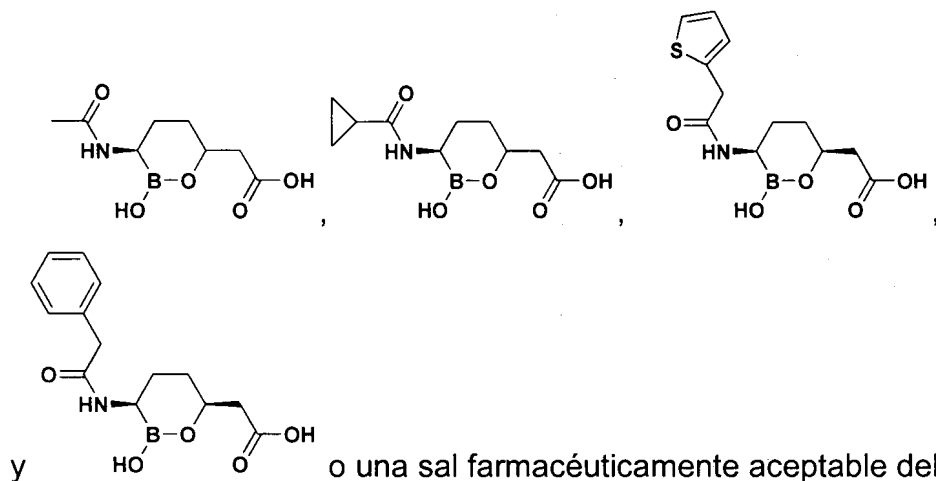






o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

27. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene una estructura seleccionada del grupo que consiste en:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

28. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-27 y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

29. La composición farmacéutica de la reivindicación 28, que comprende adicionalmente un medicamento adicional.

30. La composición de la reivindicación 29, en donde el medicamento adicional se selecciona de un agente antibacteriano, un agente antifúngico, un agente antiviral, un agente anti-inflamatorio, o un agente anti-alérgico.

31. La composición de la reivindicación 30, en donde el medicamento adicional es un agente antibacteriano de una  $\beta$ -lactama.

32. La composición de la reivindicación 31, en donde la  $\beta$ -lactama se selecciona de Amoxicilina, Ampicilina (Pivampicilina, Hetacilina, Bacampicilina,

Metampicilina, Talampicilina), Epicilina, Carbenicilina (Carindacilina), Ticarcilina, Temocilina, Azlocilina, Piperacilina, Mezlocilina, Mecilinam (Pivmecilinam), Sulbenicilina, Benzylpenicilina (G), Clometocilina, Benzatina bencilpenicilina, Procaina bencilpenicilina, Azidocilina, Penamecilina, fenoximetilpenicilina (V), Propicilina, Benzatina fenoximetilpenicilina, feneticilina, Cloxacilina (Dicloxacilina, Flucloxacilina), Oxacilina, Meticilina, Nafcilina, Faropenem, Biapenem, Doripenem, Ertapenem, Imipenem, Meropenem, Panipenem, Tomopenem, Razupenem, Cefazolina, Cefacetrilo, Cefadroxilo, Cefalexina, Cefaloglicina, Cefalonio, Cefaloridina, Cefalotina, Cefapirina, Cefatrizina, Cefazedona, Cefazaflur, Cefradina, Cefroxadina, Ceftezol, Cefaclor, Cefamandol, Cefminox, Cefonicida, Ceforanida, Cefotiam, Cefprozil, Cefbuperazona, Cefuroxima, Cefuzonam, Cefoxitina, Cefotetan, Cefmetazol, Loracarbef, Cefixima, Ceftacidima, Ceftriaxona, Cefcapene, Cefdaloxima, Cefdinir, Cefditoreno, Cefetamet, Cefmenoxima, Cefodicima, Cefoperazona, Cefotaxima, Cefpimizol, Cefpiramida, Cefpodoxima, Cefsulodina, Cefteram, Ceftibuteno, Ceftioleño, Ceftizoxima, Flomoxef, Latamoxef, Cefepima, Cefozoprano, Cefpiroma, Cefquinoma, Ceftobiprol, Ceftarolina, CXA-101, RWJ-54428, MC-04,546, ME1036, BAL30072, SYN 2416, Ceftiofur, Cefovecina, Aztreonam, Tigemonam, Carumonam, RWJ-442831, RWJ-333441, o RWJ-333442.

33. La composición de la reivindicación 31, en donde la  $\beta$ -lactama se selecciona de Ceftacidima, Biapenem, Doripenem, Ertapenem, Imipenem, Meropenem, o Panipenem.

34. La composición de la reivindicación 31, en donde la  $\beta$ -lactama se selecciona de Aztreonam, Tigemonam, BAL30072, SYN 2416, o Carumonam.

35. La composición de la reivindicación 34, en donde:

la  $\beta$ -lactama es Tigemonam;

la composición es apropiada para administración oral;

X es  $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$ ; y

$\text{R}^{12}$  se selecciona de un grupo que consiste en alquilo  $\text{C}_{1-9}$ ,  $-(\text{CH}_2)_{0-3}-\text{R}^{11}$ ,  $-\text{C}(\text{R}^{13})_2\text{OC}(\text{O})\text{alquilo } \text{C}_{1-9}$ ,  $-\text{C}(\text{R}^{13})_2\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$ ,  $-\text{C}(\text{R}^{13})_2\text{OC}(\text{O})\text{O alquilo } \text{C}_{1-9}$  y  $-\text{C}(\text{R}^{13})_2\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{11}$ .

36. Un contenedor estéril que comprende:

Un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-27 en forma sólida; y

Un agente antibacteriano en forma sólida.

37. El contenedor de la reivindicación 36, en donde el agente antibacteriano es una  $\beta$ -lactama.

38. El contenedor de la reivindicación 37, en donde la  $\beta$ -lactama se selecciona de Amoxicilina, Ampicilina (Pivampicilina, Hetacillin, Bacampicilina,

Metampicilina, Talampicilina), Epicilina, Carbenicilina (Carindacilina), Ticarcilina, Temocilina, Azlocilina, Piperacilina, Mezlocilina, Mecilinam (Pivmecilinam), Sulbenicilina, Benzylpenicilina (G), Clometocilina, Benzatina bencilpenicilina, Procaina bencilpenicilina, Azidocilina, Penamecilina, fenoximetilpenicilina (V), Propicilina, Benzatina fenoximetilpenicilina, feneticilina, Cloxacilina (Dicloxacilina, Flucloxacilina), Oxacilina, Meticilina, Nafcilina, Faropenem, Biapenem, Doripenem, Ertapenem, Imipenem, Meropenem, Panipenem, Tomopenem, Razupenem, Cefazolina, Cefacetrilo, Cefadroxilo, Cefalexina, Cefaloglicina, Cefalonio, Cefaloridina, Cefalotina, Cefapirina, Cefatrizina, Cefazedona, Cefazaflur, Cefradina, Cefroxadina, Ceftezol, Cefaclor, Cefamandol, Cefminox, Cefonicida, Ceforanida, Cefotiam, Cefprozil, Cefbuperazona, Cefuroxima, Cefuzonam, Cefoxitina, Cefotetan, Cefmetazol, Loracarbef, Cefixima, Ceftacidima, Ceftriaxona, Cefcapene, Cefdaloxima, Cefdinir, Cefditoreno, Cefetamet, Cefmenoxima, Cefodicima, Cefoperazona, Cefotaxima, Cefpimizol, Cefpiramida, Cefpodoxima, Cefsulodina, Cefteram, Ceftibuteno, Ceftiolen, Ceftizoxima, Flomoxef, Latamoxef, Cefepima, Cefozoprano, Cefpiroma, Cefquinoma, Ceftobiprol, Ceftarolina, CXA-101, RWJ-54428, MC-04,546, ME1036, BAL30072, SYN 2416, Ceftiofur, Cefovecina, Aztreonam, Tigemonam, Carumonam, RWJ-442831, RWJ-333441, o RWJ-333442.

39. El contenedor de la reivindicación 37, en donde la  $\beta$ -lactama se selecciona de Ceftacidima, Biapenem, Tomopenem, Doripenem, Ertapenem, Imipenem, Meropenem o Panipenem.

40. El contenedor de la reivindicación 37, en donde la  $\beta$ -lactama se selecciona de Aztreonam, Tigemonam, BAL30072, SYN 2416, o Carumonam.

41. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-40, en donde el compuesto y el agente antibacteriano se mezclan.

42. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-40, en donde el compuesto y el agente antibacteriano no se mezclan.

43. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-42, en donde el compuesto está en forma cristalina.

44. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-43, en donde el agente antibacteriano está en forma cristalina.

45. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-42, en donde el compuesto y el agente antimicrobiano son liófilos.

46. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-45, en donde la razón molar de compuesto a agente antibacteriano es desde 1:8 hasta 8:1.

47. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-46, en donde la razón molar de compuesto a agente antibacteriano es desde 1:2 hasta 2:1.

48. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-47, en donde la razón molar de compuesto a agente antibacteriano es desde 1:1.

49. El contenedor de cualquiera de las reivindicaciones 36-48, que comprende adicionalmente un agente para ajustar el pH.

50. El contenedor de la reivindicación 49, en donde el agente para ajustar el pH comprende NaOH.

51. El contenedor de la reivindicación 49 en donde el agente para ajustar el pH comprende ácido cítrico.

52. Un método para preparar una composición farmacéutica para administración, que comprende reconstituir los contenidos del contenedor estéril de la reivindicación 47 utilizando un diluyente farmacéuticamente aceptable.

53. El método de la reivindicación 52, en donde el diluyente comprende una solución salina.

54. El método de la reivindicación 52, en donde el diluyente comprende una solución de dextrosa.