



**LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES
OFICIĀLAIS IZDEVUMS**

**IZGUDROJUMI,
PREČU ZĪMES UN
DIZAINPARAUGI**

10/2016

Latvijas Republikas Patentu valde
Patent Office of the Republic of Latvia

Citadeles iela 7/70
Rīga, LV - 1010
LATVIJA

Tālrunis / Phone: 67 099 600
Fakss / Fax: 67 099 650
E-pasts / E-mail: valde@lrpv.gov.lv
Tīmekļa vietne / Website: <http://www.lrpv.gov.lv>

The Official Gazette of the Patent Office of the Republic of Latvia - "Izgudrojumi, Preču Zīmes un Dizainparaugi" - contains recordings in the Registers of Inventions, Trademarks and Service Marks, Industrial Designs and Topographies of Semiconductor Products.
Date of publication of the registered inventions, trademarks and industrial designs - October 20, 2016.

IZGUDROJUMI, PREČU ZĪMES UN DIZAINPARAUGI

LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES
OFICIĀLAIS IZDEVUMS

10/2016
20. oktobris

1519. - 1708. lappuse

S A T U R S

IZGUDROJUMI

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas	1520
Izgudrojumu patentu publikācijas	1523
Attiecināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 19. panta 2. un 4. daļa)	1526
Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 71. panta 5. daļa)	1533
Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 71. panta 3. un 5. daļa)	1672
Papildu aizsardzības sertifikāti	1674
Pieteicēju, izgudrotāju un īpašnieku alfabētiskais rādītājs	1675
Izgudrojumu pieteikumu un patentu numuru rādītājs	1676

PREČU ZĪMES

Reģistrētās preču zīmes	1677
Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs	1695
Preču zīmju īpašnieku rādītājs	1696
Preču zīmju rādītājs pēc preču un pakalpojumu klasēm	1697

DIZAINPARAUGI

Reģistrētie dizainparaugi	1698
---------------------------------	------

GROZĪJUMI REĢISTROS

Grozījumi Patentu reģistrā	1700
Grozījumi Papildu aizsardzības sertifikātu reģistrā	1701
Grozījumi Dizainparaugu reģistrā	1701
Grozījumi Preču zīmju reģistrā	1701
Pamanīto kļūdu labojums	1707

C O N T E N T S

INVENTIONS

Publication of Patent Applications	1520
Publication of Invention Patents	1523
Publication of Extended European Patents (Patent Law, Article 19, Paragraphs 2 and 4)	1526
Publication of European Patents Validated in Latvia (Patent Law, Article 71, Paragraph 5)	1533
Publication of European Patents Validated in Latvia (Patent Law, Article 71, Paragraphs 3 and 5)	1672
Supplementary Protection Certificates	1674
Name Index of Applicants, Inventors and Owners	1675
Application and Patent Number Index of Inventions	1676

TRADEMARKS

Registered Trademarks	1677
Application Number Index of Trademarks	1695
Name Index of Trademark Owners	1696
Trademark Registrations Listed by Classes of Goods and Services	1697

INDUSTRIAL DESIGNS

Registered Industrial Designs	1698
-------------------------------------	------

CHANGES IN THE REGISTERS

Changes in the Patent Register	1700
Changes in the Register of Supplementary Protection Certificates	1701
Changes in the Industrial Designs Register	1701
Changes in the Trademarks Register	1701
Correction of Mistakes	1707

Publikācijas par patenta pieteikumiem ir sakārtotas Starptautiskās patenta klasifikācijas (IPC) indeksu kārtībā. Starp svītrām ir izdalītas klases, kuras šim patentam nav pamatklase un, kur kreisajā pusē pēc uzrādītās klases izceltā šriftā uzrādīts patenta numurs, uz kuru attiecas šī klase, kā arī labajā pusē pamatklases indekss. Patenta publikācijas sakārtotas dokumentu numuru kārtībā.

Publikācija satur bibliogrāfiskos datus, patenta apraksta kopsavilkumu, kā arī zīmējumu, ja tas ir pieminēts kopsavilkumā.

Tālāk ir paskaidroti Starptautisko standartu numerācijas (INID) kodi.

- (11) **Patenta numurs**
Number of the patent
- (51) **Starptautiskās klasifikācijas indekss**
Indication of International Patent Classification
- (21) Pieteikuma numurs, papildu aizsardzības sertifikāta numurs
Application number, SPC number
- (22) Pieteikuma datums
Date of filing the application
- (41) Datums, no kura iespējama iepazīšanās vai kopijas izsniegšana dokumentam, kuram **nav veikta ekspertīze** un kuram pirms šī datuma nav izsniegts patents
Date of making available to the public by viewing, or copying on request, an **unexamined** document, on which no grant has taken place on or before the said date
- (45) Datums, kurā dokuments publicēts tipogrāfiskā vai kādā citā veidā, kuram patents reģistrēts šajā vai agrākā datumā
Date of making available to the public by printing or similar process of a document on which grant has taken place on or before the said date
- (62) Agrākā pieteikuma, no kura šis pieteikums ir izdalīts, numurs un iesniegšanas datums
Number and filing date of the earlier application from which the present document has been divided up
- (31) Prioritātes pieteikuma(-u) numurs(-i)
Number(-s) assigned to priority application(-s)
- (32) Prioritātes pieteikuma(-u) datums(-i)
Date(-s) of filing of priority application(-s)
- (33) Prioritātes pieteikuma(-u) valsts identifikācijas kods(-i)
Identification code(-s) of the country of priority application(-s)
- (86) Reģionāla vai PCT pieteikuma numurs, saņemšanas datums
Application number, filing date of regional or PCT application
- (87) Reģionāla vai PCT pieteikuma publikācijas numurs, publikācijas datums
Publication number, publication data of regional or PCT application
- (71) Pieteicējs(-i), adrese, valsts kods
Name(-s) and address of applicant(-s), code of country
- (72) Izgudrotājs(-i)
Name(-s) of inventor(-s)
- (73) Patenta īpašnieks(-i), adrese, valsts kods
Name(-s) and address of grantee(-s), code of country
- (74) Patentpilnvarotais vai pārstāvis, adrese
Name and address of attorney or agent
- (76) Izgudrotājs(-i), arī pieteicējs(-i), arī patenta īpašnieks(-i), adrese, valsts kods
Name(-s) of inventor(-s) who is (are) also applicant(-s) and grantee(-s)
- (54) **Izgudrojuma nosaukums**
Title of the invention
- (57) Kopsavilkums vai formulas neatkarīgie punkti
Abstract or independent claims
- (92) Ārstniecības līdzekļa reģistrācijas apliecības numurs un izsniegšanas datums Latvijā
Number and date of marketing authorization in Latvia

- (93) Ārstniecības līdzekļa reģistrācijas apliecības numurs un paziņošanas datums Eiropas Savienībā / Eiropas Ekonomikas zonā
Number and date of marketing authorization in the European Union / European Economic Area
- (94) Papildu aizsardzības sertifikāta darbības termiņš
Duration of the SPC
- (95) Produkta nosaukums patentā
Name of product in the basic patent
- (96) Patentieteikuma numurs, pieteikuma datums
Number and date of patent application
- (97) Patenta numurs, patenta publikācijas datums
Number and date of the grant of basic patent

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas

A sekcija

- (51) **A24B15/16** (11) **15158 A**
A24B15/26
- (21) P-16-53 (22) 11.07.2016
(41) 20.10.2016
(71) Ivo KAIRIS, Raunas iela 6-8, Rīga, LV-1039, LV
(72) Ivo KAIRIS (LV)
(74) Artis KROMANIS, PĒTERSONA PATENTS, SIA, Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **METODE ELEKTRONISKĀS CIGARETES ŠĶIDRUMA SAGATAVOŠANAI**
METHOD FOR PREPARATION OF ELECTRONIC CIGARETTE LIQUID
- (57) Izgudrojums attiecas uz elektronisko cigarešu jomu. Piedāvāta elektroniskās cigaretes šķidruma (e-šķidruma) pagatavošanas metode, kas ietver sekojošus soļus: a) bāzes šķidruma sagatavošanu; b) aromātu veidojošas vielas sagatavošanu; c) bāzes šķidruma pievienošanu aromātu veidojošajai vielai, iegūstot elektroniskās cigaretes šķidrumu, kur aromātu veidojošā viela ir 15 līdz 20 tilpuma % no elektroniskās cigaretes šķidruma tilpuma; un d) elektroniskās cigaretes šķidruma samaisīšanu.

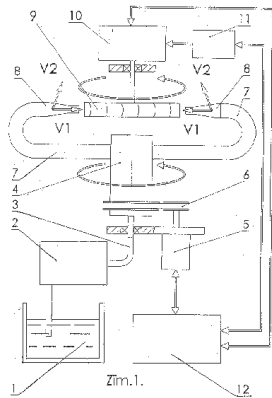
The invention relates to electronic cigarettes. The present invention is a method of electronic cigarette liquid (e-liquid) preparation comprising the steps of: a) providing a base fluid; b) providing a flavor forming substance; c) adding of the base fluid to the flavor forming substance thus obtaining electronic cigarette liquid, wherein the flavor forming substance is 15 to 20 % by volume of the volume of electronic cigarette liquid; and d) mixing of said electronic cigarette liquid.

A24B15/26 15158
A61K31/529 15161

B sekcija

- (51) **B01D1/06** (11) **15159 A**
H05B6/64
C01B31/36
- (21) P-15-31 (22) 26.03.2015
(41) 20.10.2016
(71) LIBAVA SERVISS, SIA, Berģu iela 121, Rīga, LV-1024, LV
(72) Vyacheslav IVANOV (RU),
Aleksandrs POPOVS (LV),
Sergejs RIŽIKOVŠ (LV)

Peltona hidroturbīnu 9 ar elektroģeneratoru 10 un atšķiras ar to, ka ierīcei ir maģistrāles ar sprauslām, kuras uzstādītas paralēli hidroturbīnas rotācijas asij un perpendikulāri hidroturbīnas lāpstiņu plaknei, rotācijas kustības piedziņa, kas kinētiski saistīta ar elektrodzinēju, pie kam hidrosūkņis caur cauruļvadu ir pieslēgts pie piedziņas, hidroturbīna kinētiski ir saistīta ar elektroģeneratoru, pie kura izejas ir pieslēgta regulējama slodze 11, kā arī vadības bloks 12, kura mērīšanas un vadīšanas ieejas pieslēgtas pie elektroģeneratora un pie hidrosūkņa.



F03B3/00 15163

H sekcija

H05B6/64 15159

Izdrojumu patentu publikācijas

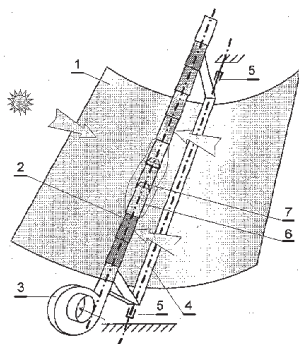
- (51) **F24J2/06** (11) **15142 B**
 (21) P-16-11 (22) 04.03.2016
 (45) 20.10.2016
 (73) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE,
 Lielā iela 2, Jelgava, LV-3001, LV
 (72) Semjons IVANOVŠ (LV),
 Ilze PELĒCE (LV),
 Imants ZIEMELIS (LV),
 Algirdas JASINSKAS (LT),
 Henriks PUTĀNS (LV),
 Liene KANCEVIČA (LV)

(54) **IERĪCE GAISA SILDĪŠANAI AR SAULES ENERĢIJU**

(57) 1. Ierīce gaisa sildīšanai ar saules enerģiju (1. zīm), kura sastāv no paraboliski cilindriskā saules starojuma enerģijas koncentratora (1) un tā fokusā novietotas saules starojuma enerģijas absorbētāja caurules (2), pa kuru ar centrālās ventilatoru (3) tiek pūsts gaiss, kas raksturīga ar to, ka, lai uzlabotu ierīces tehniskos parametrus, saules starojuma enerģijas absorbētāja caurule ir veidota no virknē savienotiem cilindriskiem posmiem (6) ar nošķeltu konusu (7) galā.

2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka, lai panāktu intensīvāku siltuma pārnesi no koncentratora uz enerģijas absorbētāja caurulē (2) plūstošo gaisu, caurules cilindriskie posmi ir veidoti no plāna, piemēram, no 0,15 mm bieza, materiāla loksnes ar labām siltuma vadīšanas spējām, piemēram, no alumīnija loksnes.

3. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka, lai sasniegtu augstāku sasildītā izplūdes gaisa temperatūru, mazinātu temperatūras atkarību no vēja ātruma un aizsargātu no atmosfēras faktoru kaitīgās ietekmes, saules starojuma enerģijas absorbētāja caurule (2) ir ievietota caurspīdīgā apvalkā, piemēram rūdīta solārā stikla caurulē, kuras iekšējais diametrs ir par 1 līdz 2 cm lielāks nekā absorbētāja caurules ārējais diametrs.



1. zīm.

- (51) **C30B15/02** (11) **15148 B**
C30B15/20
B01J19/08
 (21) P-15-08 (22) 26.01.2015
 (45) 20.10.2016
 (73) Anatoly KRAVTSOV, Tērbatas iela 38-4A, Rīga, LV-1011, LV
 (72) Anatoly KRAVTSOV (LV)
 (74) Jevgeņija GAINUTDINOVA, Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013, LV

(54) **METODE UN APARĀTS SILĪCIJA TĪRĪŠANAI VAKUUMĀ**

(57) 1. Silīcija vakuumatīrīšanas paņēmieni, kas ietver silīcija izkausēšanu ar elektronu staru, kausējuma noturēšanu vakuumā piemaisījumu iztvaicēšanai un attīrāmā silīcija virzītu kristalizāciju, kas atšķiras ar to, ka sākotnējo šihnu iekrauj porcijās, attīrītajai porcijai pievienojot jaunu porciju, veic katras kausējuma porcijas attīrīšanu un pēc tam dīgļa (ierosinošā kristāliņa) veidošanai izstiep cilindriskas formas stieni pie uzdotas siltuma padeves no kausējuma uz atdzesējamo iekārtu, kurā tas atrodas.

2. Paņēmieni saskaņā ar 1. punktu, kas atšķiras ar to, ka, izstiepjot cilindriskās formas stieni, uzkausēšanu veic ar ne mazāk kā diviem elektronu staru sildītājiem, izveidojot kustīgus uzkausēšanas plankumus, kuri virzās pa noteikta rādiusa lokiem, kurš ir vismaz divas reizes lielāks par augošā stieņa diametru, bet uzdotu siltuma padevi no kausējuma uz dzesējošo iekārtu sadala tā, ka siltuma padeve uz atdzesējamās iekārtas dibendaļu ir vismaz 2 reizes mazāka nekā uz tās sānu virsmu.

3. Paņēmieni saskaņā ar 1. un/vai 2. punktu, kas atšķiras ar to, ka attīrāmā kausējuma porcijas pēc dziļuma nepārsniedz 90 % no ar elektronu staru izkausētā dziļuma, bet izstiepjāmā stieņa, izņemot pēdējo stieni, masa nepārsniedz 85 % no sākotnēji iekrautās masas.

4. Divkameru aparāts ar atsevišķiem līdzekļiem vakuuma radīšanai kamerās un vārstu starp tām, kurā virs kausēšanas vakuumkameras ir izvietota iekausēšanas-izkraušanas kamera un dīgļa pacelšanas un pagriešanas iekārta, bet kausēšanas kamera ir aprīkota vismaz ar diviem elektronu staru lielgabaliem ar ūdeni dzesējamiem katodiem un ar līdzekļiem stara kustības vadībai, kas izvietoti virs atdzesējamās iekārtas, kurā atrodas silīcijs un siltuma izolators,

kas atšķiras ar to, ka siltuma izolators dibendaļā ir vismaz divas reizes biežāks nekā kausējuma sānos un ir izgatavots no materiāla, kura kušanas temperatūra vismaz par 15 % pārsniedz silīcija kušanas temperatūru.

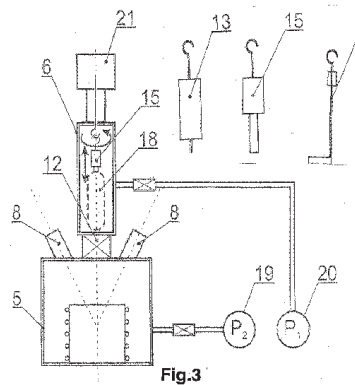


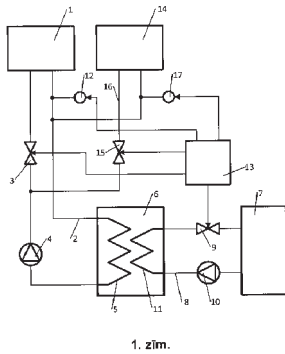
Fig.3

- (51) **F24J2/04** (11) **15149 B**
G05D23/00
 (21) P-15-10 (22) 30.01.2015
 (45) 20.10.2016
 (73) FIZIKĀLĀS ENERĢĒTIKAS INSTITŪTS, Aizkraukles iela 21, Rīga, LV-1006, LV
 (72) Pēteris ŠIPKOVŠ (LV),
 Valērijs BEZRUKOVŠ (LV),
 Jānis ŠIPKOVŠ (LV),
 Vladislavs BEZRUKOVŠ (LV),
 Andrejs SŅEGIRJOVS (LV)

(54) **SAULES SILTUMA KOLEKTORA DARBA VADĪBAS SISTĒMA**

(57) 1. Saules siltuma kolektora darbības vadības sistēma, kurā primārais kontūrs sastāv no saules enerģijas kolektora paneļa, kas ar caurulēm caur vadāmo ventili un sūkni ir savienots ar siltummaini, novietotu boilerā, un sekundārais kontūrs sastāv no patērētāja, kas ar savu cauruli caur vadāmo ventili un sūkni ir savienots ar otro siltummaini, novietotu boilerā, turklāt primārais un sekundārais kontūri ir papildīti ar darba šķidrumu, bet termometri un vadāmie ventīļi ir ievietoti cauruļvados, kas savienoti ar vadības bloku,

kas atšķiras ar to, ka primārais kontūrs ir apgādāts ar papildu saules enerģijas kolektora paneli, savienotu ar siltummaini caur vadāmo ventili un cauruli, kurā ir ievietots papildu termometrs, turklāt papildu termometrs un vadāmais ventīlis ir savienoti ar vadības bloku.



1. zīm.

(51) **B27M3/00** (11) **15154 B**
E04C3/42

(21) P-15-27 (22) 16.03.2015

(45) 20.10.2016

(73) Lauris GALIŅŠ, LV;
Ivars PIEKALNĪTIS, LV;
Jānis JANSONS, LV

(72) Lauris GALIŅŠ (LV),
Ivars PIEKALNĪTIS (LV),
Jānis JANSONS (LV)

(54) **ARKU KONSTRUKTĪVO KOMPOZĪTDETAĻU IZGATAVOŠANAS PAŅĒMIENS, IZMANTOJOT TIPVEIDA PLAKANPARALĒLUS KOKSNES MATERIĀLU ELEMENTUS**

(57) 1. Arku konstruktīvo kompozītdetaļu izgatavošanas paņēmiens, izmantojot tipveida plakanparalēlus koksnes konstruktīvos elementus (A, B un C), pie kam elementi (A) ir paralelograma formai līdzīgi elementi ar atšķirīgiem leņķiem to galos un (B un C) ir trapecveida elementi ar vienādiem, bet pretēji vēršiem leņķiem elementu galos, vai izmantojot to analogus, attiecīgi pagrieztus ap savu garenasi, un tos attiecīgi strukturējot simetriski attiecībā pret veidojamās elementu paketes (detaļas) vidusplakni, kā arī tos sastiprinot savā starpā ar līmi, lai no minētajiem elementiem veidotu vismaz trīs slāņu brusu tipa detaļas X, Y, Z, kuras arkas montāžas procesa tiek nostiprinātas viena otrai galā.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam, lai veidotu minēto brusu tipa detaļu kvalitatīvus sadursavienojumus arkas konstrukcijā, katrā detaļas slānī to veidojošo elementu biezums ir konstants, pie tam minētās detaļas X, Y, Z veidojošo slāņu (A, B un C) biezumi var būt savstarpēji atšķirīgi ar nosacījumu, ka to novietojums ir simetrisks attiecībā pret elementu paketes (detaļas) vidusplakni.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam elementi detaļas paketes veidošanas procesā tiek izvietoti tā, ka to apakšējās un augšējās malas būtībā ir perpendikulāras arkas radiālajai asiņ un vismaz vienā no slāņiem elementi ir pretēji vērsti attiecībā pret blakusslāņa elementu leņķi, t.i., ja vienā detaļas slānī tiek novietots, piem., elements (A), tad blakusslānī tiek novietots elements (A'), kurš ir tāds pats kā elements (A), tikai apgriezts pa savu garenasi, lai, izvietojot elementus vienu otram galā, vienā slānī savienotos elements (A) ar (A) vai (A') ar (A'), turklāt:

- elementu A vai A' galu slīpuma leņķi ir atšķirīgi, un minētā atšķirība ir funkcija no arkas segmenta garuma, ko aizņem viens elements, un elementa (A vai A') galu leņķu summārā starpība ir aprēķināma pēc sekojošas formulas: 360 grādi ir jāizdala ar viena slāņa elementu skaitu arkas lokā; analogi kā gadījumā, kad detaļa tiek veidota no elementiem (A un A'), tiek aprēķināta leņķu summārā starpība arī tajā gadījumā, ja detaļa tiek veidota no trapecveida elementiem (B vai C), pie tam viena tipa trapecveida elementiem galu leņķi ir vienādi, leņķu atšķirība trapecveida elementos ir starp dažādajiem elementiem (B un C).

- elementi detaļas veidošanas procesā tiek izvietoti tā, ka brusas šķēsgriezumā vismaz viena slāņa elementu leņķi, vēlams, ir pretēji vērsti attiecībā pret blakusslāņa elementu leņķiem, t.i., ja vienā detaļas slānī tiek novietots, piem., elements B, tad vismaz vienā no slāņiem ir jābūt novietotam elementam C.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju ar nosacījumu, ka ir izpildītas 2. un 3. pretenzijā definētās prasības, pie kam arkas detaļa

$X = A + A' + A'$ (1. zīm.) tiek veidota no vienādiem elementiem (A) un, izmantojot minēto elementu kombināciju detaļā, tiek veidota arkas struktūra ...-X-X-X-... no viena veida savstarpēji vienādām detaļām.

5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, ar nosacījumu, ka ir izpildītas 2. un 3. pretenzijā definētās prasības, pie kam arkas detaļa $Y = B + C + C$ (2. zīm.) vai detaļa $Z = C + B + B$ (3. zīm.) tiek izveidotas no simetriskiem trapecveida elementiem (B un C) un, izmantojot minētās elementu kombinācijas detaļās Y un Z, tiek izveidota arkas struktūra.

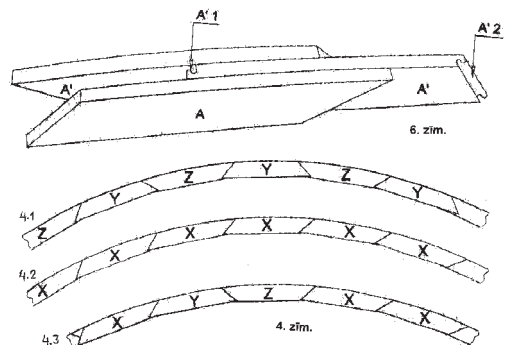
6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam elementu savstarpējais plakanparalēlais novietojums detaļu slāņos, vēlams, ir raksturīgs ar savstarpējo nobīdi attiecībā pret garenasi ar nosacījumu, ka katra elementa paralēlās malas (augšas un apakšas malas) ir perpendikulāras attiecībā pret arkas radiālo asi; tādējādi, izmantojot 1. zīm., 2. zīm. un 3. zīm. attēlotās elementu kombinācijas detaļās X, Y un Z ir iespējams izveidot arkas struktūru, kas ir attēlota 4.3. zīm., vai jebkuru citu no minētās atšķirīgu arkas struktūru, ievērojot nosacījumu, ka detaļas X galos vai vairāku detaļu X virknējuma ...X-X...galos ir izvietotas savstarpēji atšķirīgas detaļas (Z un Y) vai tāda pat detaļa X, kas pagarina minēto detaļu virknējumu.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju un izgudrojuma aprakstu, pie kam minētās detaļas pakete tiek veidota no vairāk par trim elementiem (A, B un C) un minētie elementi paketē tiek izvietoti sekojoši: ja vienā slānī tiek novietots elements (B), tad vismaz vienā no pārējiem slāņiem, vēlams, tiek novietots elements (C), turklāt, izvietojot detaļas vienu otrai galā, elementa galos tiek izvietoti atšķirīgi elementi, lai izveidotu koka dzīvojamo ēku, rūpniecisko ēku (angāru, siltumnīcu, u.c.) un sporta haļļu arķveida slodzi nesošās pārseguma konstrukcijas, kā arī konstrukcijas monolīto dzelzsbetona ēku būvniecībā nepieciešamo veidņu balstīšanai.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam minēto elementu plaknēs, kuras savienojas ar citas detaļas saderīgo elementu, tiek izveidoti savstarpēji saderīgi frēzējumi, kuri nodrošina detaļu savstarpēji noturīgu savienojumu, neizmantojot līmi, pie tam, izmantojot frēzētus elementus, ir jāievēro nosacījums, ka elementi, kuriem ir frēzējumi, tiek izvietoti tā, ka detaļu savienojumu vietās frēzētās plaknes ir savstarpēji paralēlas.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenziju, pie kam minēto elementu savstarpējo savienojumu plaknes, kurās nav frēzējumu, tiek savienotas, izmantojot līmi.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam paņēmiens īstenošanai izmantoto koksnes izejmateriālu kvalitāte, sortiments, stiprības īpašības un apstrādes tehnoloģiskie parametri, tostarp dzeguļu nošļautu leņķu lielumi, slāņu skaits un elementu biezums slāņos, lai veidotu lietišķas koksnes konstrukcijas, atbilst ISO standartiem.



(51) **H03B9/10** (11) **15157 B**

(21) P-15-26 (22) 16.03.2015

(45) 20.10.2016

(73) LIBAVA SERVISS, SIA, Berģu iela 121, Rīga, LV-1024, LV
(72) Vyacheslav IVANOV (RU),
Aleksandrs POPOVS (LV),
Sergejs RIŽIKOVS (LV)

(74) Nina DOLGICERE, Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV

(54) **IERĪCE ULTRA AUGSTAS FREKVENCES ĢENERATORU, KAS IZVEIDOTI UZ MAGNETRONU BĀZES, JAUDU SUMMĒŠANAI**

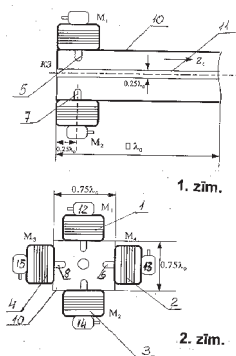
(57) 1. Ultraaugstas frekvences (UAF) ģeneratoru uz magnetronu bāzes jaudu summēšanas ierīce, kas ietver ar magnetroniem saistītus barošanas blokus un īsi no vienas puses saslēgtu viļņvadu, raksturīga ar to, ka ir aprīkota ar koaksiālu viļņvadu, kas ir izveidots kā ārējais vadītājs ar šķēlumu regulāra daudzstūra formā un kā iekšējais vadītājs ar šķēlumu apļa formā, pie tam: minētais koaksiālais viļņvads ir saistīts ar īsi no vienas puses saslēgtu viļņvadu; magnetroni ir uzstādīti uz ārējām skaldnēm pa ārējā vadītāja perimetru vienādos attālumos $n + 0,25\Delta_0$, kur Δ_0 ir attālums no minētā koaksiālā viļņvada īsi saslēgtā gala.

2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ārējā vadītāja skaldnes garums ir $0,75\Delta_0$, bet iekšējā vadītāja šķēluma diametrs ir $0,25\Delta_0$.

3. Ierīce saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka koaksiālais viļņvads ir sajūgts ar ārējā vadītāja viļņvadu attālumā, kas ir minētā attāluma Δ_0 daudzkārtis.

4. Ierīce saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka koaksiālā viļņvada ārējā vadītāja šķēlums ir kvadrāts.

5. Ierīce saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ārējā vadītāja šķēlums ir izveidots regulāra sešstūra formā.



Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

(Publikācijas saskaņā ar 1995. gada 30. marta Patentu likuma 19. panta otro un ceturto daļu)

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **C12N 1/00**^(2006.01) (11) **1377660**
 (21) 02759818.4 (22) 05.04.2002
 (43) 07.01.2004
 (45) 13.01.2016
 (31) 0104737 (32) 06.04.2001 (33) FR
 (86) PCT/FR2002/001200 05.04.2002
 (87) WO 2002/081621 17.10.2002
 (73) MERIAL, 29 avenue Tony Garnier, 69007 Lyon, FR
 (72) LOOSMORE, Sheena, May, CA
 AUDONNET, Jean-Christophe, Francis, FR
 MINKE, Jules Maarten, FR
 (74) Cabinet Plasseraud, 52, rue de la Victoire, 75440 Paris Cedex 09, FR
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **VAKCĪNA PRET NĪLAS DRUDŽA VĪRUSU VACCINE AGAINST THE NILE FEVER VIRUS**
 (57) 1. Imunogēna kompozīcija izmantošanai zirgu aizsardzībā pret Rietumnīlas (WN) vīrusu vai vakcīnā izmantošanai zirgu aizsardzībai pret Rietumnīlas (WN) vīrusu, kas ietver vienu vai vairākus rekombinantus putnu baku vīrusus un ekspresē prM, M un E WN proteīnus, un minētie rekombinantie vīrusi ietver vienu vai vairākus polinukleotīdus, kas kodē vienu vai dažus no prM, M un E proteīniem, un farmaceitiski pieņemamu nesēju vai palīgvielu.
 10. Imunogēna kompozīcija vai vakcīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai lietošanai saskaņā ar 1. pretenziju, atšķirīga ar to, ka tā ietver citu polinukleotīdu, kas kodē proteīnu no cita WN vīrusa celma un/vai cita patogēna aģenta, un/vai citokīnu.
 12. Imunogēna kompozīcija vai vakcīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai lietošanai saskaņā ar 1. pretenziju, atšķirīga ar to, ka tā papildus satur adjuvantu.
 18. Imunogēna kompozīcija vai vakcīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai lietošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir multivalentu imunogēnu kompozīciju vai vakcīnu veidojoša, atšķirīga ar to, ka ietver pret citu patogēnu aģentu vērstu imunogēnas kompozīcijas vai vakcīnas komponentu.
 20. Imunogēna kompozīcija vai vakcīna saskaņā ar 15. pretenziju lietošanai saskaņā ar 1. pretenziju, atšķirīga ar to, ka tā ietver imunogēnas kompozīcijas vai vakcīnas komponentu, kas vērsts pret zirgu rinopneimonijas vīrusu, pret zirgu gripas vīrusu, pret austrumu encefalīta vīrusu, pret rietumu encefalīta vīrusu, pret Venecuēlas encefalīta vīrusu, pret *Clostridium tetani* un to maisījumu.
- (51) **A61K 39/395**^(2006.01) (11) **1488806**
A61P 9/10^(2006.01)
A61P 7/02^(2006.01)
C07K 16/28^(2006.01)
 (21) 04018151.3 (22) 01.06.2000
 (43) 22.12.2004
 (45) 09.12.2015
 (31) 137038 P (32) 01.06.1999 (33) US
 185336 P 29.02.2000 US
 (62) EP00942654.5 / EP1181054
 (73) Biogen MA Inc., 250 Binney Street, Cambridge, MA 02142, US
 (72) De FOUGEROLLES, Antonin R., US
 KOTELIANSKI, Victor E., US
 (74) Vossius & Partner Patentanwälte Rechtsanwälte mbB, Siebertstrasse 3, 81675 München, DE

Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

- (54) **BLOKĒJOŠA MONOKLONĀLA VLA-1 ANTIVIELA UN TĀS IZMANTOŠANA VASKULĀRU TRAUCĒJUMU ĀRSTĒŠANĀ**
A BLOCKING MONOCLONAL ANTIBODY TO VLA-1 AND ITS USE FOR THE TREATMENT OF VASCULAR DISORDERS

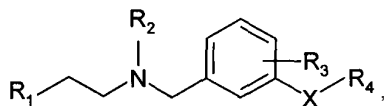
(57) 1. Antiviela vai minētās antivielas fragments spējīgs 1) saistīt VLA-1 α 1-I domēnu, un 2) spējīgs inhibēt K562- α 1-atkarīgu adhēziju pie kolagēna IV, lietošanai vaskulāras slimības iekaisīga traucējuma ārstēšanā.
 3. Antiviela vai antivielas fragments lietošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt anti-*viela* vai antivielas fragments ir monoklonāls, poliklonāls, cilvēka izcelsmes, humanizēts vai himērīks.
 10. Antiviela vai antivielas fragments lietošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt anti-*viela* vai antivielas fragments ir parenterālai ievadīšanai.
 11. Antiviela vai antivielas fragments lietošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, turklāt anti-*viela* vai antivielas fragments ir perorālai, subkutānai, intravenozai, intramuskulārai, intraartikulārai, intrasinoviālai, intrasternālai, intratekālai, intrahepatiskai, ievadīšanai bojājuma vietā, intrakraniālai vai lokālai ievadīšanai.
 13. Antiviela vai minētās antivielas fragments, turklāt anti-*viela* vai antivielas fragments spēj saistīties ar RΔH domēnu, minētajam RΔH domēnam ir žurkas α 1-I domēna aminoskābju sekvence, kurā žurkas sekvences atlikumi G91, R92, Q93 un L96 ir attiecīgi aizvietoti ar atlikumiem V, Q, R un R, un tas spēj saistīties ar cilvēka VLA-1 α 1-I domēnu, bet ne ar žurkas α 1-I domēnu, turklāt cilvēka α 1-I domēna atlikumi 91 - 96 ir aminoskābju sekvence Val-Gln-Arg-Gly-Gly-Arg (SEQ ID NO: 8), lietošanai vaskulāras slimības iekaisīga traucējuma ārstēšanā pacientam.

- (51) **A61K 9/20**^(2006.01) (11) **1859789**
A61K 31/515^(2006.01)
A61K 31/485^(2006.01)
A61K 31/5513^(2006.01)
A61K 31/4725^(2006.01)
A61K 9/16^(2006.01)
 (21) 06024704.6 (22) 05.08.2004
 (43) 28.11.2007
 (45) 17.02.2016
 (31) 10336400 (32) 06.08.2003 (33) DE
 (62) EP04763834.1 / EP1658055
 (73) Grünenthal GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, DE
 (72) BARTHOLOMÄUS, Johannes, Dr., DE
 KUGELMANN, Heinrich, DE
 ARKENAU-MARIC, Elisabeth, Dr., DE
 (74) Kutzenberger, Helga, et al, Kutzenberger Wolff & Partner, Theodor-Heuss-Ring 23, 50668 Köln, DE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **PRET ĻAUNPRĀTĪGU LIETOŠANU NODROŠINĀTA DOZĒŠANAS FORMA**
DOSAGE FORM THAT IS SECURED AGAINST MISUSE

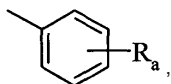
(57) 1. Pret ļaunprātīgu lietošanu nodrošināta bez ekstrūzijas termoformēta dozēšanas forma, raksturīga ar to, ka satur vismaz vienu polietilēna oksīdu (C) ar molekulasmasu vismaz 0,5 miljoni, papildus vienai vai vairākām no opioīdu grupas izvēlētām aktīvajām sastāvdaļām ar ļaunprātīgas lietošanas potenciālu (A), neobligāti kopā ar fizioloģiski pieņemamām palīgvielām (B).
 13. Paņēmiens dozēšanas formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai izgatavošanai, raksturīgs ar to, ka sastāvdaļas (A), (B), (C) un neobligāti klātesošās sastāvdaļas (a) līdz (f) tiek samaisītas bez ekstrūdera palīdzības un, ja nepieciešams, tiek samaisītas atsevišķi polietilēna oksīda (C) pievienošanas laikā, un rezultātā iegūtais maisījums vai maisījumi, neobligāti pēc granulēšanas, tiek presēti dozēšanas formas iegūšanai ar iepriekšēju vai vienlaicīgu pakļaušanu karsēšanai.
 15. Dozēšanas forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, kas iegūstama, izmantojot paņēmienu saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju.

- (51) **A61K 31/4045**^(2006.01) (11) **1859798**
C07D 209/16^(2006.01)
A61P 25/18^(2006.01)
A61P 25/28^(2006.01)
C07D 403/12^(2006.01)
C07D 401/12^(2006.01)
A61K 31/4406^(2006.01)
A61K 31/4409^(2006.01)
A61K 31/506^(2006.01)
A61K 31/4402^(2006.01)
C07C 217/54^(2006.01)
C07C 323/01^(2006.01)
C07C 317/14^(2006.01)
C07D 213/64^(2006.01)
C07D 277/34^(2006.01)
C07D 239/34^(2006.01)
C07D 233/24^(2006.01)
C07D 333/20^(2006.01)
C07D 307/91^(2006.01)
C07D 209/14^(2006.01)

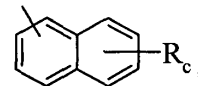
- (21) 07015058.6 (22) 15.03.2002
(43) 28.11.2007
(45) 30.12.2015
(31) 279928 P (32) 29.03.2001 (33) US
329449 P 15.10.2001 US
(62) EP02731094.5 / EP1379239
(73) ELI LILLY AND COMPANY, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US
(72) CHEN, Zhaogen, US
COHEN, Michael Philip, US
FISHER, Matthew Joseph, US
GILLIG, James Ronald, US
MCCOWAN, Jefferson Ray, US
MILLER, Shawn Christopher, US
SCHAUS, John Mehrnt, US
GIETHLEN, Bruno, FR
(74) Hoffmann Eitle, Patent- und Rechtsanwälte PartmbB, Arabellastraße 30, 81925 München, DE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
(54) **N-(2-ARILETIL)BENZILAMĪNI KĀ 5-HT6 RECEPTORU ANTAGONISTI**
N-(2-ARYLETHYL)BENZYLAMINES AS ANTAGONISTS OF THE 5-HT6 RECEPTOR
(57) 1. Savienojums ar struktūru:



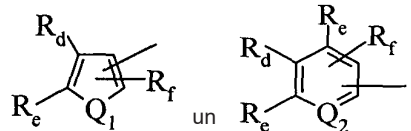
kurā X tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no -O-, -NH-, -S-, -SO₂-, -CH₂-, -CH(F)-, -CH(OH)- un -C(O)-;
R₁ tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no neobligāti aizvietotas fenilgrupas, neobligāti aizvietotas naftilgrupas, neobligāti aizvietota 5- līdz 6-locekļu monocikliska aromātiska heterocikla, kurā ir viens heteroatoms tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no slāpekļa, skābekļa un sēra atoma, un 5- līdz 6-locekļu monocikliskais aromātiskais heterocikls neobligāti ir sapludināts ar benzolu;
kur termins „neobligāti aizvietota fenilgrupa” attiecas uz atlikumu ar formulu:



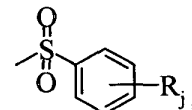
kur R_a ir 1 līdz 3 grupas, kas neatkarīgi tiek izvēlētas no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, hidroksilgrupas, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma, benziloksigrupas, karboksilgrupas, C₁₋₄alkoksikarbonilgrupas, amīdgrupas, N-(C₁₋₄alkil)amīdgrupas, sulfonilamidogrupas, ciāngrupas, trifluormetilgrupas, trifluormetoksigrupas, nitrogrupas un fenilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar C₁₋₄alkilgrupu, C₁₋₄alkoksigrupu, halogēna atomu, ciāngrupu un trifluormetilgrupu;
kur termins „neobligāti aizvietota naftilgrupa” attiecas uz atlikumu ar formulu:



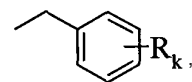
kur R_c ir 1 vai 2 grupas, kas tiek neatkarīgi izvēlētas no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, trifluormetilgrupas un nitrogrupas;
kur termins „neobligāti aizvietots 5- līdz 6-locekļu monocikliskais aromātisks heterocikls, kurā viens heteroatoms tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no slāpekļa, skābekļa un sēra atoma, un 5- līdz 6-locekļu monocikliskais aromātiskais heterocikls neobligāti ir sapludināts ar benzolu” attiecas uz atlikumu ar formulu:



kur Q₁ tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no -O-, -S- un -NR_g-, kur R_g tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma un C₁₋₄alkilgrupas; un Q₂ ir -N-, R_d, katrs R_e, un R_f katrs neatkarīgi tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma, ciāngrupas un trifluormetilgrupas, vai arī R_d un R_e (vai viens no R_e) kopā ar atomiem, pie kuriem tie ir pievienoti, veido benzogredzenu, šis benzogredzens neobligāti tiek aizvietots ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas tiek neatkarīgi izvēlēti no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, hidroksilgrupas, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, trifluormetoksigrupas, 2,2,2-trifluorētoksigrupas, trifluormetilgrupas, halogēna atoma, karboksilgrupas, C₁₋₄alkoksikarbonilgrupas, amīdgrupas, N-(C₁₋₄alkil)amīdgrupas, aminogrupas, (C₁₋₄alkil)aminogrupas, acilaminogrupas, turklāt acilgrupa tiek izvēlēta no rindas, kas sastāv no C₁₋₄alkilgrupas un fenilgrupas; ciāngrupas, nitrogrupas, sulfonilamīdgrupas, fenilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar C₁₋₄alkilgrupu, C₁₋₄alkoksigrupu, halogēna atomu, ciāngrupu un trifluormetilgrupu; fenoksigrupas, benziloksigrupas, -NHS(O)₂R_h, turklāt R_h tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no C₁₋₄alkilgrupas un fenilgrupas; un -S(O)_pR_i, kur p ir 0, 1 vai 2, un R_i tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no C₁₋₄alkilgrupas un fenilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar C₁₋₄alkilgrupu, C₁₋₄alkoksigrupu, halogēna atomu, ciāngrupu un trifluormetilgrupu; un R_f tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, trifluormetilgrupas un halogēna atoma;
R₂ tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma un C₁₋₃alkilgrupas;
R₃ tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, fluora atoma un metilgrupas; un
R₄ tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alilgrupas, C₂₋₄alkilgrupas, fluorētas C₂₋₄alkilgrupas, neobligāti aizvietotas fenilgrupas, neobligāti aizvietotas fenilsulfonilgrupas, neobligāti aizvietotas benzilgrupas un neobligāti aizvietota 5- līdz 6-locekļu monocikliska aromātiska heterocikla, kurā ir viens vai divi heteroatomi, kas tiek izvēlēti no rindas, kas sastāv no slāpekļa, skābekļa un sēra atoma, ar nosacījumu, ka R₄ nav neobligāti aizvietota fenilsulfonilgrupa, ja X ir -SO₂-, -CH₂-, -CH(F)-, -CH(OH)- vai -C(O)-; kur termins „neobligāti aizvietota fenilsulfonilgrupa” attiecas uz atlikumu ar formulu:

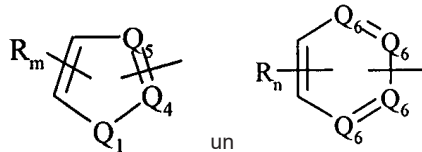


kur R_j ir 1 līdz 3 grupas, kas tiek neatkarīgi izvēlētas no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, trifluormetilgrupas, nitrogrupas un fenilgrupas;
kur termins „neobligāti aizvietota benzilgrupa” attiecas uz atlikumu ar formulu:



kur R_k ir 1 līdz 3 grupas, kas tiek neatkarīgi izvēlētas no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, trifluormetilgrupas un halogēna atoma;

kur termins „neobligāti aizvietots 5- līdz 6-locekļu monociklisks aromātisks heterocikls, kurā ir viens heteroatoms, kas tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no slāpekļa, skābekļa un sēra atoma” attiecas uz atlikumu ar formulu:



kur Q_3 tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no -O-, -S- un -NR_g-, kur R_g tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma un C₁₋₄alkilgrupas; un Q_4 un Q_5 ir -CR_m, kur katrs R_m tiek neatkarīgi izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, halogēna atoma un trifluormetilgrupas, vai viens vai abi Q_4 un Q_5 ir -N=; un kur viens vai divi Q_6 ir -N=, bet citi ir -CR_n; kur katrs R_n tiek neatkarīgi izvēlēts no rindas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas un trifluormetilgrupas;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, izmantošanai metodē demences vai kognitīva traucējuma ārstēšanai, izvēloties no rindas, kas sastāv no ar vecumu saistītās kognitīvo spēju samazināšanās vai vāja kognitīvā traucējuma.

13. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur demences vai kognitīva traucējuma ārstēšana, kur kognitīvais traucējums tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no ar vecumu saistītās kognitīvo spēju samazināšanās un vāja kognitīvā traucējuma, satur vismaz vienu no minētajiem traucējumiem progresēšanas palēnināšanu, pārtraukšanu, apturēšanu, kontrolēšanu vai izbeigšanu, vai vismaz vienu no minētajiem traucējumiem profilaksei.

- (51) **C12N 15/113**^(2006.01) (11) **2206781**
A61K 48/00^(2006.01)
A61K 31/7088^(2006.01)
A61K 31/712^(2006.01)
C07H 21/00^(2006.01)
- (21) 10004274.6 (22) 28.06.2005
(43) 14.07.2010
(45) 02.12.2015
(31) 2004903474 (32) 28.06.2004 (33) AU
(62) EP05754344.9 / EP1766010
(73) THE UNIVERSITY OF WESTERN AUSTRALIA, 35 Stirling Highway, Crawley, Western Australia 6009, AU
(72) WILTON, Stephen Donald, AU
FLETCHER, Sue, AU
MCCLOREY, Graham, AU
(74) Brasnett, Adrian Hugh, et al, Mewburn Ellis LLP, City Tower, 40 Basinghall Street, London EC2V 5DE, GB
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
(54) **ANTISENSA OLIGONUKLEOTĪDI EKSONA MASKĒŠANAS INDUCĒŠANAI UN TO IZMANTOŠANAS PAŅĒMIENI ANTISENSE OLIGONUCLEOTIDES FOR INDUCING EXON SKIPPING AND METHODS OF USE THEREOF**

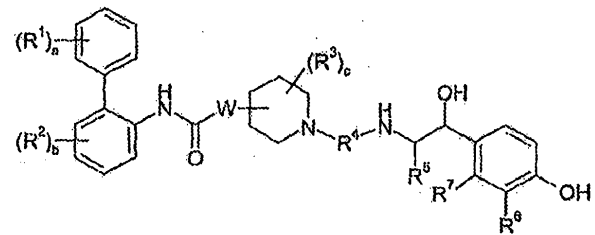
(57) 1. Izolēts antisensa oligonukleotīds, kas saistās pie cilvēka distrofīna pre-mRNS, turklāt minētais oligonukleotīds ir 20 līdz 31 nukleotīdu garš un apzīmē oligonukleotīdu, kas ir specifiski hibridizējams ar distrofīna gēna eksona 53 mērķa reģionu nozīmētu kā komplementāras saistīšanās saiti H53A (+23+47), komplementāras saistīšanās saiti H53A (+39+69) vai abus, turklāt minētais antisensa oligonukleotīds ir morfolīna antisensa oligonukleotīds un turklāt minētais oligonukleotīds inducē eksona 53 maskēšanu.

2. Antisensa oligonukleotīds saskaņā ar 1. pretenziju, kas izvēlēts no sekvencēm SEQ ID NO: 192, 193 un 195, turklāt neobligāti uracila bāzes (U) ir timīna bāzes (T).

7. Kompozīcija, kas satur antisensa oligonukleotīdu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai un sāls šķīdumu ar pievienotu fosfātu buferi.

8. Antisensa oligonukleotīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai vai kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju izmantošanai muskuļu distrofijas ārstēšanas metodē.

- (51) **C07D 401/12**^(2006.01) (11) **2246345**
A61K 31/4709^(2006.01)
C07D 211/46^(2006.01)
C07D 211/48^(2006.01)
C07D 211/58^(2006.01)
C07D 401/14^(2006.01)
C07D 405/14^(2006.01)
C07D 409/14^(2006.01)
C07D 453/02^(2006.01)
A61K 31/445^(2006.01)
A61K 31/452^(2006.01)
C07D 401/06^(2006.01)
C07D 405/12^(2006.01)
C07D 409/06^(2006.01)
C07D 409/12^(2006.01)
C07D 471/08^(2006.01)
G01N 33/94^(2006.01)
- (21) 10173127.1 (22) 13.02.2004
(43) 03.11.2010
(45) 10.02.2016
(31) 447843 P (32) 14.02.2003 (33) US
467035 P 01.05.2003 US
(62) EP04711253.7 / EP1615889
(73) Theravance Respiratory Company, LLC, 951 Gateway Boulevard, South San Francisco, CA 94080, US
MAMMEN, Mathai, US
HUGHES, Adam, US
LEE, Tae Weon, US
HUSFELD, Craig, US
STANGELAND, Eric, US
CHEN, Yan, US
DUNHAM, Sarah, AU
(74) Baker, Suzanne J., et al, GlaxoSmithKline Global Patents (CN925.1), 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
(54) **BIFENILA ATVASINĀJUMI AR BETA2 ADRENERĢISKA RECEPTORA AGONISTA UN MUSKARĪNA RECEPTORA ANTAGONISTA AKTIVITĀTI BIPHENYL DERIVATIVES HAVING BETA2 ADRENERGIC RECEPTOR AGONIST AND MUSCARINIC RECEPTOR ANTAGONIST ACTIVITY**
- (57) 1. Savienojumi ar formulu I:



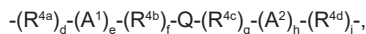
kurā:

- a ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 3;
katra R^1 neatkarīgi ir izvēlēta no C₁₋₄alkilgrupas, C₂₋₄alkenilgrupas, C₂₋₄alkinilgrupas, C₃₋₆cikloalkilgrupas, ciāngrupas, halogēna atoma, -OR^{1a}, -C(O)OR^{1b}, -SR^{1c}, -S(O)R^{1d}, -S(O)₂R^{1e} un -NR^{1f}R^{1g};
katra R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^{1e} , R^{1f} un R^{1g} neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C₁₋₄alkilgrupa vai fenil-C₁₋₄alkilgrupa;
b ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 3;
katra R^2 neatkarīgi ir izvēlēta no C₁₋₄alkilgrupas, C₂₋₄alkenilgrupas, C₂₋₄alkinilgrupas, C₃₋₆cikloalkilgrupas, ciāngrupas, halogēna atoma, -OR^{2a}, -C(O)OR^{2b}, -SR^{2c}, -S(O)R^{2d}, -S(O)₂R^{2e} un -NR^{2f}R^{2g};
katra R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} un R^{2g} neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C₁₋₄alkilgrupa vai fenil-C₁₋₄alkilgrupa;
W ir piesaistīta 3. vai 4. pozīcijā attiecībā pret slāpekļa atomu piperidīna gredzenā, un ir O vai NW^a;
W^a ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₄alkilgrupa;
c ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 4;
katra R^3 neatkarīgi ir izvēlēta no C₁₋₄alkilgrupas, C₂₋₄alkenilgrupas, C₂₋₄alkinilgrupas, C₃₋₆cikloalkilgrupas, ciāngrupas, halogēna atoma,

$-\text{OR}^{3a}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{3b}$, $-\text{SR}^{3c}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{3d}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{3e}$ un $-\text{NR}^{3f}\text{R}^{3g}$; vai divas R^3 grupas ir saistītas, lai veidotu $\text{C}_{1,3}$ alkilēngrupu, $\text{C}_{2,3}$ alkenilēngrupu vai oksirān-2,3-diilgrupu;

katra R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} , R^{3f} un R^{3g} neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupa;

R^4 ir divvērtīga grupa ar formulu:



kurā

d, e, f, g, h un i katra neatkarīgi ir izvēlēta no 0 un 1;

R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} un R^{4d} katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{1,10}$ alkilēngrupas, $\text{C}_{2,10}$ alkenilēngrupas un $\text{C}_{2,10}$ alkinilēngrupas, kurā katra alkilēngrupa, alkenilēngrupa vai alkinilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, fluorgrupas, hidroksilgrupas, fenilgrupas un fenil- $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas;

A^1 un A^2 katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{3,7}$ cikloalkilēngrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilēngrupas, $-\text{O}-\text{C}_{6,10}$ arilēngrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilēn-O-, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilēngrupas, $-\text{O}-\text{C}_{2,9}$ heteroarilēngrupas, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilēn-O- un $\text{C}_{3,6}$ heterociklēngrupas, kur katra cikloalkilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, un katra arilēngrupa, heteroarilēngrupa vai heterociklēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $\text{C}_{1,4}$ alkoksigrupas, $-\text{S}-\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $-\text{C}(\text{O})\text{OC}_{1,4}$ alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas;

Q ir izvēlēta no saitēs $-\text{O}-$, $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$, $-\text{OC}(\text{O})-$, $-\text{S}-$, $-\text{S}(\text{O})-$, $-\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{N}(\text{Q}^a)\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Q}^b)-$, $-\text{N}(\text{Q}^c)\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{Q}^d)-$, $-\text{N}(\text{Q}^e)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Q}^f)-$, $-\text{N}(\text{Q}^g)\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{Q}^h)-$, $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{Q}^i)-$, $-\text{N}(\text{Q}^j)\text{C}(\text{O})\text{O}-$ un $-\text{N}(\text{Q}^k)$;

Q^a , Q^b , Q^c , Q^d , Q^e , Q^f , Q^g , Q^h , Q^i , Q^j un Q^k katra neatkarīgi ir izvēlēta no ūdeņraža atoma, $\text{C}_{1,6}$ alkilgrupas, A^3 un $\text{C}_{1,4}$ alkilēn- A^4 , kur alkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no fluora atoma, hidroksilgrupas un $\text{C}_{1,4}$ alkoksigrupas; vai kopā ar slāpekļa atomu un R^{4b} vai R^{4c} grupu, pie kura tā ir piesaistīta, veido 4- līdz 6-locekļu azacikloalkilēngrupu; A^3 un A^4 katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{3,6}$ cikloalkilgrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilgrupas, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilgrupas un $\text{C}_{3,6}$ heterociklilgrupas, kur katra cikloalkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, un katra arilgrupa, heteroarilgrupa vai heterociklilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas un $\text{C}_{1,4}$ alkoksigrupas;

ar nosacījumu, ka blakus esošo atomu skaits īsākajā ķēdē starp diviem slāpekļa atomiem, pie kuriem R^4 ir piesaistīta, ir intervālā no 4 līdz 16;

R^5 ir ūdeņraža atoms vai $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupa;

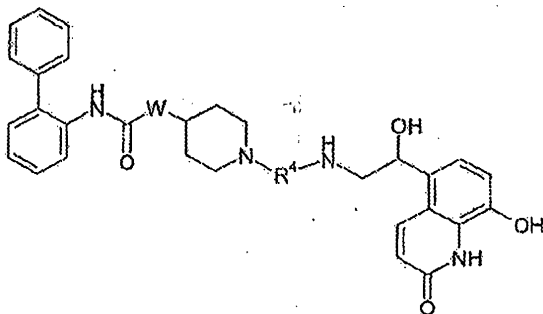
R^6 ir $-\text{NR}^{6a}\text{CR}^{6b}(\text{O})$ vai $-\text{CR}^{6c}\text{R}^{6d}\text{OR}^{6e}$ un R^7 ir ūdeņraža atoms; vai R^6 un R^7 kopā veido $-\text{NR}^{7a}\text{C}(\text{O})-\text{CR}^{7b}=\text{CR}^{7c}-$, $-\text{CR}^{7d}=\text{CR}^{7e}-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^{7f}-$, $-\text{NR}^{7g}\text{C}(\text{O})-\text{CR}^{7h}\text{R}^{7i}-\text{CR}^{7j}\text{R}^{7k}-$ vai $-\text{CR}^{7l}\text{R}^{7m}-\text{CR}^{7n}\text{R}^{7o}-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^{7p}-$;

katra R^{6a} , R^{6b} , R^{6c} , R^{6d} un R^{6e} neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupa; un

katra R^{7a} , R^{7b} , R^{7c} , R^{7d} , R^{7e} , R^{7f} , R^{7g} , R^{7h} , R^{7i} , R^{7j} , R^{7k} , R^{7l} , R^{7m} , R^{7n} , R^{7o} un R^{7p} neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupa;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts, vai tā stereoisomērs.

14. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu II:



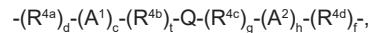
II

kurā

W ir O vai NW^a ;

W^a ir ūdeņraža atoms vai $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupa;

R^4 ir divvērtīga grupa ar formulu:



kurā

d, e, f, g, h un i katra neatkarīgi ir izvēlēta no 0 un 1;

R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} un R^{4d} katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{1,10}$ alkilēngrupas, $\text{C}_{2,10}$ alkenilēngrupas un $\text{C}_{2,10}$ alkinilēngrupas, kurā katra alkilēngrupa, alkenilēngrupa vai alkinilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, fluora atoma, hidroksilgrupas, fenilgrupas un fenil- $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas; A^1 un A^2 katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{3,7}$ cikloalkilēngrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilēngrupas, $-\text{O}-\text{C}_{6,10}$ arilēngrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilēn-O-, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilēngrupas, $-\text{O}-\text{C}_{2,9}$ heteroarilēngrupas, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilēn-O- un $\text{C}_{3,6}$ heterociklēngrupas, kurā katra cikloalkilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, un katra arilēngrupa, heteroarilēngrupa vai heterociklēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $\text{C}_{1,4}$ alkoksigrupas, $-\text{S}-\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, $-\text{C}(\text{O})\text{OC}_{1,4}$ alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas;

Q ir izvēlēta no saitēs $-\text{O}-$, $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$, $-\text{OC}(\text{O})-$, $-\text{S}-$, $-\text{S}(\text{O})-$, $-\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{N}(\text{Q}^a)\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Q}^b)-$, $-\text{N}(\text{Q}^c)\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{Q}^d)-$, $-\text{N}(\text{Q}^e)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Q}^f)-$, $-\text{N}(\text{Q}^g)\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{Q}^h)-$, $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{Q}^i)-$, $-\text{N}(\text{Q}^j)\text{C}(\text{O})\text{O}-$ un $-\text{N}(\text{Q}^k)$;

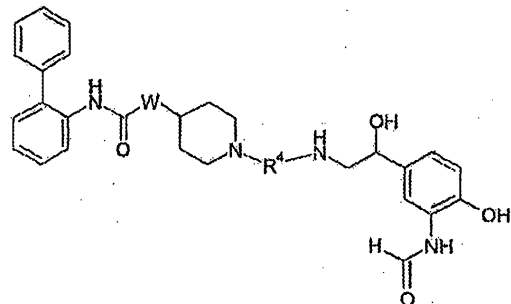
Q^a , Q^b , Q^c , Q^d , Q^e , Q^f , Q^g , Q^h , Q^i , Q^j un Q^k katra neatkarīgi ir izvēlēta no ūdeņraža atoma, $\text{C}_{1,6}$ alkilgrupas, A^3 un $\text{C}_{1,4}$ alkilēn- A^4 , kurā alkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no fluora atoma, hidroksilgrupas un $\text{C}_{1,4}$ alkoksigrupas; vai kopā ar slāpekļa atomu un R^{4b} vai R^{4c} grupu, pie kuras tās ir piesaistītas, veido 4- līdz 6-locekļu azacikloalkilēngrupu;

A^3 un A^4 katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{3,6}$ cikloalkilgrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilgrupas, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilgrupas un $\text{C}_{3,6}$ heterociklilgrupas, kurā katra cikloalkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, un katra arilgrupa, heteroarilgrupa vai heterociklilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas un $\text{C}_{1,4}$ alkoksigrupas;

ar nosacījumu, ka blakus esošo atomu skaits īsākajā ķēdē starp diviem slāpekļa atomiem, pie kuriem R^4 ir piesaistīta, ir intervālā no 4 līdz 14;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts, vai tā stereoisomērs.

15. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu III:



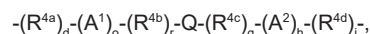
III

kurā

W ir O vai NW^a ;

W^a ir ūdeņraža atoms vai $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupa;

R^4 ir divvērtīga grupa ar formulu:



kurā

d, e, f, g, h un i katra neatkarīgi ir izvēlēta no 0 un 1;

R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} un R^{4d} katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{1,10}$ alkilēngrupas, $\text{C}_{2,10}$ alkenilēngrupas un $\text{C}_{2,10}$ alkinilēngrupas, kurā katra alkilēngrupa, alkenilēngrupa vai alkinilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas, fluora atoma, hidroksilgrupas, fenilgrupas un fenil- $\text{C}_{1,4}$ alkilgrupas; A^1 un A^2 katra neatkarīgi ir izvēlēta no $\text{C}_{3,7}$ cikloalkilēngrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilēngrupas, $-\text{O}-\text{C}_{6,10}$ arilēngrupas, $\text{C}_{6,10}$ arilēn-O-, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilēngrupas, $-\text{O}-\text{C}_{2,9}$ heteroarilēngrupas, $\text{C}_{2,9}$ heteroarilēn-O- un

C_{3,6} heterociklēngrupas, kurā katra cikloalkilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no C_{1,4} alkilgrupas un katra arilēngrupa, heteroarilēngrupa vai heterociklēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas, C_{1,4} alkoksigrupas, -S-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)₂-C_{1,4} alkilgrupas, -C(O)OC_{1,4} alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas;

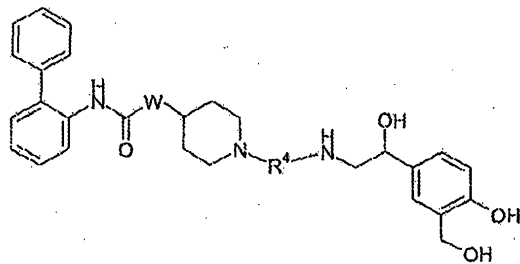
Q ir izvēlēta no saitēs -O-, -C(O)O-, -OC(O)-, -S-, -S(O)-, -S(O)₂-, -N(Q^a)C(O)-, -C(O)N(Q^b)-, -N(Q^c)S(O)₂-, -S(O)₂N(Q^d)-, -N(Q^e)C(O)N(Q^f)-, -N(Q^g)S(O)₂N(Q^h)-, -OC(O)N(Qⁱ)-, un -N(Q^k); Q^a, Q^b, Q^c, Q^d, Q^e, Q^f, Q^g, Q^h, Qⁱ, Q^j un Q^k katra neatkarīgi ir izvēlēta no ūdeņraža atoma, C_{1,6} alkilgrupas, A³ un C_{1,4} alkilēn-A⁴, kurā alkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no fluora atoma, hidroksilgrupas un C_{1,4} alkoksigrupas; vai kopā ar slāpekļa atomu un R^{4b} vai R^{4c} grupu, pie kuras tās ir piesaistītas, veido 4- līdz 6-locekļu aza-cikloalkilēngrupu;

A³ un A⁴ katra neatkarīgi ir izvēlēta no C_{3,6} cikloalkilgrupas, C_{6,10} arilgrupas, C_{2,9} heteroarilgrupas un C_{3,5} heterociklilgrupas, kurā katra cikloalkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no C_{1,4} alkilgrupas, un katra arilgrupa, heteroarilgrupa vai heterociklilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas un C_{1,4} alkoksigrupas;

ar nosacījumu, ka blakus esošo atomu skaits tsākajā ķēdē starp diviem slāpekļa atomiem, pie kuriem R⁴ ir piesaistīta, ir intervālā no 4 līdz 14;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts, vai tā stereoisomērs.

16. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu IV:



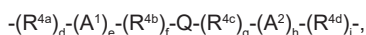
IV

kurā

W ir O vai NW^a;

W^a ir ūdeņraža atoms vai C_{1,4} alkilgrupa;

R⁴ ir divvērtīga grupa ar formulu:



kurā d, e, f, g, h un i katra neatkarīgi ir izvēlēta no 0 un 1;

R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} un R^{4d} katra neatkarīgi ir izvēlēta no C_{1,10} alkilēngrupas, C_{2,10} alkenilēngrupas un C_{2,10} alkililēngrupas, kurā katra alkilēngrupa, alkenilēngrupa vai alkenililēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no C_{1,4} alkilgrupas, fluora atoma, hidroksilgrupas, fenilgrupas un fenil-C_{1,4} alkilgrupas; A¹ un A² katra neatkarīgi ir izvēlēta no C_{3,7} cikloalkilēngrupas, C_{6,10} arilēngrupas, -O-C_{6,10} arilēngrupas, C_{6,10} arilēn-O-, C_{2,9} heteroarilēngrupas, -O-C_{2,9} heteroarilēngrupas, C_{2,9} heteroarilēn-O- un C_{3,6} heterociklēngrupas, kurā katra cikloalkilēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no C_{1,4} alkilgrupas, un katra arilēngrupa, heteroarilēngrupa vai heterociklēngrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas, C_{1,4} alkoksigrupas, -S-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)₂-C_{1,4} alkilgrupas, -C(O)OC_{1,4} alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas;

Q ir izvēlēta no saitēs -O-, -C(O)O-, -OC(O)-, -S-, -S(O)-, -S(O)₂-, -N(Q^a)C(O)-, -C(O)N(Q^b)-, -N(Q^c)S(O)₂-, -S(O)₂N(Q^d)-, -N(Q^e)C(O)N(Q^f)-, -N(Q^g)S(O)₂N(Q^h)-, -OC(O)N(Qⁱ)-, -N(Q^j)C(O)O- un -N(Q^k);

Q^a, Q^b, Q^c, Q^d, Q^e, Q^f, Q^g, Q^h, Qⁱ, Q^j un Q^k katra neatkarīgi ir izvēlēta no ūdeņraža atoma, C_{1,6} alkilgrupas, A³ un C_{1,4} alkilēn-A⁴,

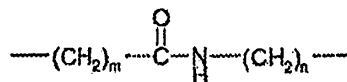
kurā alkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no fluora atoma, hidroksilgrupas un C_{1,4} alkoksigrupas; vai kopā ar slāpekļa atomu un grupu R^{4b} vai R^{4c}, pie kuras tās ir piesaistītas, veido 4- līdz 6-locekļu aza-cikloalkilēngrupu;

A³ un A⁴ katra neatkarīgi ir izvēlēta no C_{3,6} cikloalkilgrupas, C_{6,10} arilgrupas, C_{2,9} heteroarilgrupas un C_{3,6} heterociklilgrupas, kurā katra cikloalkilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no C_{1,4} alkilgrupas, un katra arilgrupa, heteroarilgrupa vai heterociklilgrupa ir neaizvietota vai aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas un C_{1,4} alkoksigrupas;

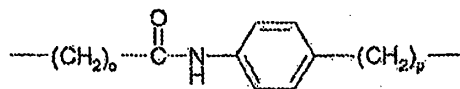
ar nosacījumu, ka blakus esošo atomu skaits tsākajā ķēdē starp diviem slāpekļa atomiem, pie kuriem R⁴ ir piesaistīta, ir intervālā no 4 līdz 14;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts, vai tā stereoisomērs.

25. Savienojums saskaņā ar 24. pretenziju, kurā R⁴ ir izvēlēta no:

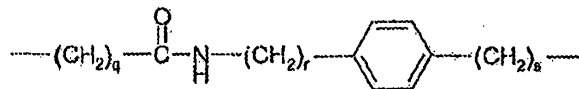


kurā m ir vesels skaitlis no 2 līdz 10; un n ir vesels skaitlis no 2 līdz 10; ar nosacījumu, ka m+n ir vesels skaitlis no 4 līdz 12;

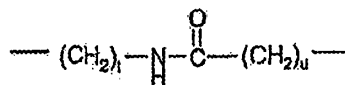


kurā o ir vesels skaitlis no 2 līdz 7; un p ir vesels skaitlis no 1 līdz 6; ar nosacījumu, ka o+p ir vesels skaitlis no 3 līdz 8;

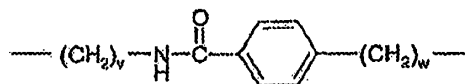
un kurā fen-1,4-ilēngrupa neobligāti ir aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas, C_{1,4} alkoksigrupas, -S-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)₂-C_{1,4} alkilgrupas, -C(O)OC_{1,4} alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas;



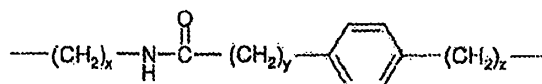
kurā q ir vesels skaitlis no 2 līdz 6; r ir vesels skaitlis no 1 līdz 5; un s ir vesels skaitlis no 1 līdz 5; ar nosacījumu, ka q+r+s ir vesels skaitlis no 4 līdz 8; un kurā fen-1,4-ilēngrupa neobligāti ir aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas, C_{1,4} alkoksigrupas, -S-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)₂-C_{1,4} alkilgrupas, -C(O)OC_{1,4} alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas;



kurā t ir vesels skaitlis no 2 līdz 10; un u ir vesels skaitlis no 2 līdz 10; ar nosacījumu, ka t+u ir vesels skaitlis no 4 līdz 12;



kurā v ir vesels skaitlis no 2 līdz 7; un w ir vesels skaitlis no 1 līdz 6; ar nosacījumu, ka v+w ir vesels skaitlis no 3 līdz 8; un kurā fen-1,4-ilēngrupa neobligāti ir aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4} alkilgrupas, C_{1,4} alkoksigrupas, -S-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)-C_{1,4} alkilgrupas, -S(O)₂-C_{1,4} alkilgrupas, -C(O)OC_{1,4} alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluorometilgrupas un trifluorometoksigrupas; un



kurā x ir vesels skaitlis no 2 līdz 6; y ir vesels skaitlis no 1 līdz 5; un z ir vesels skaitlis no 1 līdz 5; ar nosacījumu, ka $x+y+z$ ir vesels skaitlis no 4 līdz 8; un kurā fen-1,4-ilēngrupa neobligāti ir aizvietota ar no 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no halogēna atoma, C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-4} alkoksigrupas, $-S-C_{1-4}$ alkilgrupas, $-S(O)-C_{1-4}$ alkilgrupas, $-S(O)_2-C_{1-4}$ alkilgrupas, $-C(O)OC_{1-4}$ alkilgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, trifluormetilgrupas un trifluormetoksigrupas.

27. Farmaceitiska kompozīcija, kas satur farmaceitiski pieņemamu nesēju un savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 26. pretenzijai terapeitiski efektīvu daudzumu.

28. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 27. pretenziju, kura papildus satur steroīdu pretiekaisuma līdzekļa terapeitiski efektīvu daudzumu.

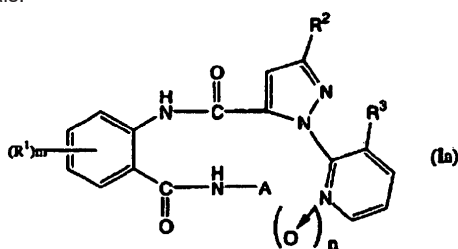
29. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 27. pretenziju, kura papildus satur PDE4 inhibitora terapeitiski efektīvu daudzumu.

30. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 26. pretenzijai izmantošanai terapijā vai par medikamentu.

31. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 26. pretenzijai izmantošanai plaušu slimību ārstēšanā.

32. Savienojums saskaņā ar 31. pretenziju, kur plaušu slimība ir hroniska obstruktīva plaušu slimība vai astma.

- (51) **C07D 401/04**^(2006.01) (11) **2256112**
A01N 43/56^(2006.01)
A61K 31/4439^(2006.01)
A61P 33/02^(2006.01)
A61P 33/06^(2006.01)
A61P 33/10^(2006.01)
A61P 33/12^(2006.01)
A61P 33/14^(2006.01)
- (21) 10009628.8 (22) 16.02.2005
(43) 01.12.2010
(45) 13.01.2016
- (31) 2004041295 (32) 18.02.2004 (33) JP
2004133722 28.04.2004 JP
2004261507 08.09.2004 JP
2004295778 08.10.2004 JP
- (62) EP05710251.9 / EP1717237
(73) Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd., 3-15 Edobori 1-chome Nishi-ku, Osaka-shi, Osaka 550-0002, JP
(72) KOYANAGI, Tori, JP
MORITA, Masayuki, JP
NAKAMOTO, Kenishi, JP
HISAMATSU, Akihiro, JP
(74) Hartz, Nikolai, Wächtershäuser & Hartz Patentanwalts-partnerschaft mbB, Weinstrasse 8, 80333 München, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
(54) **ANTRANILAMĪDI, PAŅĒMIENS TO IEGŪŠANAI UN TOS SATUROŠI KAITĒKĻU APKAROŠANAS LĪDZEKĻI ANTHRANILAMIDES, PROCESS FOR THE PRODUCTION THEREOF AND PEST CONTROLLERS CONTAINING THE SAME**
(57) 1. Antranilamīda savienojums, kas attēlots ar formulu (Ia), vai tā sāls:



turklāt R^1 ir halogēna atoms vai alkilgrupa; katrs no R^2 un R^3 ir halogēna atoms vai CF_3 grupa; A ir alkilgrupa, kas aizvietota ar Y; Y ir ciklopropilgrupa, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu vai alkilgrupu; m ir 1 vai 2; n ir 0 vai 1 ar nosacījumu, ka, ja R^1 ir fluora atoms, hlora atoms, broms vai metilgrupa, kas aizvietota benzola gredzena 2. pozīcijā, un cits R^1 ir halogēna atoms, kas

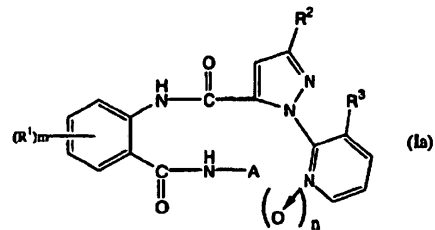
aizvietots benzola gredzena 4. pozīcijā, halogēna atoms 4. pozīcijā ir fluora vai hlora atoms.

2. N-[6-[[ciklopropilmetil]amino]karbonil]-2-metilfenil]-1-(3-hlor-2-piridil)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-5-karboksamīds.

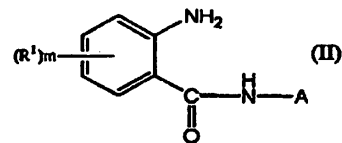
3. N-[4-hlor-2-metil-6-[[α -metil-(ciklopropilmetil)amino]karbonil]fenil]-3-(trifluormetil)-1-(3-hlor-2-piridil)-1H-pirazol-5-karboksamīds.

4. N-[4-hlor-2-metil-6-[[α -metil-(ciklopropilmetil)amino]karbonil]fenil]-3-brom-1-(3-hlor-2-piridil)-1H-pirazol-5-karboksamīds.

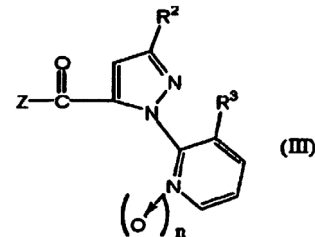
5. Paņēmiens antranilamīda savienojuma, kas attēlots ar formulu (I), vai tā sāls, kā papildus definēts 1. pretenzijā:



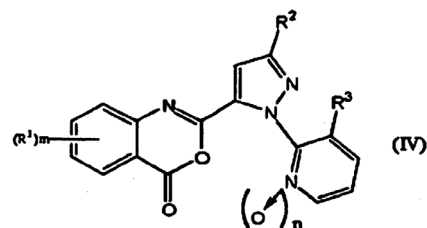
iegūšanai, kas ietver (1) savienojuma, kas attēlots ar formulu (II):



kurā R^1 , A un m ir tādi, kā definēts iepriekš, reakciju ar savienojumu, kas attēlots ar formulu (III):



kurā R^2 , R^3 un n ir tādi, kā definēts iepriekš, un Z ir hlora atoms, -OH grupa vai C_{1-4} alkoksigrupa, vai (2) savienojuma, kas attēlots ar formulu (IV):



kurā R^1 , R^2 , R^3 , m un n ir tādi, kā definēts iepriekš, reakciju ar savienojumu, kas attēlots ar formulu (V): $A-NH_2$, kurā A ir tāds, kā definēts iepriekš.

6. Pesticīds, kas kā aktīvo sastāvdaļu satur antranilamīda savienojumu vai tā sāli saskaņā ar 1. pretenziju.

7. Pesticīds saskaņā ar 6. pretenziju:
(i) izmantošanai par pesticīdu lauksaimniecībā un dārzkopībā,
(ii) izmantošanai par insekticīdu, miticīdu vai nematocīdu,
(iii) izmantošanai par pesticīdu dzīvnieku parazītu apkarošanā vai
(iv) izmantošanai par pesticīdu dzīvnieku ārējo parazītu apkarošanā.

8. Profilaktisks vai terapeitisks līdzeklis izraisītai dzīvnieku slimībai, kas kā aktīvo sastāvdaļu satur antranilamīda savienojumu vai tā sāli saskaņā ar 1. pretenziju.

9. Paņēmiens kaitēkļa apkarošanai, kas ietver antranilamīda savienojuma vai tā sāls saskaņā ar 1. pretenziju iedarbīga daudzuma lietošanu, izņemot cilvēka vai dzīvnieka ķermeņa ārstēšanai ar terapeitisku paņēmienu.

10. Pesticīds izmantošanai lauksaimniecībā vai dārzkopībā, kas satur antranilamīda savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju vai tā sāli un citas lauksaimniecības ķīmikālijas.

- (51) **A61K 39/15**^(2006.01) (11) **2272532**
C12N 7/00^(2006.01)
- (21) 10176849.7 (22) 31.08.2004
(43) 12.01.2011
(45) 10.02.2016
- (31) 499430 P (32) 02.09.2003 (33) US
0414787 01.07.2004 GB
- (62) EP04764688.0 / EP1660123
(73) GlaxoSmithKline Biologicals S.A., Rue de l'Institut, 89, 1330 Rixensart, BE
- (72) COLAU, Brigitte Desiree Alberte, BE
De VOS, Beatrice Arsene Virginie, BE
- (74) Chiappinelli, Susan Ann, et al, GlaxoSmithKline Global Patents (CN925.1), 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **ROTAVĪRUSA VAKCĪNA**
ROTAVIRUS VACCINE
- (57) 1. Novājināta cilvēka rotavīrusa celma G1 serotipa izmantošana kompozīcijas imūnreakcijas izraisīšanai pret rotavīrusa infekciju pagatavošanā, kompozīcija sastāv no G1 un vismaz diviem ne-G1 rotavīrusa serotipiem, kas izvēlēti no rindas, kas sastāv no G2, G3, G4 un G9 serotipa, turklāt novājinātais rotavīrusa celms ir viens rotavīrusa variants vai faktiski viens rotavīrusa variants ar VP4 gēnu, kas nukleotīdu sekvencē satur vismaz vienu no adenīna (A) 788. un 802. pozīcijā vai timīna (T) 501. pozīcijā no starta kodona; un/vai kuram ir VP7 gēns, kas nukleotīdu sekvencē satur vismaz timīnu (T) 605. pozīcijā, adenīnu (A) 897. pozīcijā vai guanīnu (G) 897. pozīcijā no starta kodona.
6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt kompozīcija vakcinēto indivīdu populācijā ir par vismaz 50 % protektīva pret diareju un/vai gastroenterītu, un/vai smagu gastroenterītu, ko izraisījis vismaz divu ne-G1 serotipu rotavīrusa infekcija.
12. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, turklāt kompozīcija ir paredzēta ievadīšanai 2 devu režīmā.
13. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, turklāt novājinātais cilvēka rotavīrusa celms ir pagatavots kopā ar pieņemamu farmaceitisku nesēju vai ar antacīda buferi, vai abiem.

- (51) **A61K 9/48**^(2006.01) (11) **2279729**
(21) 10075739.2 (22) 14.07.2004
(43) 02.02.2011
(45) 17.08.2016
- (31) 487968 P (32) 17.07.2003 (33) US
(62) EP04778128.1 / EP1653931
(73) Banner Life Sciences, LLC, 4125 Premier Drive, High Point, North Carolina 27265, US
- (72) HASSAN, EmadEldin M., US
CHIDAMBARAM, Nachiappan, US
FATMI, Aqeel A., US
- (74) Potter Clarkson LLP, The Belgrave Centre, Talbot Street, Nottingham NG1 5GG, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **KONTROLĒTAS IZDALĪŠANĀS FARMACEITISKI PREPARĀTI**
CONTROLLED RELEASE PREPARATIONS
- (57) 1. Kontrolētas izdalīšanās mīkstās kapsulas, kurām ir apvalks un matrice, kura satur aktīvo sastāvdaļu vai medikamentu, turklāt matrice sastāv no divām fāzēm emulsijas veidā, pie kam emulsija satur hidrofilu iekšējo fāzi, kura būtībā sastāv no poli-etilēnglikola, kura molekulmasa ir robežās aptuveni no 200 līdz 8000, metilcelulozes un aktīvās sastāvdaļas vai medikamenta, un lipīdu vai lipofilu ārējo fāzi, turklāt iekšējās fāzes masas attiecība pret ārējās fāzes masu ir robežās no aptuveni 0,5:10 līdz 1:1.
12. Paņēmiens kontrolētas izdalīšanās mīksto kapsulu saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas satur:
- a) aktīvās sastāvdaļas vai medikamenta disperģēšanu iekšējā fāzē, lai veidotu dzidru šķīdumu vai suspensiju, izmantojot propellera maisītāju vai homogenizatoru-maisītāju;
- b) iekšējās fāzes pievienošanu izkausētai ārējai fāzei, kas satur vismaz vienu virsmaktīvu vielu robežās no aptuveni 0,1 līdz

- 5 masas %, lai veidotu galīgo maisījumu;
- c) emulsijas veidošanu no iegūtā maisījuma, maisījumu pakļaujot mehāniskam spēkam, ko rada propellermaisītājs, homogenizators vai mikrošķidrītājs;
- d) emulsijas dzesēšanu no aptuveni 20 °C līdz 35 °C un
- e) emulsijas iekapsulēšanu, izmantojot iekapsulēšanas ierīces rotācijas presformu, lai veidotu kontrolētās izdalīšanās kapsulas.

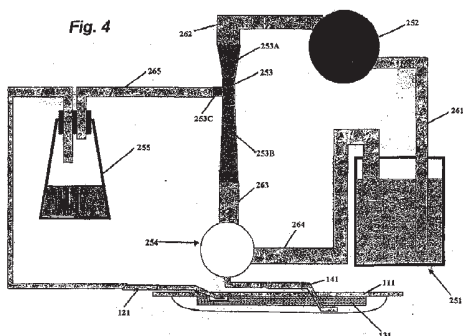
- (51) **C12P 21/06**^(2006.01) (11) **2405015**
C12N 9/00^(2006.01)
C12N 9/24^(2006.01)
C12N 1/20^(2006.01)
C12N 15/00^(2006.01)
C07H 21/04^(2006.01)
C12N 9/26^(2006.01)
C07K 14/435^(2006.01)
- (21) 10183410.9 (22) 05.03.2004
(43) 11.01.2012
(45) 06.01.2016
- (31) 452360 P (32) 05.03.2003 (33) US
(62) EP04717941.1 / EP1603541
EP09012669.9 / EP2177620
- (73) Halozyme, Inc., 11388 Sorrento Valley Road, San Diego, CA 92121, US
- (72) BOOKBINDER, Louis, US
KUNDU, Anirban, US
FROST, Gregory, US
- (74) Hoffmann Eitle, Patent- und Rechtsanwälte PartmbB, Arabellastraße 30, 81925 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **ŠĶĪSTOŠS HIALURONIDĀZES GLIKOPROTEĪNS (sHASEGP), METODE TĀ IEGŪŠANAI, LIETOŠANA UN TO SATUROŠAS FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS SOLUBLE HYALURONIDASE GLYCOPROTEIN (sHASEGP), PROCESS FOR PREPARING THE SAME, USES AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING THEREOF**
- (57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur šķīstošu, neitrālu, aktīvu cilvēka hialuronidāzes polipeptīdu (sHASEGP) un pretvēža līdzekli, lietošanai audzēja ārstēšanā, turklāt: pretvēža līdzeklis ir anti-veģa vai gēnu terapijas vektors un hialuronidāzes polipeptīds sastāv no aminoskābju sekvences, kas ir ar vismaz 98 % aminoskābju sekvences identitāti ar aminoskābju sekvenci, kas ir parādīta kā SEQ ID NO: 4 aminoskābes 1–448, kas atbilst SEQ ID NO: 1 aminoskābēm 36–483, turklāt: polipeptīds satur vismaz vienu cukura grupu, kas ir kovalenti saistīta pie polipeptīda asparagīna (N) atlikuma, un polipeptīds ir katalītiski aktīvs.
4. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt hialuronidāzes polipeptīds ir kodēts ar nukleīnskābes molekulu, kura satur SEQ ID NO: 6 nukleotīdu 106–1446 sekvenci vai tās daļu, kas kodē katalītiski aktīvo polipeptīdu.
5. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt hialuronidāzes polipeptīds ir ar C-gala atlikumu, izvēlētu no SEQ ID NO: 1 477., 478., 479., 480., 481., 482. un 483. aminoskābju atlikuma.
6. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt hialuronidāzes polipeptīds ir kodēts ar nukleīnskābes molekulu, kura kodē SEQ ID NO: 1 parādītos aminoskābju atlikumus 1–477, 1–478, 1–479, 1–480, 1–481, 1–482 vai 1–483.
7. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt hialuronidāzes polipeptīds ir modificēts ar polimēru.
9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt hialuronidāzes polipeptīds ir sialēts.
10. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt pretvēža līdzeklis un hialuronidāzes polipeptīds ir iestrādāti zāļu formā ievadīšanai audzējā vai intravenozi.
11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, turklāt audzējs ir krūts vēzis.

Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas

(Publikācijas saskaņā ar 2007. gada 15. februāra Patentu likuma 71. panta piekto daļu)

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **A61M 1/00**^(2006.01) (11) **1807145**
 (21) 05825353.5 (22) 04.11.2005
 (43) 18.07.2007
 (45) 23.03.2016
 (31) 625488 P (32) 05.11.2004 (33) US
 (86) PCT/US2005/040189 04.11.2005
 (87) WO2006/052839 18.05.2006
 (73) ConvaTec Technologies Inc., 3993 Howard Hughes Parkway, Suite 250, Las Vegas, NV 89169-6754, US
 (72) ADAMS, Simon, GB
 BISHOP, Stephen, GB
 GRIFFITHS, Bryan, GB
 SHAW, Helen, GB
 (74) Mays, Julie, et al, Venner Shipley LLP, 200 Aldersgate, London EC1A 4HD, GB
 Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **BRŪCES VAKUUMPĀRSĒJS VACUUM WOUND DRESSING**
 (57) 1. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma brūces gultnes pārklāšanai, kas satur:
 ar brūci kontaktējošo slāni, kas ietver šķiedrainu maisījumu vai šķiedrainu materiālu, kurš veido kohezīvu gelu, kad izmantošanas laikā to mitrina brūces eksudāts,
 vakuuma avotu, kas novietots tā, lai to no brūces gultnes atdalītu ar brūci kontaktējošais slānis, un
 vakuuma blīvēšanas slāni, kas pārklāj ar brūci kontaktējošo slāni un ir pielāgots tā, lai saglabātu relatīvu vakuumu ar brūci kontaktējošajā slānī, turklāt vakuuma blīvējošais slānis ietver putu slāni kā ārējo slāni.
 2. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur skalošanas fluīda avotu, kas novietots tā, lai piegādātu skalošanas fluīdu brūces gultnei.
 3. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur vakuuma avota savienotāju, kas izgriezts putu slānī.
 4. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt putu slāni no tieša kontakta ar brūci nošķir ar brūci kontaktējošais slānis.
 5. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma saskaņā ar 3. pretenziju, kas papildus satur fluīda avota savienotāju.
 6. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt fluīds, kas nāk pa fluīda avota savienotāju, ir skalošanas fluīds, kas opcionāli satur pretinfekcijas līdzekli.
 7. Brūces pārsiešanas vakuuma sistēma saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju, turklāt fluīds, kas nāk pa fluīda avota savienotāju, tiek piesūknēts brūces gultnei vai iesūks no vakuuma avota ar relatīvā vakuuma palīdzību.



- (51) **H02H 9/08**^(2006.01) (11) **1817829**
 (21) 05793921.7 (22) 21.10.2005
 (43) 15.08.2007
 (45) 03.02.2016
 (31) 20041055 (32) 21.10.2004 (33) CZ
 (86) PCT/CZ2005/000078 21.10.2005
 (87) WO2006/042482 27.04.2006
 (73) Zak, Frantisek, Dlouha 274, 373 67 Borek, CZ
 (72) ZAK, Frantisek, CZ
 (74) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **IERĪCE AKTĪVĀ UN REAKTĪVĀ STRĀVAS KOMPONENTA KOMPENSĒŠANAI BOJĀTA ZEMĒJUMA PUNKTĀ UN FĀZES SPRIEGUMA IZLĪDZINĀŠANA PRET ZEMI NEBOJĀTA DAUDZFĀZU MAINSTRĀVAS TĪKLA APSTĀKĻOS DEVICE FOR WATT AND BLIND CURRENT COMPONENT COMPENSATION IN THE EARTH FAULT POINT AND PHASE-TO-GROUND VOLTAGE EQUALIZATION UNDER FAILURE-FREE NETWORK CONDITION**

(57) 1. Ierīce strāvas aktīvā un reaktīvā komponenta kompensēšanai bojātā zemējuma punktā (4) un fāzes spriegumu izlīdzināšanai nebojātā daudzfāzu maiņstrāvas tīkla pareizas darbības apstākļos, kas raksturīga ar to, ka tā satur induktīva rakstura maināmu fāzes zemējuma reaktanci (1), kas ieslēgta starp katru tīkla fāzi un tīkla zemes potenciāla punktu, turklāt minētā reaktance ir ieregulēta tā, lai kompensētu bojātā zemējuma kapacitātīvo strāvu bojātajā zemējuma punktā (4), izmantojot maināmas fāzes zemējuma reaktances (1) paralēlo rezonansi ar tīkla fāzes zemējuma kapacitāti (2), un arī novērstu fāzes sprieguma nelīdzsvarotību pret zemes potenciālu pareizas tīkla darbības apstākļos, izmantojot maināmas fāzes zemējuma reaktances (1) paralēlo rezonansi ar tīkla fāzes zemējuma kapacitāti (2).

2. Paņēmieni bojātā zemējuma strāvas aktīvā komponenta novēršanai, izmantojot 1. pretenzijas atbilstošu ierīci, kas raksturīga ar to, ka bojātā zemējuma laikā nebojāto fāžu induktīvā rakstura fāzes zemējuma reaktance (1) tiek izmainīta tā, ka fāzē, kas fāžu secības virzienā seko pēc bojātās fāzes, fāzes zemējuma reaktance (1) slēgumā palielinās, un fāzē, kas fāžu secībai pretējā virzienā seko aiz bojātās fāzes, fāzes zemējuma reaktance (1) slēgumā samazinās, kas izmaina kopējās strāvas (5), kura iziet caur fāzes zemējuma reaktanci (1) bojātajā zemējuma punktā (4), vektora lielumu un fāzes nobīdi.

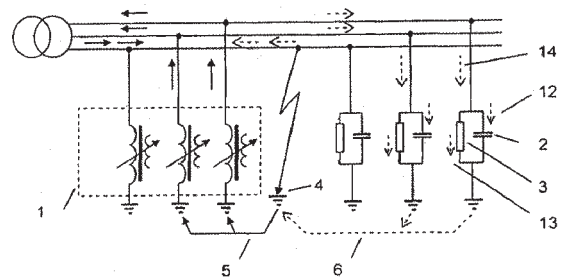
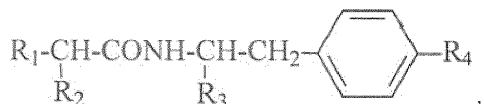


Fig.1

- (51) **C07C 233/51**^(2006.01) (11) **1876169**
C07C 237/20^(2006.01)
C07C 237/22^(2006.01)
C07K 5/065^(2006.01)
A61K 31/165^(2006.01)
A61K 38/05^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
A61P 25/16^(2006.01)
 (21) 06733250.2 (22) 24.03.2006
 (43) 09.01.2008
 (45) 30.12.2015
 (31) 2005108492 (32) 25.03.2005 (33) RU
 (86) PCT/RU2006/000139 24.03.2006
 (87) WO2006/101422 28.09.2006
 (73) Obschestvo S Ogranichennoi Otvetstennostiyy, Pharm-enterprises, Prospekt Vernadskogo 86, stroenie 5, Moscow 117571, RU

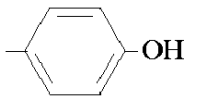
- (72) KROMOVA, Tatyana Alexandrovna, RU
 ZHELTUKHINA, Galina Alexandrovna, RU
 KOVALEVA, Violetta Leonidovna, RU
 NEBOLSIN, Vladimir Evgenievich, RU
- (74) Srinivasan, Ravi Chandran, et al, JAKemp, 14 South Square,
 Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS,
 a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **FENILGRUPU SATUROŠI N-ACILAMĪNU UN AMINO-
 SKĀBJU ATVASINĀJUMI, METODES TO RAŽOŠANAI,
 FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA UN TĀS LIETOŠANA
 PHENYL-CONTAINING N-ACYL AMINE AND AMINOACID
 DERIVATIVES, METHODS FOR THE PRODUCTION
 THEREOF, A PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND
 THE USE THEREOF**

(57) 1. Biogēna amīna fenil-N-acilatvasinājums, turklāt šis atvasinājums ir savienojums ar vispārīgo formulu (I):



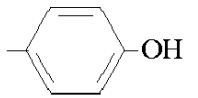
izvēlēts no:

1) R₁ ir



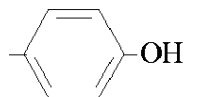
R₂ ir H, R₃ ir COOH, R₄ ir OH;

2) R₁ ir



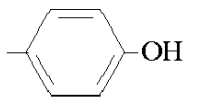
R₂ ir H, R₃ ir COOH, R₄ ir H;

3) R₁ ir



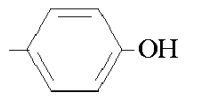
R₂ ir H, R₃ ir COOCH₃, R₄ ir OH;

4) R₁ ir

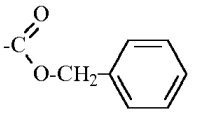


R₂ ir H, R₃ ir COOCH₃, R₄ ir H;

5) R₁ ir

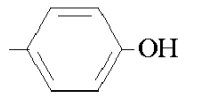


R₂ ir H, R₃ ir

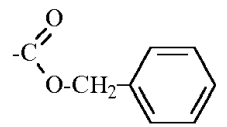


R₄ ir OH;

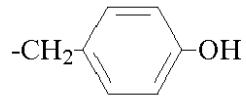
6) R₁ ir



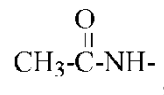
R₂ ir H, R₃ ir



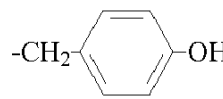
R₄ ir H;
 7) R₁ ir



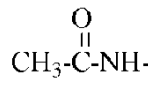
R₂ ir



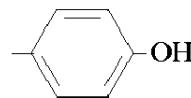
R₃ ir H, R₄ ir H;
 8) R₁ ir



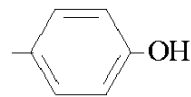
R₂ ir



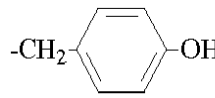
R₃ ir H, R₄ ir OH;
 9) R₁ ir



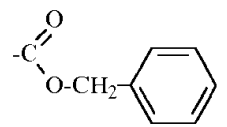
R₂ ir H, R₃ ir H, R₄ ir OH;
 10) R₁ ir



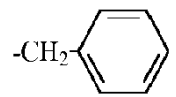
R₂ ir H, R₃ ir H, R₄ ir H;
 11) R₁ ir



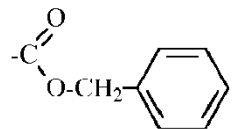
R₂ ir H, R₃ ir



R₄ ir H;
 12) R₁ ir



R₂ ir H, R₃ ir



R₄ ir H;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai par analgētiķi vai pretiekaisuma līdzekli.

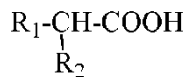
2. Biogēna amīna fenil-N-acilatvasinājums, turklāt atvasinājums ir, kā definēts 1. pretenzijā, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, ar nosacījumu, ka minētais atvasinājums nav *p*-hidroksifenilacetiltirozīna metilesteris vai *p*-hidroksifenilacetilfenilalanīna metilesteris.

3. Atvasinājums saskaņā ar 2. pretenziju, kas ir izvēlēts no:

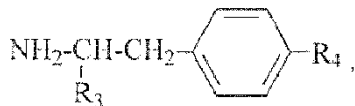
- p*-hidroksifenilacetiltirozīna,
- p*-hidroksifenilacetilfenilalanīna,
- p*-hidroksifenilacetiltirozīna benzilestera,
- p*-hidroksifenilacetilfenilalanīna benzilestera,
- N-acetiltirozilfeniletamīna,
- N-acetiltiroziltramīna,
- p*-hidroksifenilacetiltiramīna,
- p*-hidroksifenilacetilfeniletamīna,
- 3-(*p*-hidroksifenil)propionilfenilalanīna benzilestera,
- 3-fenilpropionilfenilalanīna benzilestera

un to farmaceutiski pieņemamiem sāļiem.

4. Metode atvasinājuma saskaņā ar 1. pretenziju, ar nosacījumu, ka minētais atvasinājums nav *p*-hidroksifenilacetiltirozīna metilesteris vai *p*-hidroksifenilacetilfenilalanīna metilesteris, iegūšanai, kas ietver savienojuma ar vispārīgo formulu:



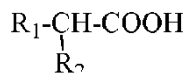
karboksilgrupas aktivēšanu, pakļaujot to reakcijai ar difenilfosforilazīdu un trietilamīnu organiskā šķīdinātājā dzesējot, kam seko pakļaušana reakcijai ar aminosavienojumu ar vispārīgo formulu



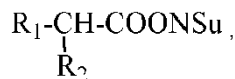
turklāt R₁-R₄ ir, kā definēts 1. pretenzijā.

5. Metode saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt tiek izmantoti 1 līdz 1,2 ekvivalenti difenilfosforilazīda un trietilamīna un/vai kā aminoatvasinājums tiek izmantots tirozīna vai fenilalanīna esteris, un/vai kā organiskais šķīdinātājs tiek izmantots N,N-dimetilformamīds vai etilacetāts, un/vai metode tiek realizēta temperatūrā, kas svārstās no -25 līdz 0 °C.

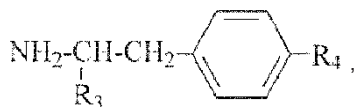
6. Metode atvasinājuma saskaņā ar 1. pretenziju, ar nosacījumu, ka minētais atvasinājums nav *p*-hidroksifenilacetiltirozīna metilesteris vai *p*-hidroksifenilacetilfenilalanīna metilesteris, iegūšanai, kas ietver *p*-hidroksifeniletikskābes, feniletikskābes vai N-aizvietota tirozīna ar vispārīgo formulu:



pārvēršanu aktivētā N-oksikuscīnimīda esterī ar vispārīgo formulu:



izmantojot N,N'-dickloheksilkarbodiimīda procesu, kam seko aktivētā N-oksikuscīnimīda estera pakļaušana reakcijai ar aminoatvasinājumu ar vispārīgo formulu:



turklāt R₁-R₄ ir, kā definēts 1. pretenzijā.

7. Metode saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt kā aminoatvasinājums tiek izmantots tirozīna vai fenilalanīna esteris.

8. Farmaceutiska kompozīcija, kas kā aktīvo vielu satur efektīvu daudzumu atvasinājuma saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemama sāls, ar nosacījumu, ka minētais atvasinājums nav *p*-hidroksifenilacetiltirozīna metilesteris vai *p*-hidroksifenilacetilfenilalanīna metilesteris, un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju lietošanai par analgētiķi, pretiekaisuma līdzekli, spazmolītiķi, antihipoksisku līdzekli, antidepresantu vai pretparkinsonisma līdzekli, vai lai potencētu citu analgētiķu iedarbību.

10. Atvasinājums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai spazmolītiskas, antihipoksiskas, antidepresīvas vai pretparkinsonisma iedarbības nodrošināšanā.

11. Atvasinājums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai, lai potencētu cita analgētiķa iedarbību.

12. Atvasinājuma saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā lietošana dažādas ģenēzes sāpju sindromu, locītavu un saistaudu, kā arī skeleta un muskuļu sistēmas iekaisuma un iekaisīgi deģeneratīvu slimību, citu iekaisuma pavadītu slimību, spazmu, depresijas, hipoksijas vai parkinsonisma simptomu ārstēšanā.

13. Atvasinājuma saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā lietošanai pēcoperācijas sāpju, posttraumatisku sāpju, kā arī ginekoloģiskas, neiroloģiskas, ļaundabīgas vai dentālas izcelsmes sāpju sindromu, reimatoīdā artrīta, artropātijas, Behtereva slimības, nespecifiska spondiloartrīta, podagrisksa artrīta, osteoartrozes, ārpulocītavu reimatisksa drudža vai tromboflebīta, vai emocionāla stresa stāvokļu un spazmu, hipoksijas izraisītu un Pārkinsona slimību pavadošu traucējumu ārstēšanā.

14. Izmantošana saskaņā ar 12. vai 13. pretenziju, turklāt medikaments ir paredzēts ievadīšanai kombinācijā ar citu analgētiķi.

- | | |
|--|---------------------|
| (51) C12N 5/0783 ^(2010.01) | (11) 1899459 |
| A61K 39/35 ^(2006.01) | |
| A61P 37/06 ^(2006.01) | |
| A61P 37/08 ^(2006.01) | |
| (21) 06808973.9 | (22) 03.07.2006 |
| (43) 19.03.2008 | |
| (45) 23.03.2016 | |
| (31) 05291429 | (32) 01.07.2005 |
| (86) PCT/IB2006/002801 | 03.07.2006 |
| (87) WO2007/010406 | 25.01.2007 |
| (73) TxCell S.A., Allée de la Nertiére, les Cardoulines, 06560 Valbonne, FR | (33) EP |
| Institut National de la Santé et de la Recherche Médicale (INSERM), 101, rue de Tolbiac, 75013 Paris, FR | |
| (72) COTTREZ, Françoise, FR | |
| GROUX, Hervé, FR | |
| BRUN, Valérie, FR | |
| FOUSSAT, Arnaud, FR | |
| (74) Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV | |
| (54) PĀRTIKAS VAI AUTOANTIGĒNSPECIFISKU TR1 ŠŪNU IEGŪŠANA NO LEIKOCĪTU VAI PAMŠ POPULĀCIJAS OBTENTION OF FOOD- OR AUTO-ANTIGEN SPECIFIC TR1 CELLS FROM A LEUKOCYTE OR PBMC POPULATION | |

(57) 1. *In vitro* metode pārtikas vai autoantigēnspecifisku Tr1 šūnu populācijas iegūšanai no cilvēka leikocītu populācijas vai cilvēka perifēro asiņu mononukleāro šūnu (PAMŠ) populācijas, minētā metode sastāv no:

- 1) cilvēka PAMŠ vai leikocītu populācijas stimulēšanas ar pārtikas vai autoantigēnu,
 - 2) pārtikas vai autoantigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas atgūšanas no stimulēto šūnu populācijas,
- ar nosacījumu, ka šī metode neietver cilvēka perifēro asiņu mononukleāro limfocītu stimulēšanu ar ovalbumīnu.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pārtikas vai autoantigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija ir iegūta no PAMŠ populācijas.

3. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt PAMŠ vai leikocītu populācija pēc soļa (1) tiek vismaz vienu reizi atkārtoti stimulēta ar tādu pašu antigēnu interleikīna-2 (IL-2) klātbūtnē un vismaz viens interleikīns ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no interleikīna-4 (IL-4) un interleikīna-13 (IL-13).

4. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt pārtikas vai autoantigēns ir rekombinants vai sintezēts antigēns.

5. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt pārtikas antigēns ir izvēlēts no grupas, kas ietver kazeīnu, sojas proteīnu, to fragmentus, variantus un maisījumus.

6. Metode saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt pārtikas antigēns ir izvēlēts no grupas, kas ietver liellopa *alfa* S-1 kazeīnu ar sekvenci SEQ ID NO: 24, liellopa *beta*-kazeīnu ar sekvenci SEQ ID NO: 25 un sekvenču, kurām ir vismaz 70 % identitāte ar vienu no sekvencēm SEQ ID NO: 24 un SEQ ID NO: 25.

7. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt autoantigēns ir izvēlēts no grupas, kas ietver insulīnu, mielīna pamatproteīnu, to fragmentus, variantus un maisījumus.

8. Metode saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai, turklāt PAMŠ populācija, kas tiek stimulēta solī (1), satur no $0,01 \times 10^6$ līdz 100×10^6 šūnas/ml, labāk no 10^6 līdz 2×10^6 šūnas/ml.

9. Metode saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt pārtikas vai autoantigēns, kas izmantots PAMŠ populācijas stimulēšanai solī (1), ir šķīstošā formā daudzumā no 0,1 µg/ml līdz 5 mg/ml, labāk no 1 līdz 2000 µg/ml.

10. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt PAMŠ vai leikocītu populācija pirms stimulācijas solī (1) tiek inkubēta ar fluorescentu šūnu dalīšanās marķieri, kas ar citofluorometriju palīdzību ļauj noteikt, ka, kad stimulēto šūnu populācijas fluorescences intensitāte ir vismaz divas reizes zemāka nekā PAMŠ vai leikocītu populācijas fluorescences intensitāte, minētajā stimulētajā šūnu populācijā ir notikusi šūnu dalīšanās un ka minētā stimulētā šūnu populācija, kas ir atgūta solī (2), satur antigēnspecifisko Tr1 šūnu populāciju.

11. Metode saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt šūnu dalīšanās fluorescentais marķieris ir karboksifluorescīna diacetāta sukcinimidil-estera (CFSE) marķieris, oregonzaļā 488 karbonskābes diacetāta (Carboxy-DFFDA SE) marķieris vai PKH26 marķieris.

12. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, turklāt antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija tiek atgūta solī (2) ar citofluorometriju palīdzību, izmantojot fluorescenti marķētas antivielas, kuras tiek virzītas pret uz minēto antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas šūnu virsmas esošajiem proteīniem.

13. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, turklāt antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija tiek atgūta solī (2) ar klonēšanas tehniku, vēlamas ar tādu kā robežatšķaidījums.

14. *In vitro* metode pārtikas vai autoantigēnspecifisku Tr1 šūnu populācijas iegūšanai no cilvēka leikocītu populācijas vai cilvēka perifēro asiņu mononukleāro šūnu (PAMŠ) populācijas, minētā metode ietver:

a) pārtikas vai autoantigēnspecifisko 2. solī iegūto Tr1 šūnu populācijas atgūšanu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai un

b) minētās antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas paplašināšanu, minētajai antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijai kontaktējot ar CD3+CD28 granulām IL-2 un IL-4 klātbūtnē.

15. *In vitro* metode pārtikas vai autoantigēnspecifisku Tr1 šūnu populācijas iegūšanai no cilvēka leikocītu populācijas vai cilvēka perifēro asiņu mononukleāro šūnu (PAMŠ) populācijas, minētā metode ietver:

a) pārtikas vai autoantigēnspecifisko 2. solī iegūto Tr1 šūnu populācijas atgūšanu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai un

b) minētās antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas paplašināšanu Mp barotnē,

turklāt minētais paplašināšanas solis ietver:

i. kultivēšanu T1 temperatūrā Mf barotnē, barotājšūnas ir spējīgas ekspresēt rekombinantu faktoru grupu, kura, lai nodrošinātu antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas paplašināšanos, mijiedarbojas ar šādiem antigēnspecifisko Tr1 šūnu virsmas proteīniem:

- CD3/TCR proteīnu kompleksu,
- CD28 proteīnu,
- CD2 proteīnu,
- interleikīna-2 (IL-2) receptoru un
- interleikīna-4 (IL-4) receptoru,

šāda T1 padara iespējamu minēto barotājšūnu proliferāciju,

ii. solī (a) iegūto barotājšūnu, kas ir attīrītas vai neattīrītas no to Mf barotnes, kontaktēšanu ar Mp barotnē esošo antigēnspecifisko Tr1 šūnu populāciju, turklāt minētā Mp barotne sākotnēji nesatur faktoru grupu, nolūkā iegūt maisījumu, kas satur antigēnspecifisko Tr1 šūnu populāciju, barotājšūnas un Mp barotni,

iii. solī (b) iegūtā maisījuma, kas satur barotājšūnu Mp barotnē ekspresētos grupas faktorus, kultivēšanu, turklāt minētais kultivēšanas solis (c) tiek veikts T2 temperatūrā, kas ir vismaz aptuveni 35 °C, tā ka:

- antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija proliferē un

- barotājšūnas nevirojās un turklāt antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija tiek paplašināta,

iv. šādi paplašinātās antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas atgūšanu.

16. Metode saskaņā ar 15. pretenziju, turklāt barotājšūnas iet bojā solī (iii).

17. Metode saskaņā ar 16. pretenziju, turklāt solī (iv) tiek likvidēti barotājšūnu celulārās membrānas fragmenti, kas radušies minēto šūnu bojāejas dēļ.

18. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 17. pretenzijai, turklāt faktoru grupa ietver barotājšūnu celulārā membrānā noenkurotos faktorus un minēto barotājšūnu sekretētos faktorus.

19. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 18. pretenzijai, turklāt barotājšūnas ir rekombinantas šūnas un satur heterologas, minētās grupas faktorus kodējošas, nukleīnskābes.

20. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 19. pretenzijai, turklāt uz barotājšūnu virsmas nav nevienas raksturīgas I un/vai II klases galvenā audu saderības kompleksa (MHC) molekulas.

21. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 20. pretenzijai, turklāt solī (ii) barotājšūnas tiek attīrītas no to Mf barotnes.

22. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 21. pretenzijai, turklāt barotājšūnas ir kukaiņu barotājšūnas ar T1, kas ir zemāka par T2.

23. Metode saskaņā ar 22. pretenziju, turklāt kukaiņu barotājšūnas ir no S2 drozofilas šūnu līnijas, kas 2005. gada 25. martā deponēta Nacionālajā mikroorganismu kultūru kolekcijā (NMKK) ar numuru 1-3407.

24. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 23. pretenzijai, turklāt Mp barotne ir bezseruma barotne.

25. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 23. pretenzijai, turklāt Mf barotne ir bezseruma barotne.

26. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 25. pretenzijai, turklāt rekombinanto faktoru grupa ietver:

- modificētu anti-CD3 antivielu, turklāt anti-CD3 antivielas modifikācija ir anti-CD3 smagās ķēdes anti-CD3 intracitoplazmas domēna aizstāšana ar transmembrānas domēnu, minētā modificētā anti-CD3 anti-viela ir noenkurota barotājšūnu celulārā membrānā un ir spējīga mijiedarboties ar T šūnu CD3/TCR proteīnu kompleksu vai tā variantu,

- CD80 vai CD86 proteīnu, labāk CD80 proteīnu, noenkurotu barotājšūnu celulārā membrānā, spējīgu mijiedarboties ar T šūnu CD28 proteīnu vai tā variantu, un

- CD58 proteīnu, noenkurotu barotājšūnu celulārā membrānā, spējīgu mijiedarboties ar Tr1 šūnu CD2 proteīnu vai tā variantu,

- barotājšūnu sekretēto IL-2, spējīgu mijiedarboties ar Tr1 šūnu IL-2 receptoru vai tā variantu, un

- interleikīnu, kas izvēlēts no grupas kura ietver IL-4 un interleikīnu-13 (IL-13), labāk IL-4, minētais interleikīns ir barotājšūnu sekretēts un ir spējīgs mijiedarboties ar Tr1 šūnu IL-4 receptoru vai tā variantu.

27. Metode saskaņā ar 26. pretenziju, turklāt transmembrānas domēns, kas aizstāj anti-CD3 antivielas smagās ķēdes intracitoplazmas domēnu, ir no trombocītiem atvasinātā augšanas faktora (PDGF) receptora transmembrānas domēns.

28. Metode saskaņā ar 26. vai 27. pretenziju, turklāt minētās grupas faktoriem ir cilvēka izcelsme.

29. Metode saskaņā ar 28. pretenziju, turklāt

- modificētās anti-CD3 antivielas vieglā ķēde tiek kodēta ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 1 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 1, un turklāt modificētās anti-CD3 antivielas smagā ķēde tiek kodēta ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 2 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 2; un/vai

- metode saskaņā ar 30. vai 31. pretenziju, turklāt CD80 proteīns tiek kodēts ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 3 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 3, un/vai

- metode saskaņā ar 30. vai 31. pretenziju, turklāt CD86 proteīns tiek kodēts ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 4

vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 4, un/vai

- metode saskaņā ar jebkuru no 30. līdz 33. pretenzijai, turklāt CD58 proteīns tiek kodēts ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 6 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 6, un/vai

- metode saskaņā ar jebkuru no 30. līdz 34. pretenzijai, turklāt IL-2 tiek kodēts ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 5 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 5, un/vai

- metode saskaņā ar jebkuru no 30. līdz 35. pretenzijai, turklāt IL-4 tiek kodēts ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 7 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 7, un/vai

- metode saskaņā ar jebkuru no 30. līdz 36. pretenzijai, turklāt IL-13 tiek kodēts ar heterologo nukleīnskābi ar sekvenci SEQ ID NO: 8 vai jebkuru nukleīnskābi ar vismaz 70 % identitāti ar SEQ ID NO: 8.

30. Metode saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 29. pretenzijai, turklāt šādi paplašinātā antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija pēc antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas kultivēšanas solī (iii), tiek atgūta solī (iv) vismaz 12 stundu laikā, vēlams 24 stundu laikā.

31. *In vitro* metode pārtikas vai autoantigēnspecifisku Tr1 šūnu populācijas iegūšanai no cilvēka leikocītu populācijas vai cilvēka perifēro asiņu mononukleāro šūnu (PAMŠ) populācijas, minētā metode sastāv no:

1) cilvēka PAMŠ vai leikocītu populācijas stimulēšanas ar pārtikas vai autoantigēnu,

2) pārtikas vai autoantigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas atgūšanas no stimulēto šūnu populācijas un

3) minētās antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijas paplašināšanas, minētajai antigēnspecifisko Tr1 šūnu populācijai kontaktējot ar CD3+CD28 granulām IL-2 un IL-4 klātbūtnē.

32. Metode saskaņā ar 31. pretenziju, turklāt pārtikas vai autoantigēnspecifisko Tr1 šūnu populācija tiek iegūta no PAMŠ populācijas.

33. Metode saskaņā ar 31. vai 32. pretenziju, turklāt PAMŠ vai leikocītu populācija tiek vismaz vienu reizi atkārtoti stimulēta ar tādu pašu antigēnu pēc soļa (1) interleikīna-2 (IL-2) klātbūtnē un vismaz viens interleikīns ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no interleikīna-4 (IL-4) un interleikīna-13 (IL-13).

34. Metode saskaņā ar jebkuru no 31. līdz 33. pretenzijai, turklāt pārtikas vai autoantigēns ir rekombinants vai sintezēts antigēns.

35. Metode saskaņā ar jebkuru no 31. līdz 34. pretenzijai, turklāt pārtikas antigēns ir izvēlēts no grupas, kas ietver ovalbumīnu, kazeīnu, sojas proteīnu, to fragmentus, variantus un maisījumus.

36. Metode saskaņā ar 35. pretenziju, turklāt pārtikas antigēns ir izvēlēts no grupas, kas ietver vistas olas olbaltumu ar sekvenci SEQ ID NO: 23, liellopa *alfa* S-1 kazeīnu ar sekvenci SEQ ID NO: 24, liellopa *beta*-kazeīnu ar sekvenci SEQ ID NO: 25 un sekvenču ar vismaz 70 % identitāti ar vienu no sekvenču SEQ ID NO: 23, SEQ ID NO: 24 un SEQ ID NO: 25.

37. Metode saskaņā ar jebkuru no 31. līdz 36. pretenzijai, turklāt autoantigēns ir izvēlēts no grupas, kas ietver insulīnu, mielīna pamatproteīnu, to fragmentus, variantus un maisījumus.

38. Metode saskaņā ar jebkuru no 31. līdz 37. pretenzijai, turklāt PAMŠ populācija, kas tiek stimulēta solī (1), satur no $0,01 \cdot 10^6$ līdz $100 \cdot 10^6$ šūnas/ml, labāk no 10^6 līdz $2 \cdot 10^6$ šūnas/ml.

39. Metode saskaņā ar 38. pretenziju, turklāt PAMŠ populācijas stimulēšanai solī (1) izmantotais pārtikas vai autoantigēns ir šķīstošā formā daudzumā no 0,1 µg/ml līdz 5 mg/ml, labāk no 1 līdz 2000 µg/ml.

(72) LUNDKVIST, Ulf, SE
SJOBERG, Berndt, SE
WILLANDER, Erik, SE
NYGREN, Soren, SE

(74) Awapatent AB, P.O. Box 45086, 104 30 Stockholm, SE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **PARAUGU ŅEMŠANAS SISTĒMA
SAMPLING SYSTEM**

(57) 1. Paraugu ņemšanas sistēma, kas satur:

a) pa pastu nosūtāmo paketi (14);

b) individuālu parauga ņemšanas ierīci (2), kas satur:

i) elastīgu vārpstu (4) ar rokturi (5) vienā galā, turklāt vārpsta ir konfigurēta tā, lai ļautu individam pašam noņemt ginekoloģisko (uztriepes) paraugu no gļotādas audiem, un

ii) parauga ņemšanas elementu (6), kas atvienojamā veidā ar ātrdarbīga sprostsavienojuma (*snap-fit connection*) palīdzību ir savienojams ar vārpstas otru galu, pie tam savienojums ir izveidots ar izvīrījumiem (15) parauga ņemšanas elementa galā, kuri ir salāgoti ar sprostsavienojuma rievām, ko satur pagarinājumi (16) otrā vārpstas galā, un kas ir darbināms ginekoloģiskā parauga noņemšanai no indivīda gļotādas audiem;

c) hermetizējamo elementu (7), kurš ir konfigurēts tā, lai glabātu parauga ņemšanas elementu ar tā ginekoloģisko paraugu hermetizētā veidā un ievietotu pasta paketē hermetizētā veidā; pie kam:

parauga ņemšanas elements, vārpsta un hermetizējamais elements ir konfigurēti tā, lai ļautu parauga ņemšanas elementu vismaz daļēji ievietot hermetizējamajā elementā un to atdalīt no vārpstas, atvienojot minēto sprostsavienojumu,

bez parauga ņemšanas elementa kontaktēšanas ar indivīdu, parauga ņemšanas elementu pagriežot, izvīrījumi tiek atbrīvoti no rievām, kas ietvertas izvīrījumos.

2. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam vārpsta ir konfigurēta tā, lai ļautu individam pašam noņemt ginekoloģisko paraugu no dzemdes kakla.

3. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam ginekoloģiskais paraugs ir HPV (papilomas vīrusa) analīzes paraugs.

4. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur transportēšanas paketi (3), kas ir konfigurēta tā, lai tajā varētu ievietot komponentus a) līdz c) piegādei indivīdam sistēmas lietošanai.

5. Sistēma saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam katrai transportēšanas paketei un ierīcei ir identifikācijas elements (8).

6. Sistēma saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam identifikācijas elements ietver svītrkodu.

7. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam daļa no vārpstas ir stingra.

8. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam vārpsta ir veidota no polimēra, kas satur polipropilēnu, polietilēnu vai to maisījumu.

9. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam parauga ņemšanas elements būtībā ir cilindrisks un tā diametrs ir apmēram no 2 līdz 20 mm.

10. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam parauga ņemšanas elements satur vismaz vienu paaugstinātu daļu (9).

11. Sistēma saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam paaugstinātā daļa veido vairākus šūnu un gļotu ņemšanas segmentus.

12. Sistēma saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam parauga ņemšanas elements papildus satur vismaz vienu rievu (11) ar platumu apmēram no 0,01 līdz 2 mm ginekoloģiskā parauga saglabāšanai tajā.

13. Sistēma saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam izvīrītā daļa veido rievu malu, kas spēj nokasīt audus, lai noņemtu paraugu.

14. Sistēma saskaņā ar 13. pretenziju, pie kam paaugstinātā daļa un rievu ir konfigurētas tā, lai noņemtu paraugu, to ievietojot ķermeņa atverē, un noņemto paraugu noturētu ierīces izņemšanas laikā no ķermeņa atveres.

15. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam parauga noņemšanas elementam ir abrazīva virsma.

16. Sistēma saskaņā ar 15. pretenziju, pie kam abrazīvās virsmas raupjums ir apmēram no 1 līdz 100 µm.

17. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam hermetizējamais elements satur elementa segslāni.

18. Sistēma saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam ierīce un ierīces segslānis veido gaisnecaurlaidīgu savienojumu.

19. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur instrukcijas lapu.

(51) A61B 10/02 ^(2006.01)	(11) 1903946
A61B 10/00 ^(2006.01)	
(21) 06765587.8	(22) 26.05.2006
(43) 02.04.2008	
(45) 20.01.2016	
(31) 685892 P	(32) 31.05.2005 (33) US
(86) PCT/IB2006/001723	26.05.2006
(87) WO2006/129195	07.12.2006
(73) Aprovis AB, Uppsala Science Park, Dag Hammarskjöldsväg 54B, 751 83 Uppsala, SE	

20. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam: pa pastu nosūtāmā pakete iepriekš ir adresēta, noņemto paraugu saturošajam elementam ir vairākas paugstinātas daļas un rievas un sistēma papildus satur instrukcijas lapu, svītrkoda elements ietver gaisnecaurīdīgu hermetizējamā elementa apvalku un ir konfigurēts tā, lai uzņemtu iegūto ginekoloģisko paraugu saturošu elementu un to varētu ievietot pasta paketē, transportēšanas pakete ir konfigurēta tā, lai uzņemtu lietotājam pa pastu nosūtāmo paketi, instrukcijas lapu, elastīgo vārpstu, parauga ņemšanās elementu un svītrkoda elementu.

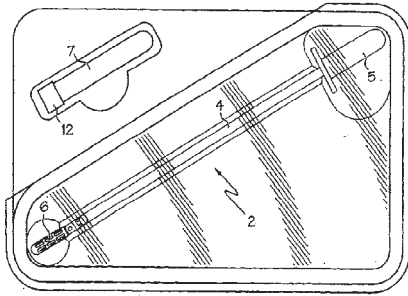


FIG. 2

- (51) **C12N 15/31**^(2006.01) (11) **1943342**
A61K 39/09^(2006.01)
A61K 38/16^(2006.01)
A61P 31/00^(2006.01)
C07K 14/315^(2006.01)
C07K 16/12^(2006.01)
C07K 7/08^(2006.01)
C12N 15/74^(2006.01)
G01N 33/569^(2006.01)
- (21) 06790631.3 (22) 01.09.2006
(43) 16.07.2008
(45) 13.04.2016
(31) 713328 P (32) 02.09.2005 (33) US
(86) PCT/CA2006/001454 01.09.2006
(87) WO2007/025390 08.03.2007
(73) Valorisation-Recherche, Limited Partnership, 5160 Décarie Blvd., Suite 770, Montreal, QC H3X 2H9, CA
(72) HAREL, Josée, CA
GOTTSCHALK, Marcelo, CA
LI, Yuanyi, CA
(74) Regimbeau, 20, rue de Chazelles, 75847 Paris Cedex 17, FR
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **STREPTOCOCCUS SUIIS POLIPEPTĪDI UN TOS KODĒJOŠI POLINUKLEOTĪDI UN TO LIETOŠANA VAKCINĀCIJĀ UN DIAGNOSTIKĀ**
STREPTOCOCCUS SUIIS POLYPEPTIDES AND POLYNUCLEOTIDES ENCODING SAME AND THEIR USE IN VACCINAL AND DIAGNOSTIC APPLICATIONS
- (57) 1. Izolēts SP1 polipeptīds, kas ir spējīgs izraisīt specifisku imūnatbildi pret *Streptococcus suis* un satur aminoskābju sekvenci, kas ir vismaz 95 % identiska SEQ ID NO: 4 vai 17 parādītajai aminoskābju sekvencei.
2. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur SEQ ID NO: 10 parādīto aminoskābju sekvenci.
3. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas satur aminoskābju sekvenci, kas ir vismaz 95 % identiska SEQ ID NO: 17 parādītajai aminoskābju sekvencei.
4. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas satur aminoskābju sekvenci, kas ir vismaz 95 % identiska SEQ ID NO: 4 parādītajai aminoskābju sekvencei.
5. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur SEQ ID NO: 17 parādīto aminoskābju sekvenci.
6. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur SEQ ID NO: 4 parādīto aminoskābju sekvenci.

7. Izolēts SP1 polipeptīds, kas ir spējīgs izraisīt specifisku imūnatbildi pret *Streptococcus suis* un satur SEQ ID NO: 2 vai 3 parādīto aminoskābju sekvenci.
8. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kas sastāv no SEQ ID NO: 17 parādītās aminoskābju sekvences.
9. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kas sastāv no SEQ ID NO: 4 parādītās aminoskābju sekvences.
10. Izolētais SP1 polipeptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt tad, kad tas ir ievadīts dzīvniekam, tas izraisa aizsargreakciju pret *Streptococcus suis* celma ierosināto infekciju.
11. Izolēts SP1 polinukleotīds, kas kodē polipeptīdu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai.
12. Izolētais SP1 polinukleotīds saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt polinukleotīda sekvence ir 95 % identiska SEQ ID NO: 18 parādītajai sekvencei.
13. Izolētais SP1 polinukleotīds saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt polinukleotīda sekvence ir 95 % identiska SEQ ID NO: 8 parādītajai sekvencei.
14. Izolētais SP1 polinukleotīds saskaņā ar 11. pretenziju, kas satur SEQ ID NO: 18 parādīto sekvenci.
15. Izolētais SP1 polinukleotīds saskaņā ar 11. pretenziju, kas satur SEQ ID NO: 8 parādīto sekvenci.
16. Antiviela, kas specifiski saistās ar SP1 polipeptīdu, kas sastāv no SEQ ID NO: 4 vai SEQ ID NO: 17 parādītās aminoskābju sekvences.
17. Vektors, kas satur polinukleotīdu saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai.
18. Kompozīcija, kas satur pieņemamu nesēju un vismaz vienu no:
- polipeptīda saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai;
- polinukleotīda saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai vai
- vektora saskaņā ar 17. pretenziju.
19. Kompozīcija, kas satur pieņemamu nesēju un vismaz vienu antivielu saskaņā ar 16. pretenziju.
20. Metode kompozīcijas saskaņā ar 19. pretenziju gatavošanai ar *Streptococcus suis* saistītu slimību vai infekciju, ko izraisījis *S. suis*, profilaksei, kas ietver vismaz vienas antivielas saskaņā ar 16. pretenziju un vismaz viena pieņemama nesēja samaisīšanas soli, turklāt minētā vismaz viena anti viela rodas vakcinācijas ar uz Th1 virzošu adjuvantu rezultātā.
21. Metode kompozīcijas gatavošanai lietošanai ar *Streptococcus suis* saistītas slimības vai infekcijas profilaksē dzīvniekam, turklāt metode ietver soli, kurā vismaz viens no:
- polipeptīda saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai,
- polinukleotīda saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai vai
- vektora saskaņā ar 17. pretenziju tiek samaisīts ar vismaz vienu pieņemamu nesēju un uz Th1 virzošu adjuvantu.
22. Kompozīcija, kas sastāv no polipeptīda saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai un uz Th1 virzoša adjuvanta, polinukleotīda saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai un uz Th1 virzoša adjuvanta, ekspresijas vektora saskaņā ar 17. pretenziju un uz Th1 virzoša adjuvanta vai kompozīcijas saskaņā ar 18. pretenziju un uz Th1 virzoša adjuvanta, lietošanai par medikamentu vai par vakcīnu.
23. Kompozīcija, kas sastāv no polipeptīda saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai un uz Th1 virzoša adjuvanta, polinukleotīda saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai un uz Th1 virzoša adjuvanta, ekspresijas vektora saskaņā ar 17. pretenziju un uz Th1 virzoša adjuvanta vai kompozīcijas saskaņā ar 18. pretenziju un uz Th1 virzoša adjuvanta, lietošanai ar *Streptococcus suis* saistītas slimības vai infekcijas profilaksē dzīvniekam.
24. Antiviela saskaņā ar 16. pretenziju vai kompozīcija saskaņā ar 19. pretenziju lietošanai par medikamentu, turklāt minētā vismaz viena anti viela rodas vakcinācijas ar uz Th1 virzošu adjuvantu rezultātā.
25. Antiviela saskaņā ar 16. pretenziju vai kompozīcija saskaņā ar 19. pretenziju lietošanai ar *Streptococcus suis* saistītas slimības vai infekcijas profilaksē dzīvniekam, turklāt minētā vismaz viena anti viela rodas vakcinācijas ar uz Th1 virzošu adjuvantu rezultātā.
26. Metode *Streptococcus suis* celma klātbūtnes vai neesamības noteikšanai paraugā *in vitro*, kas ietver šādus soļus:
a) parauga pakļaušanu kontaktam ar antivielu saskaņā ar 16. pretenziju tik īļu laiku un tādos apstākļos, kas ir pietiekami,

lai izveidotos imūnkomplekss, un

b) solī (a) izveidotā imūnkompleksa klātbūtnes vai neesamības noteikšanu.

27. Metode pret *Streptococcus suis* celmu radušos antivielu klātbūtnes vai neesamības noteikšanai paraugā *in vitro*, kas ietver šādus soļus:

a) parauga pakļaušanu kontaktam ar polipeptīdu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai tik ilgu laiku un tādos apstākļos, kas ir pietiekami, lai izveidotos imūnkomplekss, un

b) solī (a) izveidotā imūnkompleksa klātbūtnes vai neesamības noteikšanu.

28. Diagnostikas komplekts uz *Streptococcus suis* celmu norādošu antivielu klātbūtnes vai neesamības noteikšanai, kas satur:

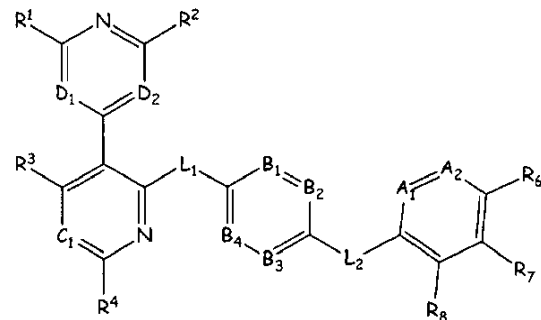
- polipeptīdu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai,
- reaģentu polipeptīda-antivielas imūnkompleksa noteikšanai,
- bioloģisku references paraugu bez antivielām, kas imunoloģiski saistās ar minēto polipeptīdu, un
- salīdzinājuma paraugu, kas satur antivielas, kas var specifiski saistīties ar minēto polipeptīdu, turklāt minētais polipeptīds, reaģents, bioloģiskais references paraugs un salīdzinājuma paraugs ir pietiekamā daudzumā, lai veiktu minēto noteikšanu.

29. Diagnostikas komplekts uz *Streptococcus suis* celmu norādošu polipeptīdu klātbūtnes vai neesamības noteikšanai, kas satur:

- antivielu saskaņā ar 16. pretenziju,
- reaģentu polipeptīda-antivielas imūnkompleksa noteikšanai,
- bioloģiska references parauga polipeptīdus, kas imunoloģiski saistās ar minēto antivielu, un
- salīdzinājuma paraugu, kas satur polipeptīdus, kuri var specifiski saistīties ar minēto polipeptīdu, turklāt minētā antiViela, reaģents, bioloģiskais references paraugs un salīdzinājuma paraugs ir pietiekamā daudzumā, lai veiktu minēto noteikšanu.

- (51) **C07D 401/12**^(2006.01) (11) **1984353**
C07D 401/14^(2006.01)
C07D 403/12^(2006.01)
C07D 409/14^(2006.01)
C07D 413/14^(2006.01)
C07D 417/14^(2006.01)
C07D 471/04^(2006.01)
C07D 487/04^(2006.01)
C07D 497/04^(2006.01)
A61K 31/502^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
- (21) 07716912.6 (22) 22.01.2007
(43) 29.10.2008
(45) 30.12.2015
(31) 761675 P (32) 23.01.2006 (33) US
655642 18.01.2007 US
(86) PCT/US2007/001714 22.01.2007
(87) WO2007/087276 02.08.2007
(73) Amgen, Inc, Patent Operations, M/S 28-2-C, One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, California 91320-1799, US
(72) CEE, Victor J., US
DEAK, Holly L., US
DU, Bingfan, US
GEUNS-MEYER, Stephanie D., US
HODOUS, Brian L., US
NGUYEN, Hanh Nho, US
OLIVIERI, Philip R., US
PATEL, Vinod F., US
ROMERO, Karina, US
SCHENKEL, Laurie, US
(74) Grünecker Patent- und Rechtsanwälte PartG mbB, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
(54) **AURORA KINĀZES MODULATORI UN LIETOŠANAS METODE**
AURORA KINASE MODULATORS AND METHOD OF USE

(57) 1. Savienojums ar formulu (II):



II

vai tā stereoisomērs, tautomērs, solvāts vai farmaceitiski pieņemams sāls, kurā

A¹ un A² katrs neatkarīgi ir N vai CR⁹, ar nosacījumu, ka vismaz viens no A¹ un A² ir N;

B¹, B², B³ un B⁴ katrs neatkarīgi ir N vai CR⁵, ar nosacījumu, ka ne vairāk kā divi no B¹, B², B³ un B⁴ ir N;

C¹ ir CR¹⁰;

D¹ ir N vai CR¹¹;

D² ir N vai CR¹²;

L¹ ir NR³, O, S vai CR³R³;

L² ir NR³, O vai S;

R¹ ir OR¹⁴, SR¹⁴, OR¹⁵, SR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, (CHR¹⁵)_nR¹⁴, (CHR¹⁵)_nR¹⁵ vai R¹⁵;

alternatīvi, R¹ un R¹¹, ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N un S, un gredzens ir eventuāli aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 3 aizvietotājiem no oksogrupas, R¹⁵, SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, OC(O)R¹⁵, COOR¹⁵, C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁴R¹⁵ vai NR¹⁵R¹⁵; R² ir H, halogēna atoms, NO₂, CN, C₁₋₁₀alkilgrupa vai C₁₋₁₀alkoksilgrupa;

R³, R⁴ un R⁹ katrs neatkarīgi ir H;

katrs R⁵ ir neatkarīgi SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, COOR¹⁵, OC(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁵), OC(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁵R¹⁵ vai R¹⁵;

R⁶ ir R¹⁴;

R⁷ un R⁸ katrs neatkarīgi ir R¹³, R¹⁴ vai R¹⁵;

alternatīvi, R⁷ un R⁸, abi ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido pilnībā piesātinātu vai daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N vai S, un gredzens ir eventuāli aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 4 aizvietotājiem R¹³, R¹⁴ vai R¹⁵;

R¹⁰, R¹¹ un R¹² katrs neatkarīgi ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵ vai R¹⁵;

R¹³ ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, OC(O)R¹⁴, OC(O)R¹⁵, COOR¹⁴, COOR¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁴), NR¹⁵(COOR¹⁵), NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂R¹⁴, NR¹⁵S(O)₂R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ vai NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵;

R¹⁴ ir daļēji vai pilnībā piesātināta vai pilnībā nepiesātināta 5- līdz 8-locekļu monocikliska, 6- līdz 12-locekļu bicikliska vai 7- līdz 14-locekļu tricikliska gredzenu sistēma, turklāt no oglekļa atomiem veidotā gredzenu sistēma eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, ja ir monocikliska sistēma, 1 līdz 6 heteroatomus, ja ir bicikliska sistēma, vai 1 līdz 9 heteroatomus, ja ir tricikliska sistēma, heteroatomu ir izvēlēti no O, N vai S, turklāt katra gredzēna 0, 1, 2 vai 3 atomi ir eventuāli aizvietoti neatkarīgi ar 1 līdz 5 aizvietotājiem R¹⁵; R¹⁵ ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, halogēnalkoksilgrupa, oksogrupa, CN, OH, SH, NO₂, NH₂, acetilgrupa, C₁₋₁₀alkilgrupa, C₂₋₁₀alkenilgrupa, C₂₋₁₀alkinilgrupa, C₃₋₁₀cikloalkilgrupa, C₄₋₁₀cikloalkenilgrupa, C₁₋₁₀alkilamino-, C₁₋₁₀dialkilamino-, C₁₋₁₀alkoksilgrupa,

C₁₋₁₀tioalkoksilgrupa vai piesātināta vai daļēji vai pilnībā nepiesātināta 5- līdz 8-locekļu monocikliska, 6- līdz 12-locekļu bicikliska vai 7- līdz 14-locekļu tricikliska gredzenu sistēma, turklāt no oglekļa atomiem veidotā gredzenu sistēma eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, ja ir monocikliska sistēma, 1 līdz 6 heteroatomus, ja ir bicikliska sistēma, vai 1 līdz 9 heteroatomus, ja ir tricikliska sistēma, minētie heteroatomu ir izvēlēti no O, N vai S, turklāt katra no C₁₋₁₀alkilgrupas, C₂₋₁₀alkenilgrupas, C₂₋₁₀alkinilgrupas, C₃₋₁₀cikloalkilgrupas, C₄₋₁₀cikloalkenilgrupas, C₁₋₁₀alkilamino-, C₁₋₁₀dialkilamino-, C₁₋₁₀alkoksilgrupas, C₁₋₁₀tioalkoksilgrupas un minētās gredzenu sistēmas gredzens ir eventuāli aizvietota(-s) neatkarīgi ar 1 līdz 5 aizvietotajiem no halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, CN, NO₂, NH₂, OH, oksogrupas, metilgrupas, metoksilgrupas, etilgrupas, etoksilgrupas, propilgrupas, propoksilgrupas, izopropilgrupas, ciklopropilgrupas, butilgrupas, izobutilgrupas, *tert*-butilgrupas, metilamīngrupas, dimetilamīngrupas, etilamīngrupas, dietilamīngrupas, propilamīngrupas, izopropilamīngrupas, dipropilamīngrupas, diizopropilamīngrupas, benzilgrupas vai fenilgrupas; un n ir 0, 1, 2, 3 vai 4;

ar nosacījumu, ka ne vairāk kā viens no D¹ un D² ir N.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā

A¹ un A² katrs neatkarīgi ir N;

B¹, B², B³ un B⁴ katrs neatkarīgi ir N vai CR⁵ ar nosacījumu, ka ne vairāk kā viens no B¹, B², B³ un B⁴ ir N;

C¹ ir CR¹⁰;

D¹ ir N vai CR¹¹;

D² ir N vai CR¹²;

L¹ ir NH, O vai S;

L² ir NH, O vai S, ar nosacījumu, ka L¹ un L² abi nav ne O, ne S;

R¹ ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, NO₂, NH₂, acetilgrupa, C₁₋₁₀alkilgrupa, C₂₋₁₀alkenilgrupa, C₂₋₁₀alkinilgrupa, C₃₋₁₀cikloalkilgrupa, C₁₋₁₀alkilamino-, C₁₋₁₀dialkilamino-, C₁₋₁₀alkoksilgrupa, C₁₋₁₀tioalkoksilgrupa, NHR¹⁴, NHR¹⁵, OR¹⁵, SR¹⁵ vai CH₂R¹⁵;

R² ir H, halogēna atoms, NO₂, CN, C₁₋₁₀alkilgrupa vai C₁₋₁₀alkoksilgrupa;

R³, R⁴ un R⁹ katrs ir H;

katrs R⁵ neatkarīgi ir SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁵), S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵ vai R¹⁵;

R⁷ un R⁸ katrs neatkarīgi ir R¹⁵;

alternatīvi, R⁷ un R⁸, abi ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N vai S, un gredzens eventuāli ir aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 4 aizvietotajiem R¹³ vai R¹⁵; un R¹⁰, R¹¹ un R¹² katrs neatkarīgi ir R¹⁵.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā

R¹ ir NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, (CHR¹⁵)_nR¹⁴, (CHR¹⁵)_nR¹⁵ vai R¹⁵; alternatīvi, R¹ un R¹¹, ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N un S, un gredzens eventuāli ir aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 3 aizvietotajiem R¹⁵;

R² ir H, halogēna atoms, CN, NO₂, metilgrupa, metoksilgrupa, etilgrupa, etoksilgrupa, propilgrupa, propoksilgrupa, propoksilgrupa, izopropilgrupa, butilgrupa, izobutilgrupa, *tert*-butilgrupa;

R³, R⁴ un R⁹ katrs ir H;

katrs R⁵ neatkarīgi ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, CN, NO₂, NH₂, OH, metilgrupa, metoksilgrupa, etilgrupa, etoksilgrupa, propilgrupa, propoksilgrupa, izopropilgrupa, ciklopropilgrupa, butilgrupa, izobutilgrupa, *tert*-butilgrupa, metilamīngrupa, dimetilamīngrupa, etilamīngrupa, dietilamīngrupa, propilamīngrupa, izopropilamīngrupa, dipropilamīngrupa vai diizopropilamīngrupa;

R⁷ un R⁸ katrs neatkarīgi ir R¹⁵;

alternatīvi, R⁷ un R⁸, abi ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N vai S, un gredzens eventuāli ir aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 4 aizvietotajiem R¹³, R¹⁴ vai R¹⁵; un R¹⁰, R¹¹ un R¹² katrs neatkarīgi ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, CN, NO₂, NH₂, OH, metilgrupa, metoksilgrupa, etilgrupa, etoksilgrupa, propilgrupa, propoksilgrupa, izopropilgrupa, ciklopropilgrupa, butilgrupa, izobutilgrupa, *tert*-butilgrupa, metilamīngrupa,

dimetilamīngrupa, etilamīngrupa, dietilamīngrupa, propilamīngrupa, izopropilamīngrupa, dipropilamīngrupa vai diizopropilamīngrupa.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā

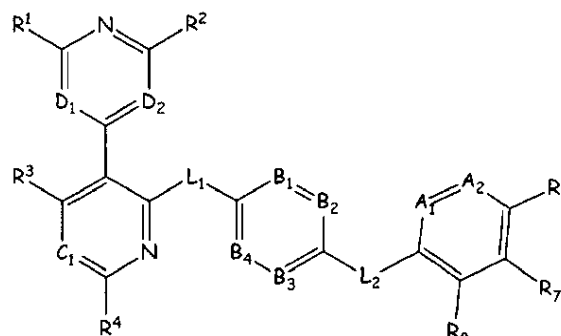
A¹ un A² katrs neatkarīgi ir N un

R⁷ un R⁸, ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N vai S, un gredzens eventuāli ir aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 4 aizvietotajiem R¹³, R¹⁴ vai R¹⁵.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā

R⁶ ir fenilgrupa, naftilgrupa, piridilgrupa, pirimidinilgrupa, piridazinilgrupa, pirazinilgrupa, triazinilgrupa, hinolinilgrupa, dihidrohinolinilgrupa, tetrahidrohinolinilgrupa, izohinolinilgrupa, tetrahidroizohinolinilgrupa, hinazolinilgrupa, izohinazolinilgrupa, ftalazinilgrupa, tiofenilgrupa, furilgrupa, tetrahidrofuranilgrupa, pirolilgrupa, pirazolilgrupa, tienopirazolilgrupa, imidazolilgrupa, triazolilgrupa, tetrazolilgrupa, tiazolilgrupa, tiadiazolilgrupa, benzotiazolilgrupa, oksazolilgrupa, oksadiazolilgrupa, benzoksazolilgrupa, benzoksadiazolilgrupa, izoksazolilgrupa, izotiazolilgrupa, indolilgrupa, azaindolilgrupa, 2,3-dihidroindolilgrupa, izoindolilgrupa, indazolilgrupa, benzofuranilgrupa, benzotiofenilgrupa, benzimidazolilgrupa, imidazopiridinilgrupa, purinilgrupa, benzotriazolilgrupa, oksazolinilgrupa, izoksazolinilgrupa, tiazolinilgrupa, pirolidinilgrupa, pirazolinilgrupa, morfolinilgrupa, piperidinilgrupa, piperazinilgrupa, piranilgrupa, dioksozinilgrupa, 2,3-dihidro-1,4-benzoksazinilgrupa, 1,3-benzdioksolilgrupa, ciklopropilgrupa, ciklobutilgrupa, azetidilgrupa, ciklopentilgrupa, cikloheksilgrupa, cikloheptilgrupa vai piranilgrupa, kuras katra ir eventuāli aizvietota neatkarīgi ar 1 līdz 5 aizvietotajiem R¹⁵.

6. Savienojums ar formulu (II):



II

vai tā stereozomērs, tautomērs, solvāts vai farmaceutiski pieņēmais sāls, kurā

A¹ un A² katrs neatkarīgi ir N vai CR⁹, ar nosacījumu, ka vismaz viens no A¹ un A² ir N;

B¹, B², B³ un B⁴ katrs neatkarīgi ir N vai CR⁵ ar nosacījumu, ka ne vairāk kā divi no B¹, B², B³ un B⁴ ir N;

C¹ ir CH;

D¹ ir N;

D² ir CR¹², kurā R¹² ir H, halogēna atoms, NO₂, CN, C₁₋₁₀alkilgrupa vai C₁₋₁₀alkoksilgrupa;

L¹ ir NH, O vai S;

L² ir NH;

R¹ ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, acetilgrupa, C₁₋₁₀alkilgrupa vai NHR¹⁵;

R², R³ un R⁴ katrs neatkarīgi ir H, halogēna atoms, C₁₋₁₀alkilgrupa vai C₁₋₁₀alkoksilgrupa;

R⁵ ir neatkarīgi SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, COOR¹⁵, OC(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁵), OC(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂R¹⁴, NR¹⁵S(O)₂R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁵R¹⁵ vai R¹⁵;

R⁶ ir R¹⁴;

R⁷ un R⁸, ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli saturošu 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlētus no O, N vai S, un gredzens eventuāli ir aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 4 aizvietotajiem R¹³ vai R¹⁵;

R⁹ ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵ vai R¹⁵;

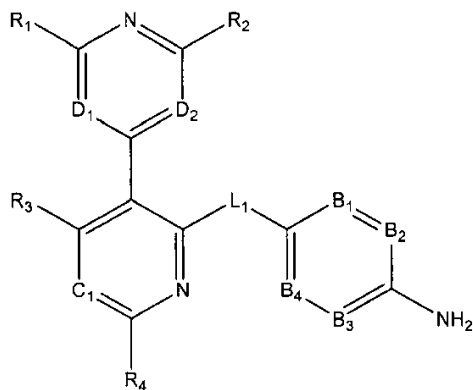
R¹³ ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, OC(O)R¹⁴, OC(O)R¹⁵, COOR¹⁴, COOR¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁴), NR¹⁵(COOR¹⁵), NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂R¹⁴, NR¹⁵S(O)₂R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ vai NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵;

R¹⁴ ir daļēji vai pilnībā piesātināta vai pilnībā nepiesātināta 5- līdz 8-locekļu monocikliska, 6- līdz 12-locekļu bicikliska vai 7- līdz 14-locekļu tricikliska gredzenu sistēma, turklāt no oglekļa atomiem veidotā gredzenu sistēma eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, ja ir monocikliska sistēma, 1 līdz 6 heteroatomus, ja ir bicikliska sistēma, vai 1 līdz 9 heteroatomus, ja ir tricikliska sistēma, heteroatomi ir izvēlēti no O, N vai S, turklāt katra gredzēna 0, 1, 2 vai 3 atomi ir eventuāli aizvietoti neatkarīgi ar 1 līdz 5 aizvietotajiem R¹⁵; un R¹⁵ ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, halogēnalkoksilgrupa, oksogrūpa, CN, OH, SH, NO₂, NH₂, acetilgrūpa, C₁₋₁₀alkilgrūpa, C₂₋₁₀alkenilgrūpa, C₂₋₁₀alkinilgrūpa, C₃₋₁₀cikloalkilgrūpa, C₄₋₁₀cikloalkenilgrūpa, C₁₋₁₀alkilamino-, C₁₋₁₀dialkilamino-, C₁₋₁₀alkoksilgrūpa, C₁₋₁₀tioalkoksilgrūpa vai piesātināta vai daļēji vai pilnībā nepiesātināta 5- līdz 8-locekļu monocikliska, 6- līdz 12-locekļu bicikliska vai 7- līdz 14-locekļu tricikliska gredzenu sistēma, turklāt minētā no oglekļa atomiem veidotā gredzenu sistēma eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, ja ir monocikliska sistēma, 1 līdz 6 heteroatomus, ja ir bicikliska sistēma, vai 1 līdz 9 heteroatomus, ja ir tricikliska sistēma, turklāt minētie heteroatomi ir izvēlēti no O, N vai S, turklāt katra no C₁₋₁₀alkilgrupas, C₂₋₁₀alkenilgrupas, C₂₋₁₀alkinilgrupas, C₃₋₁₀cikloalkilgrupas, C₄₋₁₀cikloalkenilgrupas, C₁₋₁₀alkilamino-, C₁₋₁₀dialkilamino-, C₁₋₁₀alkoksilgrupas, C₁₋₁₀tioalkoksilgrupas un minētās gredzenu sistēmas gredzens ir eventuāli aizvietota(-s) neatkarīgi ar 1 līdz 5 aizvietotajiem no halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, CN, NO₂, NH₂, OH, oksogrūpas, metilgrupas, metoksilgrupas, etilgrupas, etoksilgrupas, propilgrupas, propoksilgrupas, izopropilgrupas, ciklopropilgrupas, butilgrupas, izobutilgrupas, *tert*-butilgrupas, metilamīngrupas, dimetilamīngrupas, etilamīngrupas, dietilamīngrupas, propilamīngrupas, izopropilamīngrupas, dipropilamīngrupas, diizopropilamīngrupas, benzilgrupas vai fenilgrupas.

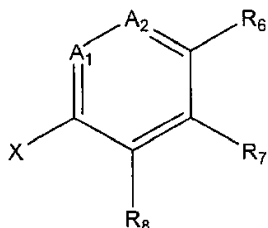
7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kurā

R³ un R⁴ katrs neatkarīgi ir H.

8. Metode savienojuma saskaņā ar 1. vai 6. pretenziju iegūšanai, turklāt metode ietver soli, kurā savienojums ar formulu (A)

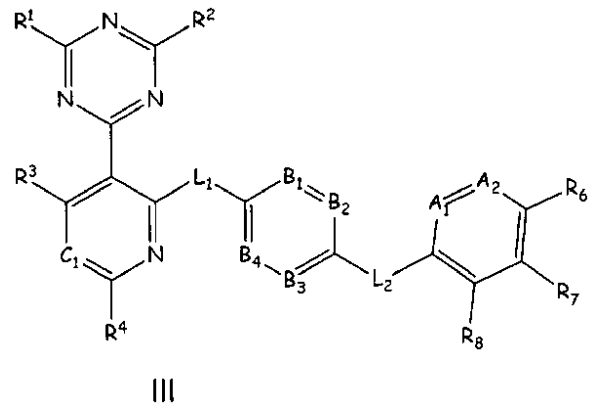


tiek pakļauts reakcijai ar savienojumu ar formulu (B)



turklāt B₁, B₂, B₃, B₄, C₁, D₁, D₂, L₁, R₁, R₂, R₃ un R₄ savienojumā ar formulu (A) un A₁, A₂ un R₆, R₇ un R₈ savienojumā ar formulu (B) ir, kā definēts 1. vai 6. pretenzijā, un X ir halogēna atoms, lai iegūtu savienojumu ar formulu (II).

9. Savienojums ar formulu (III):



vai tā stereoizomērs, tautomērs, solvāts vai farmaceitiski pieņemams sāls, kurā

A¹ un A² katrs neatkarīgi ir N vai CR⁹, ar nosacījumu, ka vismaz viens no A¹ un A² ir N;

B¹, B², B³ un B⁴ katrs neatkarīgi ir N vai CR⁵, ar nosacījumu, ka ne vairāk kā divi no B¹, B², B³ un B⁴ ir N;

C¹ ir N vai CR¹⁰;

L¹ ir O, S, C(O), S(O), SO₂ vai CR³R³;

L² ir NR³, O, S vai CR³R³;

R¹ ir OR¹⁴, SR¹⁴, OR¹⁵, SR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, (CHR¹⁵)_nR¹⁴, (CHR¹⁵)_nR¹⁵ vai R¹⁵;

alternatīvi, R¹ un R¹¹, ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlēti no O, N un S, un gredzens ir eventuāli aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 3 aizvietotajiem R¹⁵, SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, OC(O)R¹⁵, COOR¹⁵, C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁴R¹⁵ vai NR¹⁵R¹⁵;

R² ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, COOR¹⁵, OC(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁵), OC(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ vai R¹⁵;

R³ un R⁴ katrs neatkarīgi ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵ vai R¹⁵;

katrs R⁵ neatkarīgi ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, COOR¹⁵, OC(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁵), OC(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁵R¹⁵ vai R¹⁵;

R⁶ ir R¹⁴;

R⁷ un R⁸ katrs neatkarīgi ir R¹³, R¹⁴ vai R¹⁵;

alternatīvi, R⁷ un R⁸, abi ņemti kopā ar oglekļa atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, veido pilnībā piesātinātu vai daļēji vai pilnībā nepiesātinātu 5- vai 6-locekļu oglekļa atomu gredzenu, eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, izvēlēti no O, N vai S, un gredzens eventuāli ir aizvietots neatkarīgi ar 1 līdz 4 aizvietotajiem R¹³, R¹⁴ vai R¹⁵;

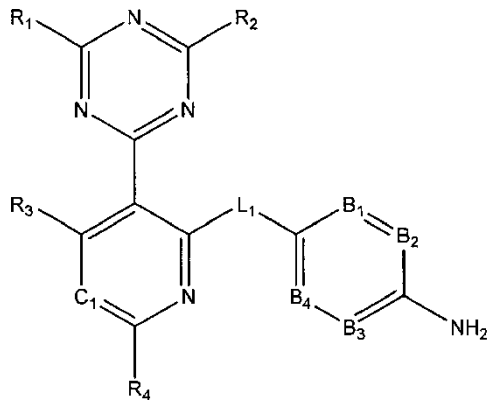
R⁹, R¹⁰, R¹¹ un R¹² katrs neatkarīgi ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵ vai R¹⁵;

R¹³ ir SR¹⁴, OR¹⁴, SR¹⁵, OR¹⁵, NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵R¹⁵, C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁵, OC(O)R¹⁴, OC(O)R¹⁵, COOR¹⁴, COOR¹⁵, C(O)NR¹⁴R¹⁵, C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)R¹⁴, NR¹⁵C(O)R¹⁵, C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)R¹⁵, NR¹⁵(COOR¹⁴), NR¹⁵(COOR¹⁵), NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵C(O)C(O)NR¹⁵R¹⁵, S(O)₂R¹⁴, S(O)₂R¹⁵, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵, NR¹⁵S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ vai NR¹⁵S(O)₂NR¹⁵R¹⁵;

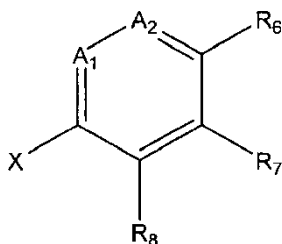
R¹⁴ ir daļēji vai pilnībā piesātināta vai pilnībā nepiesātināta 5- līdz 8-locekļu monocikliska, 6- līdz 12-locekļu bicikliska vai 7- līdz 14-locekļu tricikliska gredzenu sistēma, turklāt no oglekļa atomiem veidotā gredzenu sistēma eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, ja ir monocikliska sistēma, 1 līdz 6 heteroatomus, ja ir bicikliska sistēma, vai 1 līdz 9 heteroatomus, ja ir tricikliska sistēma, heteroatomi ir izvēlēti no O, N vai S, turklāt katra gredzēna 0, 1, 2 vai

3 atomi ir eventuāli aizvietoti neatkarīgi ar 1 līdz 3 aizvietotājiem R¹⁵; R¹⁵ ir H, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, halogēnalkoksilgrupa, oksogrūpa, CN, OH, SH, NO₂, NH₂, acetilgrūpa, C₁₋₁₀ alkilgrūpa, C₂₋₁₀ alkenilgrūpa, C₂₋₁₀ alkinilgrūpa, C₃₋₁₀ cikloalkilgrūpa, C₄₋₁₀ cikloalkenilgrūpa, C₁₋₁₀ alkilamino-, C₁₋₁₀ dialkilamino-, C₁₋₁₀ alkoksilgrūpa, C₁₋₁₀ tioalkoksilgrūpa vai piesātināta vai daļēji vai pilnībā nepiesātināta 5- līdz 8-locekļu monocikliska, 6- līdz 12-locekļu bicikliska vai 7- līdz 14-locekļu tricikliska gredzenu sistēma, turklāt minētā no oglekļa atomiem veidotā gredzenu sistēma eventuāli satur 1 līdz 3 heteroatomus, ja ir monocikliska sistēma, 1 līdz 6 heteroatomus, ja ir bicikliska sistēma, vai 1 līdz 9 heteroatomus, ja ir tricikliska sistēma, turklāt minētie heteroatomi ir izvēlēti no O, N vai S, turklāt katra no C₁₋₁₀ alkilgrupas, C₂₋₁₀ alkenilgrupas, C₂₋₁₀ alkinilgrupas, C₃₋₁₀ cikloalkilgrupas, C₄₋₁₀ cikloalkenilgrupas, C₁₋₁₀ alkilamino-, C₁₋₁₀ dialkilamino-, C₁₋₁₀ alkoksilgrupas, C₁₋₁₀ tioalkoksilgrupas un minētās gredzenu sistēmas gredzens ir eventuāli aizvietota(-s) neatkarīgi ar 1 līdz 5 aizvietotājiem no halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, CN, NO₂, NH₂, OH, oksogrūpas, metilgrupas, metoksilgrupas, etilgrupas, etoksilgrupas, propilgrupas, propoksilgrupas, izopropilgrupas, ciklopropilgrupas, butilgrupas, izobutilgrupas, *tert*-butilgrupas, metilamīngrupas, dimetilamīngrupas, etilamīngrupas, dietilamīngrupas, propilamīngrupas, izopropilamīngrupas, dipropilamīngrupas, diizopropilamīngrupas, benzilgrupas vai fenilgrupas; un n ir 0, 1, 2, 3 vai 4.

10. Metode savienojuma saskaņā ar 9. pretenziju iegūšanai, turklāt metode ietver soli, kurā savienojums ar formulu (A')



tiek pakļauts reakcijai ar savienojumu ar formulu (B)



turklāt B₁, B₂, B₃, B₄, C₁, L₁, R₁, R₂, R₃ un R₄ savienojumā ar formulu (A') un A₁, A₂ un R₆, R₇ un R₈ savienojumā ar formulu (B) ir, kā definēts 9. pretenzijā, un X ir halogēna atoms, lai iegūtu savienojumu ar formulu (III).

11. Savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas ir izvēlēts no:

'2-(4-((3-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)amino)-1-ftalazinil)fenil)etanola,
'4-fenil-N-(6-((3-((2-((3-((1-piperidinil)propil)amino)-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-1-ftalazīnamīna,
'N-(4-((3-((2-((3-((4-metil-1-piperazinil)propil)amino)-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(6-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,
'4-(6-metil-2-piridinil)-N-(4-((3-((2-((3-((1-piperazinil)propil)amino)-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-1-ftalazīnamīna,
'N-(4-((3-((5-fluor-2-((3-((4-metil-1-piperazinil)propil)amino)-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna,
'N-(4-((3-((3-amino-1H-pirazol-4-il)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(4-metilfenil)-1-ftalazīnamīna,
'N-(4-((3-((3-amino-1H-pirazol-4-il)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(fenilmetil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((3-amino-1H-pirazol-4-il)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenil-tieno[2,3-d]piridazīn-7-amīna,

'N-(4-((3-((3-amino-1H-pirazol-4-il)-2-piridinil)oksi)-3-fluorfenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna un

'N-(4-((3-((2-((3-((2S,5S)-2,5-dimetil-4-morfolinil)propil)amino)-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas ir izvēlēts no:

'N-(5-((3-((2-(metilamino)-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-2-piridinil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenilfuro[2,3-d]piridazīn-7-amīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(3-metil-5-izotiazolil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(2,6-bis(metiloksi)fenil)-1-ftalazīnamīna,

'(1R)-1-(4-((4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)amino)-1-ftalazinil)fenil)etanola,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4,5-dimetil-6-(4-metil-2-tienil)-3-piridazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenil-1-izohinolīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-izohinolīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(6-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-cikloheksil-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(3-fluor-1-piperidinil)-1-ftalazīnamīna,

'4-(2-((4-((4-fenil-1-ftalazinil)amino)fenil)oksi)-3-piridinil)-1,3-dihidro-2H-pirol[2,3-b]piridin-2-ona,

'4-(4-metil-1,3-tiazol-2-il)-N-(4-((3-((5,6,7,8-tetrahydro-1,8-naftiridin-4-il)-2-piridinil)oksi)fenil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2,3-dihidro-1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna,

'N-(6-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(5-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(6-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(3-(metilsulfonil)fenil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(6-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-ftalazīnamīna,

'1-(4-((4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)amino)-1-ftalazinil)-3-piperidinola,

'2-(4-((6-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)amino)-1-ftalazinil)fenola,

N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(5-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,

'2-((4-((4-((4-metil-2-tienil)-1-ftalazinil)amino)fenil)oksi)-3,4'-dipiridīn-2'-amīna,

'2-((4-((4-etil-6-fenil-3-piridazinil)amino)fenil)oksi)-3,4'-dipiridīn-2'-amīna,

'2-((4-((4-metil-6-(4-metil-1,3-tiazol-2-il)-3-piridazinil)amino)fenil)oksi)-3,4'-dipiridīn-2'-amīna,

'2-((4-((4-((2-(metiloksi)fenil)-1-ftalazinil)amino)fenil)oksi)-3,4'-dipiridīn-2'-amīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-6-fenil-4-propil-3-piridazīnamīna un

'N-(4-((2-(metiloksi)-6-(4-piridinil)fenil)oksi)fenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna.

13. Savienojums saskaņā ar 1. vai 12. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas ir izvēlēts no:

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(3-metil-5-izotiazolil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(2,6-bis(metiloksi)fenil)-1-ftalazīnamīna,

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(6-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna un

'N-(4-((3-((2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-cikloheksil-1-ftalazīnamīna.

14. Savienojums saskaņā ar 1. vai 12. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas ir izvēlēts no:

N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(3-fluor-1-piperidinil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2,3-dihidro-1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna,
 N-(6-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(5-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(6-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(3-(metilsulfonyl)fenil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(6-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(5-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-6-fenil-4-propil-3-piridazīnamīna un
 N-(4-((2-(metiloksi)-6-(4-piridinil)fenil)oksi)fenil)-4-fenil-1-ftalazīnamīna.

15. Savienojums saskaņā ar 1. vai 12. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kas ir izvēlēts no:

N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(3-metil-5-izotiazolil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(2,6-bis(metiloksi)fenil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(6-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-cikloheksil-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(3-fluor-1-piperidinil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(6-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(5-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(6-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(3-(metilsulfonyl)fenil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(6-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)-3-piridinil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-ftalazīnamīna,
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(4-metil-2-tienil)-1-ftalazīnamīna un
 N-(4-((3-(2-amino-4-pirimidinil)-2-piridinil)oksi)fenil)-4-(5-metil-2-piridinil)-1-ftalazīnamīna.

16. Medikaments, kas satur savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai efektīvas devas daudzumu un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai lietošanai solīda audzēja izmēra samazināšanai vai lietošanai vēža, hematoloģiska audzēja vai traucētas šūnu proliferācijas ārstēšanā cilvēkam.

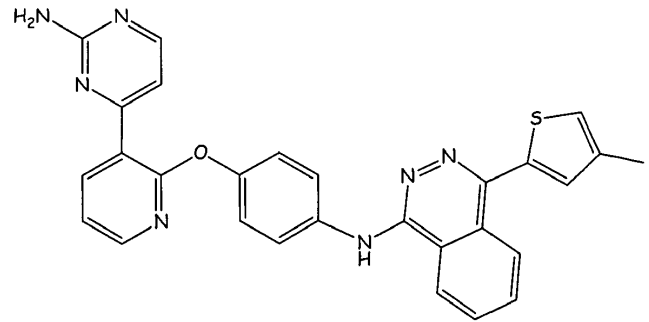
18. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 9. pretenzijas un no 11. līdz 15. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanai solīda audzēja izmēra samazināšanai vai lietošanai vēža, hematoloģiska audzēja vai traucētas šūnu proliferācijas ārstēšanā cilvēkam.

19. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 9. pretenzijas un no 11. līdz 15. pretenzijai lietošanai viena vai vairāku no (a) solīda vai hematoloģiskas izcelsmes audzēja, izvēlēta no urīnpūšļa, krūts, resnās zarnas, nieru, aknu, plaušu, sīkšņu plaušu vēža, barības vada, žultspūšļa, olnīcu, aizkuņģa dziedzera, kuņģa, dzemdes kakla, vairogdziedzera, prostatas un ādas vēža, (b) limfoīdas izcelsmes hematopoētiskās sistēmas audzēja, izvēlēta no leikozes, akūtas limfātiskas leikozes, akūtas limfoblastiskas leikozes, B šūnu limfomas, T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas, ne-Hodžkina limfomas, mataino šūnu limfomas un Bērķita limfomas, (c) mieloīdas izcelsmes hematopoētiskās sistēmas audzēja, izvēlēta no akūtas un hroniskas mielogēnas leikozes, mielodisplastiskā sindroma un promielocītiskas leikozes (d) mezenhimālas izcelsmes audzēja, izvēlēta no fibrosarkomas un rābdiosarkomas, (e) centrālās un perifērās nervu sistēmas audzēja, izvēlēta no astrocitomas, neiroblastomas, gliomas un švannomas vai (f) melanomas, seminomas, teratokarcinomas, osteosarkomas, pigmentētās kserodermas, keratoakantomas, folikulāra vairogdziedzera vēža vai KAPOŠI sarkomas ārstēšanā.

20. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 9. pretenzijas un no 11. līdz 15. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanai viena vai vairāku no (a) solīda vai hematoloģiskas

izcelsmes audzēja, izvēlēta no urīnpūšļa, krūts, resnās zarnas, nieru, aknu, plaušu, sīkšņu plaušu vēža, barības vada, žultspūšļa, olnīcu, aizkuņģa dziedzera, kuņģa, dzemdes kakla, vairogdziedzera, prostatas un ādas vēža, (b) limfoīdas izcelsmes hematopoētiskās sistēmas audzēja, izvēlēta no leikozes, akūtas limfātiskas leikozes, akūtas limfoblastiskas leikozes, B šūnu limfomas, T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas, ne-Hodžkina limfomas, mataino šūnu limfomas un Bērķita limfomas, (c) mieloīdas izcelsmes hematopoētiskās sistēmas audzēja, izvēlēta no akūtas un hroniskas mielogēnas leikozes, mielodisplastiskā sindroma un promielocītiskas leikozes (d) mezenhimālas izcelsmes audzēja, izvēlēta no fibrosarkomas un rābdiosarkomas, (e) centrālās un perifērās nervu sistēmas audzēja, izvēlēta no astrocitomas, neiroblastomas, gliomas un švannomas vai (f) melanomas, seminomas, teratokarcinomas, osteosarkomas, pigmentētās kserodermas, keratoakantomas, folikulāra vairogdziedzera vēža vai KAPOŠI sarkomas ārstēšanai.

21. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 12., 14. un 15. pretenzijas ar ķīmisko struktūrformulu:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

22. Savienojuma saskaņā ar 21. pretenziju farmaceutiski pieņemama sāls forma.

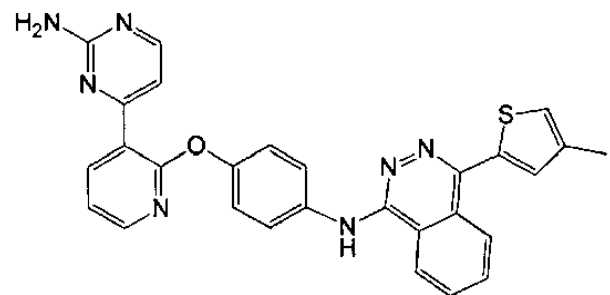
23. Savienojums saskaņā ar 22. pretenziju, turklāt farmaceutiski pieņemamā sāls forma ir sulfonskābes sāls forma, izvēlēta no metānsulfonskābes sāls, etānsulfonskābes sāls, etāndisulfonskābes sāls, benzolsulfonskābes sāls, hidroksietānsulfonskābes sāls vai toluolsulfonskābes sāls.

24. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 21. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu palīgvielu.

25. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. un no 21. līdz 23. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu palīgvielu.

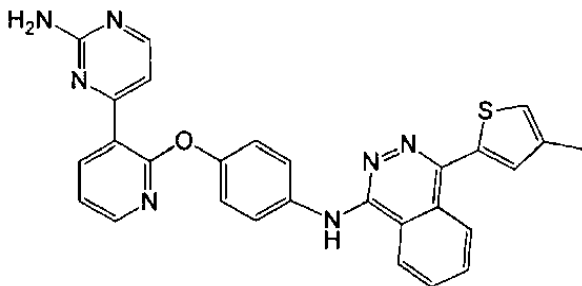
26. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 21. līdz 23. pretenzijai lietošanai viena vai vairāku vēžu, izvēlētu urīnpūšļa vēža, krūts vēža, resnās zarnas vēža, nieru vēža, aknu vēža, plaušu vēža, barības vada vēža, žultspūšļa vēža, olnīcu vēža, aizkuņģa dziedzera vēža, kuņģa vēža, dzemdes kakla vēža, vairogdziedzera vēža, prostatas vēža un ādas vēža ārstēšanā.

27. Medikaments, kas satur efektīvas devas daudzumu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 12., 14. un 15. pretenzijas ar struktūrformulu:



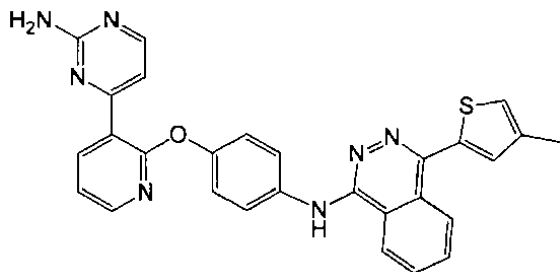
vai tā farmaceutiski pieņemama sāls un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

28. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 12., 14. un 15. pretenzijas ar struktūrformulu:



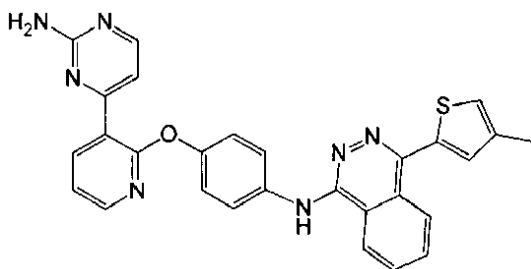
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai viena vai vairāku no (a) limfoīdas izcelsmes hematopoētiskās sistēmas audzēja, izvēlēta no leikozes, akūtas limfātiskas leikozes, akūtas limfoblastiskas leikozes, B šūnu limfomas, T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas, ne-Hodžkina limfomas, mataino šūnu limfomas un Bērķita limfomas vai (b) mieloīdas izcelsmes hematopoētiskās sistēmas audzēja, izvēlēta no akūtas un hroniskas mielogēnas leikozes, mielodisplastiskā sindroma un promielocītiskas leikozes ārstēšanā.

29. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 12., 14. un 15. pretenzijas ar struktūrformulu:



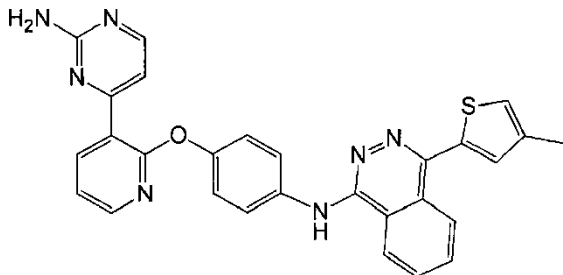
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai saskaņā ar 29. pretenziju vienas vai vairāku no (a) akūtas mielogēnas leikozes (AML), hroniskas mielogēnas leikozes (HML), akūtas limfātiskas leikozes (ALL), B šūnu limfomas, T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas, ne-Hodžkina limfomas vai mielodisplastiskā sindroma (MDS) ārstēšanā.

30. Savienojums ar struktūrformulu:

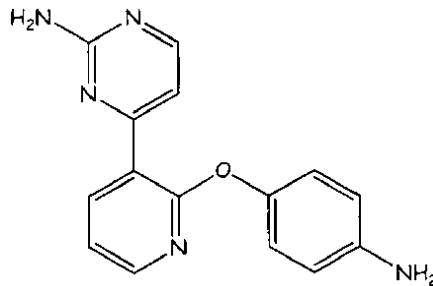


vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai saskaņā ar 29. pretenziju B šūnu limfomas, T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas un ne-Hodžkina limfomas ārstēšanā.

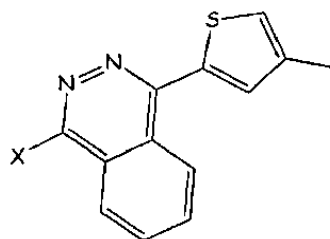
31. Metode savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, 12., 14. un 15. pretenzijas ar struktūrformulu



vai tā farmaceutiski pieņemama sāls iegūšanai, turklāt metode ietver soli, kurā savienojums

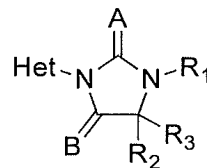


tiek pakļauts reakcijai ar savienojumu



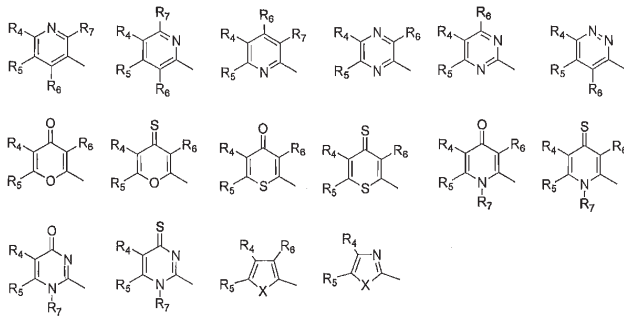
kurā X ir halogēna atoms.

- (51) **A61K 31/4166**^(2006.01) (11) **2004181**
A61K 31/4178^(2006.01)
A61K 31/4439^(2006.01)
C07D 233/86^(2006.01)
C07D 401/04^(2006.01)
- (21) 07754060.7 (22) 27.03.2007
(43) 24.12.2008
(45) 24.02.2016
(31) 785978 P (32) 27.03.2006 (33) US
833790 P 28.07.2006 US
(86) PCT/US2007/007485 27.03.2007
(87) WO2007/126765 08.11.2007
(73) THE REGENTS OF THE UNIVERSITY OF CALIFORNIA,
1111 Franklin Street, 12th Floor, Oakland CA 94607-5200,
US
(72) JUNG, Michael, E., US
SAWYERS, Charles, L., US
OUK, Samedy, US
TRAN, Chris, US
WONGVIPAT, John, US
(74) Campbell, Patrick John Henry, J A Kemp, 14 South Square,
Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA,
Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
(54) **ANDROĢĒNU RECEPTORA MODULATORS PROSTATAS
VĒŽA UN AR ANDROĢĒNU RECEPTORU SAISTĪTU
SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**
**ANDROGEN RECEPTOR MODULATOR FOR THE
TREATMENT OF PROSTATE CANCER AND ANDROGEN
RECEPTOR-ASSOCIATED DISEASES**
(57) 1. Savienojums saskaņā ar formulu (II):



Formula II

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls,
turklāt Het ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:



kur R₄, R₅, R₆ un R₇ ir neatkarīgi izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, aizvietotas alkilgrupas, alkenilgrupas, aizvietotas alkenilgrupas, alkinilgrupas, aizvietotas alkinilgrupas, arilgrupas, aizvietotas arilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkenilgrupas, arilalkinilgrupas, halogēnaizvietotas alkilgrupas, halogēnaizvietotas alkenilgrupas, halogēnaizvietotas alkinilgrupas, halogēna atoms, CN, NO₂, OR₁₁, SR₁₁, NR₁₁, R₁₂, NH(CO)OR₁₁, NH(CO)NR₁₁, R₁₂, NR₁₂(CO)R₁₁, O(CO)R₁₁, O(CO)OR₁₁, O(CS)R₁₁, NR₁₂(CS)R₁₁, NR₁₂(CO)NR₁₁, R₁₂, NR₁₂(CS)OR₁₁ grupas, kur jebkurš no R₄, R₅, R₆ un R₇ var būt savienots ar blakusesojo R₄, R₅, R₆ un R₇, veidojot ciklu, kas var būt aromātisks, aizvietots aromātisks, heterociklisks aromātisks vai nearomātisks, aizvietots heterociklisks aromātisks vai nearomātisks, cikloalkilgrupa vai aizvietota cikloalkilgrupa,

kur X ir izvēlēts no sēra, skābekļa atoma un NR₈ grupas un kur R₈ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, aizvietotas alkilgrupas, alkenilgrupas, aizvietotas alkenilgrupas, alkinilgrupas, aizvietotas alkinilgrupas, arilgrupas, aizvietotas arilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkenilgrupas, arilalkinilgrupas, halogēnaizvietotas alkilgrupas, halogēnaizvietotas alkenilgrupas, halogēnaizvietotas alkinilgrupas, halogēna atoms, (CO)R₁₁, (CO)OR₁₁, (CS)R₁₁ un (CS)OR₁₁ grupas; un turklāt:

A ir sēra atoms un B ir skābekļa atoms;
R₁₁ un R₁₂ ir neatkarīgi izvēlēti no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, aizvietotas alkilgrupas, alkenilgrupas vai aizvietotas alkenilgrupas, alkinilgrupas vai aizvietotas alkinilgrupas, arilgrupas, aizvietotas arilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkenilgrupas, arilalkinilgrupas, heterocikliskas aromātiskas vai nearomātiskas grupas vai aizvietotas heterocikliskas aromātiskas vai nearomātiskas grupas, vai R₁₁ un R₁₂ var būt savienoti, veidojot ciklu, kas var būt heterociklisks aromātisks vai nearomātisks, vai aizvietots heterociklisks aromātisks,

R₁ ir izvēlēts no arilgrupas un aizvietotas arilgrupas;
R₂ un R₃ ir neatkarīgi izvēlēti no ūdeņraža atoma, arilgrupas, alkilgrupas, aizvietotas alkilgrupas, alkenilgrupas, aizvietotas alkenilgrupas, alkinilgrupas, aizvietotas alkinilgrupas, halogēnaizvietotas alkilgrupas, halogēnaizvietotas alkenilgrupas, halogēnaizvietotas alkinilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkenilgrupas, arilalkinilgrupas, heterocikliskas aromātiskas vai nearomātiskas grupas, aizvietotas heterocikliskas aromātiskas vai nearomātiskas grupas, cikloalkilgrupas vai aizvietotas cikloalkilgrupas;

katra aizvietota alkilgrupa ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no hidroksilgrupas, broma atoma, fluora atoma, hlora atoma, joda atoma, merkaptogrupas jeb tiolgrupas, ciāngrupas, alkiltiogrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, karboksilgrupas, karbalkoilgrupas, alkilgrupas, alkenilgrupas, nitrogrupas, aminogrupas, alkoksilgrupas un amīdgrupas;

katra aizvietota cikloalkilgrupa, aizvietota alkenilgrupa vai aizvietota alkinilgrupa ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, alkilgrupas, alkoksilgrupas, hidroksilgrupas, arilgrupas, ariloksilgrupas, arilalkilgrupas, cikloalkilgrupas, alkilamidogrupas, alkanolaminogrupas, oksogrupas, acilgrupas, arilkarbonilaminogrupas, aminogrupas, nitrogrupas, ciāngrupas, tiolgrupas, alkiltiogrupas, broma atoma, fluora atoma, hlora atoma, joda atoma, merkaptogrupas, heterocikliskas grupas, heteroarilgrupas, karboksilgrupas, karbalkoilgrupas, alkenilgrupas un amīdgrupas; katra aizvietota arilalkilgrupa, aizvietota arilalkenilgrupa vai aizvietota arilalkinilgrupa ir aizvietota arilgrupas daļā ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, alkilgrupas, alkoksilgrupas, hidroksilgrupas, arilgrupas, ariloksilgrupas, arilalkilgrupas, cikloalkilgrupas, alkilamidogrupas, alkanolaminogrupas,

oksogrupas, acilgrupas, arilkarbonilaminogrupas, aminogrupas, nitrogrupas, ciāngrupas, tiolgrupas, alkiltiogrupas, broma atoma, fluora atoma, hlora atoma, joda atoma, merkaptogrupas, heterociklilgrupas, heteroarilgrupas, karboksilgrupas, karbalkoilgrupas, alkenilgrupas vai amīdgrupas;

katra aizvietota arilgrupa vai aizvietota aromātiska grupa ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, alkoksilgrupas, halogēnalkoksilgrupas, alkenilgrupas, trifluormetilgrupas, trifluormetoksilgrupas, alkinilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkilalkilgrupas, cikloheteroalkilgrupas, cikloheteroalkilalkilgrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, arilalkilgrupas, ariloksilgrupas, ariloksialkilgrupas, arilalkoksilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, arilkarbonilgrupas, arilalkenilgrupas, aminokarbonilgrupas, ariltiogrupas, arilsulfonilgrupas, arilazogrupas, heteroarilalkilgrupas, heteroarilalkenilgrupas, heteroarilheteroarilgrupas, heteroariloksilgrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, ciāngrupas, aminogrupas, aizvietotas aminogrupas, karbamoilgrupas, alkilkarbamoilgrupas, amidētas karboksilgrupas, amidētas karboksialkilgrupas, tiolgrupas, alkiltiogrupas, ariltiogrupas, heteroariltiogrupas, ariltioalkilgrupas, alkoksiariltiogrupas, alkilkarbonilgrupas, arilkarbonilgrupas, alkilaminokarbonilgrupas, arilaminokarbonilgrupas, arilaminokarbonilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, alkilkarboniloksilgrupas, arilkarboniloksilgrupas, alkilkarbonilaminogrupas, arilkarbonilaminogrupas, arilsulfonilgrupas, arilsulfonilalkilgrupas, arilsulfonilaminogrupas, arilsulfonaminokarbonilgrupas, broma atoma, fluora atoma, hlora atoma, joda atoma, merkaptogrupas jeb tiolgrupas, heterociklilgrupas, karboksilgrupas, karbalkoilgrupas, alkoksilgrupas un amīdgrupas;

katra aizvietota heteroarilgrupa vai aizvietota heterocikliska aromātiska grupa ir aizvietota ar vienu līdz četriem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, alkilgrupas, alkoksilgrupas, hidroksilgrupas, arilgrupas, ariloksilgrupas, arilalkilgrupas, cikloalkilgrupas, alkilamidogrupas, alkanolaminogrupas, oksogrupas, acilgrupas, arilkarbonilaminogrupas, aminogrupas, nitrogrupas, ciāngrupas, tiolgrupas, alkiltiogrupas, broma atoma, fluora atoma, hlora atoma, joda atoma, merkaptogrupas, heterociklilgrupas, heteroarilgrupas, karboksilgrupas, karbalkoilgrupas, alkenilgrupas un amīdgrupas; un katrai aizvietotai aminogrupai ir 1 vai 2 aizvietotāji, kas neatkarīgi izvēlēti no alkilgrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, arilalkilgrupas, ariloksilgrupas, ariloksialkilgrupas, arilalkoksilgrupas, arilkarbonilgrupas, arilalkenilgrupas, arilalkinilgrupas, aminokarbonilgrupas, ariltiogrupas, arilsulfonilgrupas, arilazogrupas, heteroarilalkilgrupas, heteroarilalkenilgrupas, heteroarilheteroarilgrupas, heteroariloksilgrupas, heteroariltiogrupas, ariltioalkilgrupas, alkoksiariltiogrupas, arilaminokarbonilgrupas, arilkarboniloksilgrupas, arilkarbonilaminogrupas, arilsulfonilgrupas, arilsulfonilalkilgrupas, arilsulfonilaminogrupas un arilsulfonaminokarbonilgrupas.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, turklāt:

- (a) R₁ ir arilgrupa, aizvietota ar vismaz vienu fluora atomu; vai
- (b) R₂ un R₃ ir neatkarīgi izvēlēti no grupas, kas sastāv no metilgrupas, etilgrupas, ciklopropilgrupas, ciklobutilgrupas, ciklopentilgrupas, cikloheksilgrupas, fluormetilgrupas, hlormetilgrupas un brommetilgrupas.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, turklāt R₄ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no CN un NO₂ grupas, turklāt R₅ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no trifluormetilgrupas, halogēnaizvietotas alkilgrupas, halogēnaizvietotas alkenilgrupas, halogēnaizvietotas alkinilgrupas un halogēna atoma, un turklāt R₆ un R₇ ir neatkarīgi izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas un vai halogēna atoma.

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, turklāt R₅ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no trifluormetilgrupas un joda atoma, un turklāt R₆ un R₇ ir neatkarīgi izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma un halogēna atoma.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls lietošanai par medikamentu.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls lietošanai ārstēšanas paņēmienā, lai ārstētu slimību vai veselības traucējumu, kas saistīts ar kodola receptora aktivitāti vai hiperproliferatīvu veselības traucējumu, vai

prostatas vēzi, vai hormonjutīgu prostatas vēzi vai ar hormoniem grūti ārstējamu prostatas vēzi.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, turklāt savienojums tiek ievadīts ar intravenozu injekciju, ar injekciju audos, intraperitoneāli, perorāli vai nazāli.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas ir zāļu formā, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no šķīduma, dispersijas, suspensijas, pulvera, kapsulas, tabletes, zirnīša, ilgstošas iedarbības kapsulas, ilgstošas iedarbības tabletes un ilgstošas iedarbības zirnīša.

9. Farmaceutisks sastāvs, kas ietver terapeitiski efektīvu daudzumu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu nesējvielu, atšķaidītāju vai palīgvielu.

10. Farmaceutisks sastāvs saskaņā ar 9. pretenziju lietošanai par medikamentu.

11. Farmaceutisks sastāvs saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju lietošanai slimības vai veselības traucējuma ārstēšanas paņēmienā, turklāt slimība vai veselības traucējums ir saistīts ar kodola receptora aktivitāti vai hiperproliferatīvu veselības traucējumu, vai prostatas vēzi, vai hormonjutīgu prostatas vēzi vai ar hormoniem grūti ārstējamu prostatas vēzi.

12. Farmaceutisks sastāvs saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 11. pretenzijai, turklāt sastāvs tiek ievadīts ar intravenozu injekciju, ar injekciju audos, intraperitoneāli, perorāli vai nazāli.

13. Farmaceutisks sastāvs saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 12. pretenzijai, kas ir zāļu formā, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no šķīduma, dispersijas, suspensijas, pulvera, kapsulas, tabletes, zirnīša, ilgstošas iedarbības kapsulas, ilgstošas iedarbības tabletes un ilgstošas iedarbības zirnīša.

- (51) **B65G 15/14**^(2006.01) (11) **2016010**
- B65G 39/06**^(2006.01)
- (21) 07725039.7 (22) 09.05.2007
- (43) 21.01.2009
- (45) 24.02.2016
- (31) 202006007637 U (32) 11.05.2006 (33) DE
- (86) PCT/EP2007/004117 09.05.2007
- (87) WO2007/131690 22.11.2007
- (73) VHV Anlagenbau GmbH, Dornierstrasse 9, 48477 Hörstel, DE
- (72) VERLAGE, Bernhard, DE
- (74) Bünemann, Egon, et al, Busse & Busse Patentanwälte, Grosshandelsring 6, 49084 Osnabrück, DE
- Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **STĀVA LENĶA LENTES TRANSPORTIERIS BERAMIEM MATERIĀLIEM**
- STEEP ANGLE CONVEYOR FOR BULK MATERIAL**

(57) 1. Stāva lenķa lentes transportieris irdeniem beramiem materiāliem (1), kas satur: pirmo transportiera lenti (3) un otro transportiera lenti (4), kura ir savienota ar minēto pirmo transportiera lenti kā pārklājošā lente, pie kam: beramais materiāls (1), kas tiek padots būtībā centrētā veidā uz pirmās transportiera lentes (3), var tikt satverts starp abām lentēm (3, 4) pārejas zonā (Z), kas transportēšanas virzienā (B) ir izliekta; abas lentes (3, 4) tiek spiestas viena pret otru transversāli attiecībā pret kustīgās daļas plakni (E), lai beramo materiālu (1) transportētu plūsmas virzienā kustības ceļā (F) stāvajā daļā; veltņa korpuss (6) ir uzstādīts pārejas zonā (Z), pie tam veltņa korpuss satver kā transportiera lentes (3) apkrauto pusi, tā pārklājošo lenti (4), kas tiek padota virs minētās transportiera lentes; vismaz viena no lenšu (3, 4) divām pusēm, kuras tiek virzītas cauri, formējot beramo materiālu (1) uztverošo kameru (9) radiālās formēšanas ceļā; veltņa korpuss (6) satur uztverošo zonu (10), kurā pārklājošās lentes (4) daļa ievirzās radiāli uz iekšu caur satverto beramo materiālu (1), pie tam veltņa korpusam (6) ir divi atbalsta cilindri (13, 14), kas ir uzstādīti tā longitudinālās ass (12) virzienā transportēšanas pusē (T) abu malu zonu atbalstīšanai, turklāt minētie atbalsta cilindri veido uztverošo zonu (10), kura uztver transportēšanas puses (T) radiālo formēšanu; veltņa korpuss (6) ir uzstādīts uztverošajā zonā (10) ar vismaz vienu pret darbības elementu (15), kurš nosedz vismaz

daļu no minētās uztverošās zonas un kurš izraisa radiālu atbalsta spēku (G) radiālās formēšanas zonā vismaz uz daudzslāņainās transportēšanas puses (T), kas raksturīgs ar to, ka veltņa korpuss (6) satur vairākus atspere elementus (17, 17'), kas ir izvietoti starp abiem atbalsta cilindriem (13, 14) uztverošajā zonā (10) kā pret darbības elementu (15").

2. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka veltņa korpuss (6) satur uztverošo zonu (10), kuru var regulēt ar atbalsta cilindriem (13, 14), kuri ir pārvietojami longitudinālās ass (12) virzienā (bulta D, D').

3. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka atspere elementi (17), kas ir izveidoti kā spirālatsperes (18), iedarbojas uz atbalsta cilindru (13, 14) attiecīgajiem balstiem, kas ir savienoti ar minētajiem atbalsta cilindriem un ir izgatavoti kā atbalsta gredzeni (19, 20).

4. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka spirālatsperes (18) ir nostiprinātas ar attiecīgām regulēšanas skrūvēm (21), kas iet caur atbalsta gredzenu (19, 20) un, kad pārklājošā lente (4) ir novietota uz tām, ir pārvietojamas pagriežot (bulta Q).

5. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka spirālatsperes (18) ar regulēšanas skrūvēm (21, 30, 32) var tikt nospiestas (bulta H, H') longitudinālā virzienā.

6. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka spirālatsperu (18) balstgredzens (19, 20) mijiedarbojas ar balstuzmavu (25), kas aptver longitudinālo asi (12) un savukārt satur stiprinājumu (27), kas ir uzstādīts spirālatsperes (18) nospiegošanai (bulta H, H').

7. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka stiprinājums (27) ir aprīkots ar sprostplāksni (28), kurai ir vairākas radiāli nobīdītas regulēšanas skrūves (30) un kura balstās uz longitudinālās ass (12) balstīcīņā (29), turklāt sprostplāksne mijiedarbojas ar regulējamu disku (31), kas ir uzmontēts uz kustīgās balstuzmavas (25).

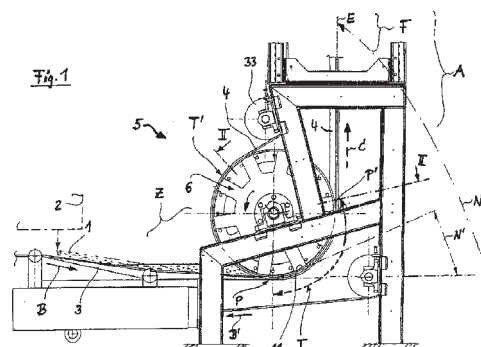
8. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka katrs no atspere elementiem (17'), kas ir uzstādīti kā pret darbības elementi (15"), to galos ir savienots ar sprostplāksnēm (36), kuras satur vismaz vienu nesējāķi (35), un ir izklidēti (dekoncentrēti) spieķu veidā atbalsta cilindra (13, 14) iekšpusē.

9. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka katrā gadījumā divi no nesējāķiem (35) ir savienoti ar vienu no sprostplāksnēm (36) attiecīgi caur starpposma (37) daļu, kas šķēsgriezumā ir U-veida.

10. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka nesējāķis (35) satur uztverošo profilu (42), kas uztver pret darbības elementu (41), kas ir izveidots kā cilpveida vai tam līdzīgs elements tādā veidā, ka veltņa korpusa (6) darba pozīcijā kustību (bulta Q', Q") atspere elementa (17') galā var absorbēt nelielas berzes veidā.

11. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka atbalsta ceļš (S), kas ir piemērots pret darbības elementa (41) rotācijas kustībai, var būt iepriekš noteikts ar uztverošā profila (42) palīdzību.

12. Stāva lenķa lentes transportieris saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka atspere elementa (17') aksiāli un/vai radiāli regulējama balsts ir izveidots sprostplāksnes (36) zonā.



- (51) **C12N 1/20**^(2006.01) (11) **2040722**
A61K 31/22^(2006.01)
A61K 35/74^(2015.01)
C12R 1/225^(2006.01)
- (21) 07748532.4 (22) 30.05.2007
(43) 01.04.2009
(45) 11.11.2015
(31) 446628 (32) 05.06.2006 (33) US
(86) PCT/SE2007/050371 30.05.2007
(87) WO2007/142596 13.12.2007
(73) BIOGAIA AB, Box 3242, 103 64 Stockholm, SE
(72) CONNOLLY, Eamonn, SE
MÖLLSTAM, Bo, SE
(74) Brann AB, P.O. Box 12246, 102 26 Stockholm, SE
Arnolds ZVIRGZDS, Aģentūra ARNOPATENTS, Brīvības
iela 162-17, a/k 13, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **NOTEIKTU PIENSKĀBES BAKTĒRIJU LIETOŠANA
ZĪDAIŅU KOLIKU MAZINĀŠANAI
USE OF SELECTED LACTIC ACID BACTERIA FOR
REDUCING INFANTILE COLIC**
- (57) 1. Metode zīdaiņu koliku mazināšanai derīgu pienskābes
baktēriju celma atlasīšanai, turklāt minētā metode ietver pienskābes
baktēriju celma spējas paaugstināt IL-10 līmeni noteikšanu.
2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pienskābes baktēriju
celms ir derīgs koliku profilaksei un/vai ārstēšanai.
3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver pienskābes
baktēriju celma spējas stimulēt IL-10 producēšanu no monocītiem
iegūtās dendritiskās šūnās (DC) un tādējādi to spējas ierosināt
CD4+CD25+TR šūnu attīstību noteikšanu *in vitro*.

- (51) **C12H 1/04**^(2006.01) (11) **2049645**
B01J 20/10^(2006.01)
- (21) 07786398.3 (22) 27.07.2007
(43) 22.04.2009
(45) 06.04.2016
(31) 836091 P (32) 07.08.2006 (33) US
(86) PCT/EP2007/006687 27.07.2007
(87) WO2008/017393 14.02.2008
(73) Grace GmbH & Co. KG, In der Hollerhecke 1, 67545 Worms,
DE
(72) LÜERS, Georg, DE
JALALPOOR, Massoud, DE
SEDMAYER, Dominik, DE
SEEWALD, Andreas, DE
(74) UEXKÜLL & STOLBERG, Patentanwälte, Beselerstrasse 4,
22607 Hamburg, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082,
LV
- (54) **ALUS DZIDRINĀŠANAS LĪDZEKLIS UZ SILĪCIJA OKSĪDA
KSEROGELA PAMATA AR AUGSTU CAURLAIDĪBU
BEER CLARIFICATION AID BASED ON SILICA XEROGEL
WITH HIGH FILTERABILITY**
- (57) 1. Kompozīcija, kas ir izmantojama dzērienu apstrādei un
satur kserogela daļiņas ar poru apjomu no 0,2 līdz 2,0 ml/g un
vidējo daļiņu izmēru no 5 līdz 40 mikroniem, turklāt kompozīcija
satur 20 vai mazāk masas % sīko daļiņu.
2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais ksero-
gels satur 20 vai mazāk masas % mitruma.
3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais ksero-
gels satur silīcija oksīdu.
4. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais vidējais
daļiņu izmērs ir no 10 līdz 25 mikroniem.
5. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kura satur 18 vai
mazāk masas % sīko daļiņu.
6. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kura satur 15 vai
mazāk masas % sīko daļiņu.
7. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais vidējais
daļiņu izmērs ir no 10 līdz 25 mikroniem un virsmas laukums ir
no 400 līdz 800 m²/g.
8. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētās kom-
pozīcijas caurlaidība ir vismaz 40 milidarsi.
9. Paņēmiens kompozīcijas, kas ir izmantojama dzērienu
apstrādei, iegūšanai, kas satur:

- hidrogela iegūšanu,
hidrogela karsēšanu, lai iegūtu kserogelu,
kserogela samalšanu, lai iegūtu daļiņas, un
sīko daļiņu aizvākšanu no kompozīcijas tā, ka kompozīcija satur
kserogela daļiņas ar poru apjomu no 0,2 līdz 2,0 ml/g un vidējo
daļiņu izmēru no 5 līdz 40 mikroniem, turklāt kompozīcija satur
20 vai mazāk masas % sīko daļiņu.
10. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kurā minētais kserogels
satur 20 vai mazāk masas % mitruma.
11. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kurā minētais vidējais
daļiņu izmērs ir no 10 līdz 25 mikroniem.
12. Paņēmiens dzēriena apstrādei, kas satur:
kserogela kompozīcijas nodrošināšanu,
dzēriena nodrošināšanu un
minētā dzēriena filtrēšanu ar minēto kserogela kompozīciju,
pie kam minētā kompozīcija satur kserogela daļiņas ar poru apjomu
no 0,2 līdz 2,0 ml/g, vidējo daļiņu izmēru no 5 līdz 40 mikroniem,
turklāt kompozīcija satur 20 vai mazāk masas % sīko daļiņu.
13. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kurā minētais dzēriens
ietver alu, vīnu vai augļu sulas.
14. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kurā minētā kom-
pozīcija satur 18 vai mazāk masas % sīko daļiņu.
15. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kurā minētā kom-
pozīcija satur 15 vai mazāk masas % sīko daļiņu.

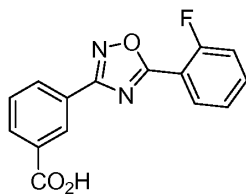
- (51) **A61K 39/395**^(2006.01) (11) **2066352**
C07K 16/28^(2006.01)
A61P 25/00^(2006.01)
- (21) 07802348.8 (22) 11.09.2007
(43) 10.06.2009
(45) 02.12.2015
(31) 844251 P (32) 13.09.2006 (33) US
06090169 14.09.2006 EP
(86) PCT/EP2007/008084 11.09.2007
(87) WO2008/031626 20.03.2008
(73) Alcafeleu Management GmbH & Co. KG, Lilienthalstrasse 4,
12529 Schönefeld OT Waltersdorf, DE
Genzyme Corporation, 500 Kendall Street, Cambridge,
MA 02142, US
(72) SACHSE, Andreas, DE
MARGOLIN, David Harris, US
(74) Mathys & Squire LLP, The Shard, 32 London Bridge Street,
London SE1 9SG, GB
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV &
Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **MULTIPLĀS SKLEROZES (MS) ĀRSTĒŠANA AR KAM-
PĀTU-1H
TREATMENT OF MULTIPLE SCLEROSIS (MS) WITH
CAMPATH-1H**
- (57) 1. Kampāta-1H izmantošana medikamenta recidīva riska
mazināšanai ar recidivējošu multiplās sklerozes (MS) formu sirgst-
ošam pacientam, kurš ir saņēmis iepriekšēju MS terapiju, ražošanai,
turklāt ārstēšana ar kampātu-1H ietver pirmo ārstēšanas ciklu ar
kampātu-1H, kam seko vismaz viens turpmākais ārstēšanas cikls
ar kampātu-1H, kur katrs ārstēšanas cikls ietver 1–5 dienas devas,
kas tiek lietotas katru dienu, turklāt dienas deva ir >0 un ≤12 mg,
un turklāt katrs ārstēšanas cikls ir atdalīts no nākamā ārstēšanas
cikla ar vismaz 1 līdz 24 mēnešu laika periodu, turklāt minētajā
pirmajā ārstēšanas ciklā kampāts-1H tiek ievadīts devā 12 mg/dienā
piecas dienas ilgi un turklāt minētais pacients tiek atkārtoti ārstēts
12 mēnešus pēc minētā pirmā ārstēšanas cikla ar turpmāko ārstē-
šanas ciklu ar kampāta-1H devu 12 mg/dienā trīs dienas ilgi.
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt ārstēšana
ar kampātu-1H ietver pirmo ārstēšanas ciklu ar 12 mg/dienā
kampāta-1H devu piecas dienas ilgi un 12 mēnešus pēc minētā
pirmā ārstēšanas cikla otrā ārstēšanas ciklu ar kampāta-1H devu
12 mg/dienā trīs dienas ilgi, turklāt tikai gadījumā, ja ir pierādījumi
par atjaunojušos MS aktivitāti, minētajiem pirmajam un otrajam
ārstēšanas ciklam seko trešais vai sekojošais ārstēšanas cikls.
3. Izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt trešais vai
turpmākais ārstēšanas cikls ir ar kampāta-1H devu 12 mg/dienā
trīs dienas ilgi.

4. Kampāts-1H izmantošanai recidīva riska mazināšanā ar multiplās sklerozes (MS) recidivējošu formu sirgstošam pacientam, kurš ir saņēmis iepriekšēju MS terapiju, kur ārstēšana ar kampātu-1H iekļauj pirmo ārstēšanas ciklu ar kampātu-1H, kam seko vismaz viens turpmākais ārstēšanas cikls ar kampātu-1H, kur katrs ārstēšanas cikls ietver 1–5 dienas devas, kas tiek lietotas katru dienu, turklāt dienas deva ir >0 un ≤12 mg, un turklāt katrs ārstēšanas cikls ir atdalīts no nākamā ārstēšanas cikla ar vismaz 1 līdz 24 mēnešu laika periodu, turklāt minētajā pirmajā ārstēšanas ciklā kampāts-1H tiek ievadīts devā 12 mg/dienā piecas dienas ilgi un turklāt minētais pacients tiek atkārtoti ārstēts 12 mēnešus pēc minētā pirmā ārstēšanas cikla ar turpmāko ārstēšanas ciklu ar kampātu-1H devu 12 mg/dienā trīs dienas ilgi.

5. Kampāts-1H izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt ārstēšana ar kampātu-1H ietver pirmo ārstēšanas ciklu ar 12 mg/dienā kampātu-1H devu piecas dienas ilgi un 12 mēnešus pēc minētā pirmā ārstēšanas cikla otru ārstēšanas ciklu ar kampātu-1H devu 12 mg/dienā trīs dienas ilgi, turklāt, tikai gadījumā, ja ir pierādījumi par atjaunojušos MS aktivitāti, minētajiem pirmajam un otrajam ārstēšanas ciklam seko trešais vai sekojošais ārstēšanas cikls

6. Kampāts-1H izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt trešais vai turpmākais ārstēšanas cikls ir ar kampātu-1H devu 12 mg/dienā trīs dienas ilgi.

- (51) **C07D 271/06**^(2006.01) (11) **2076501**
A61K 31/4245^(2006.01)
- (21) 07838770.1 (22) 24.09.2007
(43) 08.07.2009
(45) 02.12.2015
(31) 847326 P (32) 25.09.2006 (33) US
(86) PCT/US2007/020633 24.09.2007
(87) WO2008/039431 03.04.2008
(73) PTC Therapeutics, Inc., 100 Corporate Court, Middlesex Business Center, South Plainfield, NJ 07080, US
(72) ALMSTEAD, Neil G., US
HWANG, Peter Seongwoo, US
MOON, Young-Choon, US
(74) Savic, Bojan, et al, Jones Day, Rechtsanwältinnen Attorney-at-Law Patentanwälte, Prinzregentenstraße 11, 80538 München, DE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
(54) **3-[5-(2-FLUORFENIL)-[1,2,4]OKSADIAZOL-3-IL]-BENZO-SKĀBES KRISTĀLISKĀS FORMAS**
CRYSTALLINE FORMS OF 3-[5-(2-FLUOROPHENYL)-[1,2,4]OXADIAZOL-3-YL]-BENZOIC ACID
(57) 1. Savienojuma ar formulu (I):



(I)

kristāliskā forma, kurai ir pulvera rentgendifraktogramma, kas satur vismaz trīs maksimuma pozīcijas ($2\theta \pm 0,2$), mērot ar Cu Ka starojumu un izvēloties no rindas, kas sastāv no 4,96, 6,39, 10,10, 11,54, 12,62, 12,81, 13,92, 14,16, 14,55, 14,88, 15,07, 15,58, 16,27, 16,61, 18,74, 18,94, 19,28, 19,94, 20,27, 20,74, 20,97, 21,22, 21,93, 22,58, 22,80, 23,00, 23,79, 24,14, 24,46, 25,44, 25,64, 26,07, 26,34, 26,74, 27,06, 27,79, 28,42, 29,09, 30,48.

2. Kristāliskā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kurai ir šādi elementārās šūnas parametri, mērot pie 150 K: $a=24,2240 \text{ \AA}$; $b=3,74640 \text{ \AA}$; $c=27,4678 \text{ \AA}$; $\alpha=90^\circ$; $\beta=92,9938^\circ$; $\gamma=90^\circ$; $V=2489,38(17) \text{ \AA}^3$; $Z=8$; aprēķinātais blīvums (d_{calc} , $\text{g}\cdot\text{cm}^{-3}$) ir $1,517 \text{ g}\cdot\text{cm}^{-3}$; un telpiskā grupa ir $P2_1/n$ (Nr. 14).

3. Kristāliskā forma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurai ir relatīvās atomu koordinātas, kas ir vienādas ar šādām koordinātām:

Atoms	x	y	z	U(Å ²)
F(122)	0,43198(12)	0,7655(8)	-0,17546(10)	0,0487(10)
F(222)	-0,20343(15)	0,7129(10)	0,06378(14)	0,0781(14)
O(13)	0,42977(13)	0,4875(8)	-0,08927(11)	0,0324(10)
O(23)	-0,12941(13)	0,4507(9)	0,12653(12)	0,0402(10)
O(151)	0,25519(13)	0,4795(9)	0,10765(12)	0,0382(10)
O(152)	0,29215(13)	0,2155(9)	0,17515(12)	0,0403(10)
O(251)	0,16226(13)	0,4813(9)	0,15012(12)	0,0385(10)
O(252)	0,19645(13)	0,1939(9)	0,21659(12)	0,0393(10)
N(11)	0,35817(15)	0,5856(9)	-0,04386(14)	0,0279(10)
N(14)	0,44373(16)	0,3409(10)	-0,04263(14)	0,0327(12)
N(21)	-0,04134(16)	0,5165(9)	0,11065(14)	0,0305(12)
N(24)	-0,09772(17)	0,3201(11)	0,16787(15)	0,0388(14)
C(12)	0,37827(18)	0,6256(11)	-0,08637(17)	0,0266(14)
C(15)	0,40019(19)	0,4091(11)	-0,01823(17)	0,0261(14)
C(22)	-0,0926(2)	0,5601(12)	0,09502(18)	0,0319(15)
C(25)	-0,0471(2)	0,3690(11)	0,15580(17)	0,0302(15)
C(121)	0,35225(19)	0,7961(11)	-0,12930(17)	0,0291(14)
C(122)	0,3784(2)	0,8567(12)	-0,17244(18)	0,0345(15)
C(123)	0,3519(2)	1,0117(12)	-0,21257(19)	0,0407(17)
C(124)	0,2973(2)	1,1101(13)	-0,21014(19)	0,0416(17)
C(125)	0,2694(2)	1,0543(12)	-0,1677(2)	0,0409(17)
C(126)	0,2966(2)	0,8996(12)	-0,12784(18)	0,0349(15)
C(151)	0,39702(19)	0,3013(11)	0,03319(16)	0,0260(14)
C(152)	0,34897(19)	0,3623(11)	0,05704(16)	0,0261(15)
C(153)	0,34631(18)	0,2594(11)	0,10554(16)	0,0253(14)
C(154)	0,39150(19)	0,0970(11)	0,13029(17)	0,0279(14)
C(155)	0,43977(19)	0,0412(11)	0,10614(17)	0,0291(15)
C(156)	0,44250(19)	0,1421(11)	0,05765(17)	0,0292(15)
C(157)	0,2955(2)	0,3188(12)	0,13209(18)	0,0312(15)
C(221)	-0,1109(2)	0,7083(12)	0,04727(19)	0,0388(17)
C(222)	-0,1643(3)	0,7823(15)	0,0331(2)	0,053(2)
C(223)	-0,1825(3)	0,9272(15)	-0,0122(3)	0,064(2)
C(224)	-0,1415(4)	0,9930(16)	-0,0433(3)	0,068(3)
C(225)	-0,0870(3)	0,9202(15)	-0,0316(2)	0,066(2)
C(226)	-0,0678(3)	0,7766(12)	0,01365(17)	0,0543(19)
C(251)	0,00110(19)	0,2695(11)	0,18877(17)	0,0300(15)
C(252)	0,05426(19)	0,3352(11)	0,17481(17)	0,0289(15)
C(253)	0,09949(19)	0,2449(11)	0,20524(17)	0,0277(15)
C(254)	0,0919(2)	0,0940(11)	0,25087(17)	0,0296(15)
C(255)	0,0389(2)	0,0335(11)	0,26491(17)	0,0300(15)
C(256)	-0,0064(2)	0,1185(12)	0,23430(17)	0,0322(15)
C(257)	0,1559(2)	0,3165(12)	0,18902(17)	0,0305(15)
H(123)	0,371	1,050	-0,241	0,048
H(124)	0,278	1,217	-0,238	0,050
H(125)	0,232	1,123	-0,166	0,049
H(126)	0,278	0,862	-0,099	0,042
H(151)	0,227	0,491	0,125	0,057
H(152)	0,318	0,473	0,041	0,031
H(154)	0,389	0,025	0,163	0,033
H(155)	0,471	-0,066	0,123	0,035
H(156)	0,475	0,103	0,041	0,035
H(223)	-0,220	0,975	-0,020	0,077
H(224)	-0,151	1,094	-0,074	0,082

Atoms	x	y	z	U(Å ²)
H(225)	-0,061	0,969	-0,055	0,080
H(226)	-0,030	0,729	0,021	0,065
H(252)	0,226	0,213	0,202	0,059
H(254)	0,123	0,034	0,272	0,035
H(255)	0,033	-0,068	0,296	0,036
H(256)	-0,043	0,074	0,244	0,039
H(25A)	0,060	0,443	0,144	0,035

4. Kristāliskā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kurai ir pulvera rentģendifraktogramma, kas satur vismaz vienu maksimuma pozīciju ($2\theta \pm 0,2$), mērot ar Cu Ka starojuma izmantošanu, izvēloties no rindas, kas sastāv no 10,10, 11,54, 14,55, 14,88 un 15,07.

5. Kristāliskā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir raksturīga ar ¹³C CP/MAS cietā stāvokļa NMR signāliem šādā vienā vai vairākās pozīcijās: 172,6, 167,0, 131,3, 128,4 un 117,1 ppm, ja ārējais etalons ir glicīns pie 176,5 ppm.

6. Kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurai ir diferencālās skenējošās kalorimetrijas termogramma, kurā ir endotermisks process ar maksimuma temperatūru pie 244 °C.

7. Kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurai ir termogravimetriskās analīzes termogramma, kurā masas zudums ir mazāks nekā 1 % no parauga kopmasas, uzkaršējot no 33 līdz 205 °C.

8. Kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas ir nehigroskopiska.

9. Kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas ir ar tīrību vismaz 90 %.

10. Process kristāliskās formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai iegūšanai, kur process satur kristāliskās formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai kristalizāciju no šķīdinātāja.

11. Process saskaņā ar 10. pretenziju, kur minētā kristāliskās formas kristalizācija no šķīdinātāja satur:

(a) kristāliskas formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai kristalizāciju no metanola; terciārā butilspirta (*t*-BuOH); 1-butilspirta (1-BuOH); acetoniitrila; izopropilspirta (IPA); izopropilētera; dimetilformamīda; heptāna; izopropilacetāta (IPOAc); toluola un/vai ūdens; vai

(b) kristāliskās formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai kristalizāciju ar lēnu iztvaikošanu no acetoniitrila; *t*-butanola; izopropilspirta; vai izopropilētera; vai

(c) kristāliskas formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai kristalizāciju ar ātru iztvaikošanu no 1-butanola; dimetoksiētera; *t*-butanola; dimetilformamīda un ūdens maisījuma; izopropilētera; vai *t*-butanola:ūdens maisījuma (proporcijā 3:2), 1 molārā ekvivalenta metanola un 1 molārā ekvivalenta nātrija hlorīda.

12. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur kristālisko formu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai un, neobligāti, vienu vai vairākus nesējus, pildvielas vai atšķaidītājus.

13. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju perorālai, mukozālai, parenterālai, transdermālai vai vietējai ievadīšanai.

14. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 12. vai 13. pretenziju, kur farmaceutiskā kompozīcija ir atsevišķā vienas devas formā iekšķīgai lietošanai.

15. Kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai izmantošanai metodē priekšlaicīgas translācijas supresijas modulēšanai un/vai nonsensmutācijas izraisīta mRNS noārdīšanai šūnā, šūnu pakļaujot kontaktam ar kristālisko formu.

16. Kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai izmantošanai metodē ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociētas slimības vai traucējuma ārstēšanai vai profilaksei.

17. Kristāliskā forma izmantošanai saskaņā ar 16. pretenziju, kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir multiplā endokrīnā neoplāzija (1., 2. un 3. tips), amiloidoze, mukopolisaharidoze (I un III tips), iedzimtā virsnieru dziedzeru hipoplāzija, adenomatozā resnās zarnas polipoze, fon Hipela-Lindaua slimība, Menkesa sindroms, hemofilija A, hemofilija B, kolagēns VII, Alažila sindroms, Taunsa-Broksa sindroms, rabdoīdais audzējs, bulozā epidermolīze, Hurleres sindroms, Kofina-Lourija sindroms, anirīdija, Šarko-Mari-Tūta slimība, miotubulārā miopātija, ar X hromosomu saistītā miotubulārā miopātija, ar X hromosomu

saistītā hondrodisplāzija, ar X hromosomu saistītā agammaglobulinēmija, policistiskā nieru slimība, muguras muskuļu atrofija, iedzimtā adenomatozā polipoze, piruvāta dehidrogenāzes deficīts, fenilketonūrija, neirofibromatoze 1, neirofibromatoze 2, Alzheimeras slimība, Teja-Saksa slimība, Retta sindroms, Hermanska-Pudlaka sindroms, ektodermālā displāzija/ādas trausluma sindroms, Leri-Veila dishondrosteoze, rahīts, hipofosfatēmija, adrenoleikodistrofija, girātā (*gyrate*) atrofija, ateroskleroze, neirosensorais kurlums, distonija, Denta slimība, akūtā intermitējošā porfīrija, Kaudena slimība, Herlica bulozā epidermolīze, Vilsona slimība, Tričera-Kolinsa sindroms, piruvāta kināzes deficīts, gigantisms, pundurisms, hipotireoīdisms, hipertireoīdisms, novecošana, tuklums, Pārkinsona slimība, Nīmana-Pika slimība C, cistiskā fibroze, muskuļu distrofija, sirds slimība, nierakmeņi, ataksija-teleangiektāzija, iedzimtā hiperholesterolemija, pigmentozā retinīta, lizosomālās uzkrāšanās slimība, tuberozā skleroze, Dišēna muskuļu distrofija vai Marfāna sindroms; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir kardiovaskulāra slimība, pulmonāra slimība, autoimūna slimība, asins slimība, kolagēna slimība, diabēts, iekaisuma slimība, centrālās nervu sistēmas slimība vai vēzis; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir galvas un kakla, acu, ādas, mutes, rīkles, barības vada, krūškurvja, kaulu, plaušu, resnās zarnas, sigmoidveida zarnas, taisnās zarnas, kuņģa, priekšdziedzera, krūšu, olnīcu, nieru, aknas, aizkuņģa dziedzera, smadzeņu, zarnu, sirds vai virsnieru dziedzeru vēzis; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir viendabīgs audzējs, sarkoma, karcinoma, fibrosarkoma, miksosarkoma, liposarkoma, hondrosarkoma, osteogēnā sarkoma, hordoma, angiosarkoma, endoteliosarkoma, limfangiosarkoma, limfangioendoteliosarkoma, sinovioma, mezotelioma, Jūinga audzējs, leiomiomsarkoma, rabdomiosarkoma, skvamozo šūnu karcinoma, bazālo šūnu karcinoma, adenokarcinoma, sviedru dziedzera karcinoma, tauku dziedzera karcinoma, papilārā karcinoma, papilārās adenokarcinomas, cistadenokarcinoma, medulārā karcinoma, bronhogēnā karcinoma, nieru šūnu karcinoma, hepatoma, žults ceļu karcinoma, horiokarcinoma, seminoma, embrionālā karcinoma, Vilmsa audzējs, cervikālā kanāla vēzis, sēklinieku audzējs, plaušu karcinoma, sīkšūnu plaušu karcinoma, urīnpūšļa karcinoma, epitēlija karcinoma, glioma, astrocitoma, meduloblastoma, kraniofaringioma, ependimoma, Kapoši sarkoma, pinealoma, hemangioblastoma, akustiskā neiroma, oligodendrogloma, meningioma, melanoma, neuroblastoma, retinoblastoma, audzējs, kas izplatās ar asinīm, akūta limfoblastiskā leikēmija, akūtā limfoblastiskā B-šūnu leikēmija, akūtā limfoblastiskā T-šūnu leikēmija, akūtā mieloblastiskā leikēmija, akūtā promielocītiskā leikēmija, akūtā monoblastiskā leikēmija, akūtā eritroleikēmiskā leikēmija, akūtā megakarioblastiskā leikēmija, akūtā mielomonocītiskā leikēmija, akūtā nelimfocītiskā leikēmija, akūtā nediferencētā leikēmija, hroniskā mielocītiskā leikēmija, hroniskā limfocītiskā leikēmija, mataino šūnu leikēmija vai multiplā mieloma; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir audzēja supresora gēns, kur audzēja supresora gēns neobligāti ir ARC, ATM, BRCA1, BRCA2, MSH1, pTEN, Rb vai p53; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir vēzis, kas ir asociēts ar priekšlaicīgu stop-kodonu p53 gēnā; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir autoimūnā slimība, kas ir reimatoīdais artrīts vai „transplantāts pret saimnieku” slimība; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir asins slimība, kas ir hemofilija A, fon Villebranda slimība (tips 3), ataksija-teleangiektāzija, talasēmija vai nierakmeņi; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir kolagēna slimība, kas ir nepilnīgā osteogēnēze vai ciroze; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir iekaisuma slimība, kas ir artrīts; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir centrālās nervu sistēmas slimība, kas ir multiplā skleroze, zīdaiņu neironu ceroidā lipofuscinoze, Alzheimeras slimība, Teja-Saksa slimība, neirodeģeneratīvā slimība vai Pārkinsona slimība; vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir Dišēna muskuļu distrofija, vai kur ar priekšlaicīgu stop-kodonu asociēta slimība vai traucējums ir cistiskā fibroze.

- (51) **F28F 3/04**^(2006.01) (11) **2084481**
F28D 1/03^(2006.01)
F28D 9/00^(2006.01)
- (21) 07835422.2 (22) 13.11.2007
(43) 05.08.2009
(45) 06.01.2016
(31) 0602464 (32) 20.11.2006 (33) SE
(86) PCT/SE2007/050839 13.11.2007
(87) WO2008/063121 29.05.2008
(73) Alfa Laval Corporate AB, Box 73, 221 00 Lund, SE
(72) BERMHULT, Rolf, SE
(74) von Friesendorff, Filip, Alfa Laval Corporate AB, P.O. Box 73, 221 00 Lund, SE
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV

(54) **PLĀKŠŅVEIDA SILTUMMAINIS PLATE HEAT EXCHANGER**

(57) 1. Plākšņveida siltummainis, kas satur vairākas siltummaiņa plāksnes (1, 2), katra no kurām ir paralēla galvenajai orientācijas plaknei (p) un kuras ir samontētas cita citai blakus tā, ka tās veido plākšņu paketi (3), kurai ir aptverošā malas puse (4) un pirmās plāksnes starptelpas (5) pirmajai darba vielai un otrās plāksnes starptelpas (6) otrajai darba vielai, pie kam:

katru otro siltummaiņa plāksni veido pirmā siltummaiņa plāksne (1), un pārējās siltummaiņa plāksnes veido otrā siltummaiņa plāksne (2) tādā veidā, ka minētā pirmā siltummaiņa plāksne (1) kopā ar minēto otro siltummaiņa plāksni (2) veido siltummaiņa plākšņu pāri (1, 2), kas aptver minēto pirmās plāksnes starptelpu (5), pie tam plākšņu pakete (3) satur vairākus šādu siltummaiņa plākšņu (1, 2) pārus,

katrā no siltummaiņa plāksnēm ir vismaz divas kanālu atveres (8, 9), kas veido kanālus, kas stiepjas caur plākšņu paketi (3) un ir savienotas ar pirmās plāksnes starptelpām (5),

siltummaiņa plāksnes (1, 2) ir konstruētas tādā veidā, ka otrās plāksnes starptelpas (6) ir atvērtas caur aptverošo malas pusi (4), katra no minētās pirmās siltummaiņa plāksnes (1) kanālu atverēm (8, 9) ir izveidota tādā veidā, ka tā mijiedarbojas ar minētās otrās siltummaiņa plāksnes (2) iepretim esošo kanāla atveri (8, 9), lai nodrošinātu, ka katrs siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāris ieņem noteikto stāvokli attiecībā pret blakus esošiem siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāriem,

kas raksturīgs ar to, ka:

katra pirmā minētā siltummaiņa plāksne (1) satur vismaz pirmo liekto daļu (21), un katra otrā minētā siltummaiņa plāksne (2) satur vismaz otro liekto daļu (22), pie tam katrā siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāri pirmā liektā daļa (21) ir izveidota, lai mijiedarbotos ar otro liekto daļu (22) un lai nodrošinātu, ka divas siltummaiņa plāksnes (1, 2) katrā pāri ieņem determinētu stāvokli cita attiecībā pret citu,

katrai pirmajai un otrajai siltummaiņa plāksnei (1, 2) ir presēšanas ceļā izformēts profils (*compression-moulded pattern*), ieskaitot siltummaiņa profilu ar gofrējumu un kanāla zonas profilu, pie tam presēšanas ceļā izformētais profils ir orientēts presēšanas virzienā attiecībā pret atrašanās plakni (p),

pirmā liektā daļa (21) ir orientēta pirmajā virzienā attiecībā pret pirmās siltummaiņa plāksnes (1) atrašanās plakni (p) un otrā liektā daļa (22) ir orientēta otrajā virzienā attiecībā pret otrās siltummaiņa plāksnes (2) atrašanās plakni (p), pie tam otrais virziens atbilst tam pašam virzienam, kurš ir presēšanas virziens, bet ir pretējs attiecībā pret pirmo virzienu.

2. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pirmais virziens un otrais virziens ir transversāli attiecībā pret atrašanās plakni (p).

3. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka katra otrā siltummaiņa plāksne (2) ir pagriezta par 180° attiecībā pret katru pirmo siltummaiņa plāksni (1) gatavā plākšņu paketē (3).

4. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pirmā liektā daļa (21) un otrā liektā daļa (22) gatavā plākšņu paketē (3) ir orientētas tajā pašā virzienā.

5. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka katra siltummaiņa plāksne (1, 2) ir orientēta gar longitudinālo viduslīniju (x), kas plešas caur liekto daļu (21, 22).

6. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka katra otrā siltummaiņa plāksne (2) plākšņu paketē (3) ir pagriezta par 180° ap siltummaiņa plāksnes viduslīniju (x).

7. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka pirmā un otrā siltummaiņa plāksnes plākšņu paketē ir stingri savienotas cita ar citu.

8. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka katra pirmā siltummaiņa plāksne (1) satur divas pirmās liektās daļas (21) un katra otrā siltummaiņa plāksne (2) satur divas otrās liektās daļas (22).

9. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka divas pirmās liektās daļas (21) ir izveidotas cita citai pretī gar attiecīgo pirmās siltummaiņa plāksnes (1) malu un ka divas liektās daļas (22) ir izveidotas cita citai pretī gar attiecīgo otrās siltummaiņa plāksnes (2) malu.

10. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka katra kanālu atvere (8, 9) satur aptverošo kanāla zonu (10, 11), pie tam kanāla zona (10) ap katras siltummaiņa plāksnes (1, 2) pirmo kanāla atveri (8) atrodas pirmajā līmenī (p') attiecībā pret atrašanās plakni (p), un kanāla zona (11) ap katras siltummaiņa plāksnes (1, 2) otro no minētajām atverēm (9) atrodas otrajā līmenī (p'') attiecībā pret atrašanās plakni (p).

11. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka kanāla zona (10) ap pirmā siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāra pirmo kanāla atveri (8) ir konfigurēta tādā veidā, ka tā ir savienota ar kanāla zonu (11) ap blakus esošā otrā siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāra otro kanāla atveri (9).

12. Plākšņveida siltummainis saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka kanāla zona (11) ap pirmā siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāra otro kanāla atveri ir konfigurēta tādā veidā, ka tā ir savienota ar kanāla zonu (10) ap otrā blakus esošā siltummaiņa plākšņu (1, 2) pāra pirmo kanāla atveri (8).

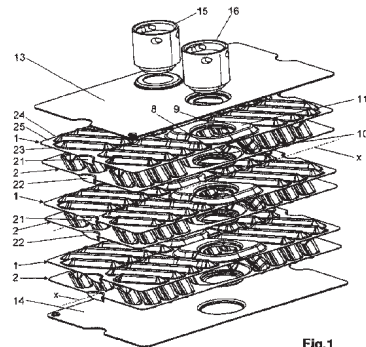


Fig.1

- (51) **A61K 31/496**^(2006.01) (11) **2086544**
A61K 31/568^(2006.01)
A61K 31/519^(2006.01)
A61P 15/00^(2006.01)
A61K 45/06^(2006.01)
- (21) 07834663.2 (22) 02.11.2007
(43) 12.08.2009
(45) 23.12.2015
(31) 06076976 (32) 03.11.2006 (33) EP
(86) PCT/NL2007/050533 02.11.2007
(87) WO2008/054213 08.05.2008
(73) EB IP Lybridos B.V., Louis Armstrongweg 78, 1311 RL Almere, NL
(72) TUITEN, Jan Johan Adriaan, NL
BLOEMERS, Johannes Martinus Maria, NL
DE LANGE, Robertus Petrus Johannes, NL
(74) V.O., P.O. Box 87930, 2508 DH Den Haag, NL
Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **TESTOSTERONA UN 5-HT1A AGONISTA IZMANTOŠANA SEKSUĀLĀS DISFUNKCIJAS ĀRSTĒŠANĀ USE OF TESTOSTERONE AND A 5-HT1A AGONIST IN THE TREATMENT OF SEXUAL DYSFUNCTION**

(57) 1. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai seksuālās disfunkcijas ārstēšanā, turklāt minētais 5-HT1A agonists faktiski tiek atbrīvots laikā no 1 līdz 1,5 stundām un minētais testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors laikā no 3,5 līdz 5,5 stundām pirms seksuālās aktivitātes, tā, ka 5-HT1A agonista un testosterona vai tā metabolīta, vai prekursora maksimālais efekts daļēji pārklājas.

2. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur PDE5 inhibitoru izmantošanai seksuālās disfunkcijas ārstēšanā, turklāt minētais 5-HT1A faktiski tiek atbrīvots laikā no 1 līdz 1,5 stundām, minētais PDE5 inhibitors laikā no 1 līdz 2 stundām un minētais testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors laikā no 3,5 līdz 5,5 stundām pirms seksuālās aktivitātes, tā, ka 5-HT1A agonista, PDE5 inhibitora un testosterona vai tā metabolīta, vai prekursora maksimālais efekts daļēji pārklājas.

3. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists tiek nodrošināti farmaceitiskas kompozīcijas, kas satur testosteronu vai tā metabolītu, vai prekursoru un 5-HT1A agonistu, veidā.

4. Testosterons vai tā metabolīts vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētais testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors, 5-HT1A agonists un PDE5 inhibitori tiek nodrošināti farmaceitiskas kompozīcijas, kas satur testosteronu vai tā metabolītu, vai prekursoru, PDE5 inhibitoru un 5-HT1A agonistu, veidā.

5. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists tiek nodrošināti kā sastāvdaļu komplekts, kas satur vismaz vienu testosteronu vai tā metabolītu, vai prekursoru saturošu farmaceitisku kompozīciju un vismaz vienu 5-HT1A agonistu saturošu kompozīciju.

6. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētais testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors, 5-HT1A agonists un PDE5 inhibitors tiek nodrošināti kā sastāvdaļu komplekts, kas satur vismaz vienu testosteronu vai tā metabolītu, vai prekursoru saturošu farmaceitisku kompozīciju, kas satur vismaz vienu PDE5 inhibitoru saturošu kompozīciju un vismaz vienu 5-HT1A agonistu saturošu kompozīciju.

7. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt minētā seksuālā disfunkcija ir sievietes seksuālā disfunkcija.

8. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt minētā seksuālā disfunkcija ir vīrieša seksuālā disfunkcija.

9. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt 5-HT1A agonists ir 8-OH-DPAT, alnespirons, AP-521, buspīrs, buspirons, dipropil-5-CT, DU-125530, E6265, ebalzotāns, eptapīrons, flesinoksāns, flibanserīns, gepīrons, ipsapīrons, lesopitrons, LY293284, LY301317, MKC242, R(+)-ZTH-301, repinotāns, SR57746A, sunepitrons, SUN-N4057, tandosporīns, U-92016A, urapidīls, VML-670, zalospirons vai zaprasidons.

10. Testosterons vai tā metabolīts, vai prekursors un 5-HT1A agonists izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt 5-HT1A agonists ir buspirons.

PENG, Hua, CN
LIU, Yaohong, CN
SUN, Shangmin, CN
ZHANG, Jinyu, CN
ZHANG, Qingjun, CN
ZHANG, Li, CN
XIE, Yali, CN
DENG, Yanli, CN
RUAN, Ming, CN
LIANG, Siyuan, CN
YANG, Guang, CN
JIA, Wei, CN

(74) Zimmermann, Tankred Klaus, et al, Schoppe Zimmermann, Stöckeler Zinkler & Partner, Patentanwälte, Hermann-Roth-Weg 1, 82049 Pullach bei München, DE
Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **IERĪCE UN METODE KUSTĪGA MĒRĶA ĀTRAI ATTĒLOŠANAI UN PĀRBAUDEI**
DEVICE AND METHOD FOR RAPID IMAGING AND INSPECTING OF A MOVING TARGET

(57) 1. Aparāts kustīga mērķa attēlošanai un pārbaudei, kas satur:

kanālu (14), caur kuru pārvietojas kustīgais mērķis, skenēšanas un attēlošanas ierīci, kas emitē radiācijas staru uz caur kanālu (14) ejošo kustīgo mērķi, lai veidotu tā attēlu pārbaudei, pirmo noteikšanas bloku (2, 3), lai noteiktu, vai kustīgais mērķis ir iegājis kanālā (14) un lai uzskaitītu kanālā (14) ieejošo kustīgo mērķi,

otru noteikšanas bloku (7), lai noteiktu kustīgā mērķa pārvietošanās ātrumu kanālā (14),

vadības bloku otra noteikšanas bloka (7) vadībai, lai noteiktu kustīgā mērķa pārvietošanās ātrumu, balstoties uz detektēšanas signālu no pirmā noteikšanas bloka (2, 3), kas norāda, ka kustīgais mērķis ir iegājis kanālā (14),

mērķis ir iegājis kanālā (14), kas raksturīgs ar to, ka tas vada skenēšanas un attēlošanas ierīci tā, lai emitētu radiācijas staru kustīgā mērķa inspicēšanai ar tādu frekvenci, kas atbilst kustīgā mērķa pārvietošanās ātrumam, balstoties uz otrā noteikšanas bloka (7) noteikto rezultātu.

2. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur trešo noteikšanas bloku (5, 10), lai noteiktu kustīgā mērķa tipu, turklāt vadības bloks regulē laiku, pie kura skenēšanas un attēlošanas ierīce emitē radiācijas staru, balstoties uz noteikto kustīgā mērķa tipu.

3. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur ceturto noteikšanas bloku (6, 8), lai noteiktu, vai kustīgais mērķis ir pametis kanālu (14), un lai uzskaitītu no kanāla (14) izejošo kustīgo mērķi.

4. Aparāts saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt vadības bloks ievieš aparātu gaidstāves stāvoklī, kad noteiktā starpība satur pirmā noteikšanas bloka (5, 10) izskaitļoto un ceturta noteikšanas bloka (6, 8) izskaitļoto ir nulle.

5. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pirmais noteikšanas bloks (2, 3) satur:

pirmo zemes zondēšanas spoli (3), kas ievietota zem zemes virsmas pie kanāla (14) ieejas, un

kanāla (14) abās malās izvietotu pirmo ātrdarbīgo mērīšanas gaismas ekrānu (2), kas tiek lietots kombinācijā ar pirmo zemes zondēšanas spoli.

6. Aparāts saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt kanāla (14) abās malās ir ierīkoti vertikāli instalācijas statņi, un uz vertikālajiem statņiem ir izvietoti pirmie ātrdarbīgie mērīšanas gaismas ekrāni (2).

7. Aparāts saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt ceturtais noteikšanas bloks (6, 8) satur:

otro zemi zondējošo spoli (8), kas novietota kanālā (14) zem zemes virsmas pie kanāla (14) izejas, un

kanāla (14) abās malās izvietotu otro ātrdarbīgo mērīšanas gaismas ekrānu (6), kas tiek izmantots kombinācijā ar otro zemi zondējošo spoli (8).

8. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt otrais noteikšanas bloks (7) satur ātruma mērīšanas radaru, kas izvietots kanālā (14) abās malās.

9. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt otrais noteikšanas bloks (7) satur fotoelektriskos slēdžus, kas kanāla (14) abās malās ir atdalīti viens no otra ar iepriekš noteiktu distanci.

(51) **G01N 23/04**^(2006.01) (11) **2093561**
(21) 06828436.3 (22) 22.12.2006
(43) 26.08.2009
(45) 24.02.2016
(86) PCT/CN2006/003549 22.12.2006
(87) WO2008/046259 24.04.2008
(73) Tsinghua University, Haidian District, Beijing 100084, CN
Nuctech Company Limited, 2nd Fl., Block A, Tongfang Building, Shuangqinglu, Haidian District, Beijing 100084, CN
(72) CHEN, Zhiqiang, CN
LI, Yuanjing, CN
LIU, Yinong, CN
LI, Junli, CN

10. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt otrais noteikšanas bloks (7) satur mērīšanas gaismas ekrānus, kas ar noteiktu distanci atdalīti viens no otra kanāla (14) abās malās.

11. Aparāts saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt trešais noteikšanas bloks (5, 10) satur fotoelektriskus slēdžus (10) kanāla (14) abās malās un trešos ātrdarbīgos mērīšanas gaismas ekrānus (5), kas tiek izmantoti kopā ar fotoelektriskajiem slēdžiem (10).

12. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt skenēšanas un attēlošanas ierīce satur:

emitētā radiācijas stara paātrinātāju, lai skenētu caur kanālu (14) esošo kustīgo mērķi,

detektoru, lai uztvertu caur kustīgo mērķi izgājušo starojumu, attēlošanas ierīci, lai veidotu attēlu, balstoties uz detektora saņemto starojumu, kas izgāja caur kustīgo mērķi, un starojuma aizsardzības ierīci, lai atļautā diapazonā ierobežotu starojuma apjomu aparāta perifērijā.

13. Aparāts saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt starojuma aizsardzības ierīce satur vairogu veidojošas sienas (11), kas ir izvietotas kanāla (14) abās malās.

14. Aparāts saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt detektoram ir detektora balstenis (12), un otrais ātrdarbīgais mērīšanas gaismas ekrāns (6) ir izvietots uz detektora balsteņa (12).

15. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt kustīgais mērķis ir transportlīdzeklis.

16. Metode kustīga mērķa attēlošanai un inspicēšanai, kas satur šādus soļus: noteikšanu (S2), vai kustīgais mērķis ir iegājis kanālā (14), un kustīgā mērķa, kas iegājis kanālā (14), pārvietošanās ātruma noteikšanu (S4),

kas raksturīga ar radiācijas stara izstarošanu ar frekvenci, kas atbilst kustīgā mērķa pārvietošanās ātrumam, lai veiktu (S5) kustīgā mērķa inspicēšanu.

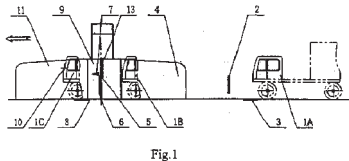


Fig. 1

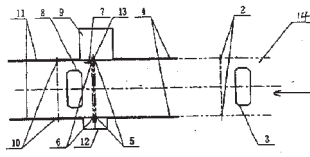


Fig. 2

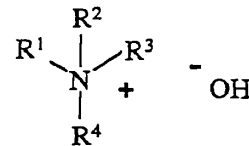
- (51) **A01P 13/00**^(2006.01) (11) **2124577**
A01N 25/00^(2006.01)
A01N 39/02^(2006.01)
A01N 39/04^(2006.01)
A01N 37/40^(2006.01)
A01N 43/40^(2006.01)
- (21) 0872607.1 (22) 26.02.2008
(43) 02.12.2009
(45) 02.12.2015
(31) 903417 P (32) 26.02.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/002488 26.02.2008
(87) WO2008/106107 04.09.2008
(73) Dow AgroSciences LLC, 9330 Zionsville Road, Indianapolis IN 46268-1054, US
- (72) KRAMER, Vincent, J., US
OUSE, David, G., US
PEARSON, Norman, R., US
TANK, Holger, US
ZETTLER, Mark, W., US
- (74) Weickmann & Weickmann, Postfach 860 820, 81635 München, DE
Lūcija KŪZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **NO HERBICĪDĀM KARBONSKĀBĒM UN TETRAALKILAMONIJA VAI (ARILALKIL)TRIALKILAMONIJA HIDROKSĪDIEM IEGŪTI SAVIENOJUMI**

COMPOUNDS DERIVED FROM HERBICIDAL CARBOXYLIC ACIDS AND TETRAALKYLAMMONIUM OR (ARYLALKYL)TRIALKYLAMMONIUM HYDROXIDES

(57) 1. Herbicīds savienojums, kas satur herbicīdas karbonskābes un (tetraalkil)amonija hidroksīda vai (arilalkil)trialkilamonija hidroksīda reakcijas produktu, kurā herbicīdā karbonskābe ir 2,4-D, triklopirs, aminopiralfīds, klopīralfīds, fluoksipīrs, piklorāms, cihalofops, fluazifops, haloksifops, klotīnāfops, fenoksaprops, dikamba vai glufosināts, un kurā termins "alkil" apzīmē lineāras virknes, sazarotas virknes vai ciklisku grupu, kas var būt neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkoksigrupas un alkiltiogrupas, un kurā "arilalkil" apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, kas aizvietota ar arilgrupu, kurā termins "aril" apzīmē fenilgrupu, indanilgrupu vai naftilgrupu, kas ikreiz var būt neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkilgrupas un (C₁-C₆)alkoksigrupas.

2. Herbicīdais savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā herbicīdā karbonskābe ir 2,4-D, triklopirs vai dikamba.

3. Herbicīdais savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā (tetraalkil)amonija hidroksīds ir savienojums ar formulu



kurā R¹, R² un R³ neatkarīgi apzīmē (C₁-C₁₆)alkilgrupu vai jebkuri divi no R¹, R² un R³ apzīmē -(CH₂)_n-, kur n ir vesels skaitlis no 3 līdz 5, un R⁴ apzīmē ((C₁-C₁₆)alkil- vai arilalkilgrupu).

4. Herbicīdais savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kurā R¹, R², R³ un R⁴ ir vienādi.

5. Herbicīdais savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kurā R¹, R² un R³ ir CH₃ un R⁴ ir (C₂-C₁₆)alkil- vai arilalkilgrupa.

6. Herbicīdais savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kurā R⁴ ir benzilgrupa vai heksadecilgrupa.

7. Herbicīdais savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹, R², R³ un R⁴ visi ir metilgrupa, etilgrupa, propilgrupa vai butilgrupa.

8. Herbicīdais savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai 5. pretenziju, kurā herbicīdā karbonskābe ir 2,4-D un (tetraalkil)amonija hidroksīds ir holīna hidroksīds.

9. Herbicīda kompozīcija, kas satur nevēlamu augu apkarošanai efektīvu daudzumu savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju vai to maisījumus kopā ar lauksaimnieciski pieņemamu adjuvantu vai nesēju.

10. Metode nevēlamu augu apkarošanai, kas ietver augu vai to atrašanās vietas pakļaušanu kontaktam ar savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju nevēlamu augu apkarošanai efektīvu daudzumu vai tā iestrādāšanu augsnē, lai novērstu augu parādīšanos.

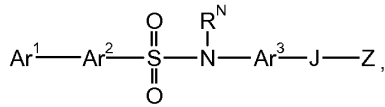
- (51) **C07C 311/21**^(2006.01) (11) **2137141**
A61K 31/18^(2006.01)
A61P 17/06^(2006.01)
A61P 19/00^(2006.01)
A61P 19/02^(2006.01)
A61P 19/08^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
C07C 311/44^(2006.01)
C07C 311/46^(2006.01)
C07C 317/14^(2006.01)
- (21) 08718826.4 (22) 20.03.2008
(43) 30.12.2009
(45) 02.12.2015
(31) 0705400 (32) 21.03.2007 (33) GB
(86) PCT/GB2008/000989 20.03.2008
(87) WO2008/114022 25.09.2008
(73) The University Court of The University of Aberdeen, Regent Walk, Aberdeen, Aberdeenshire AB24 FX, GB
- (72) GREIG, Iain, Robert, GB
VAN'T HOF, Robert, Jurgen, GB
RALSTON, Stuart, Hamilton, GB

(74) Wytenburg, Wilhelmus Johannes, et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB

Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

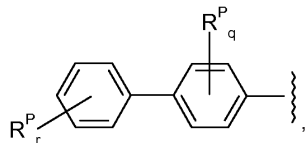
(54) **BIFENIL-4-IL-SULFOSKĀBES ARILAMĪDI UN TO PIE-
LIETOJUMS PAR TERAPIJAS LĪDZEKĻIEM
BIPHENYL-4-YL-SULFONIC ACID ARYLAMIDES AND
THEIR USE AS THERAPEUTIC AGENTS**

(57) 1. Savienojums, kas izvēlēts no savienojumiem ar sekojošu formulu un to farmaceitiski pieņemamiem sāļiem, hidrātiem un solvātiem:



turklāt:

Ar¹-Ar²- ir neatkarīgi grupa ar sekojošu formulu:



q ir neatkarīgi 0, 1, 2, 3 vai 4,

r ir neatkarīgi 0, 1, 2, 3, 4 vai 5,

katrs R^p ir neatkarīgi gredzena aizvietotājs,

-R^N ir neatkarīgi -H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa,

-Ar³- ir neatkarīgi 1,3-fenilēngrupa vai 1,4-fenilēngrupa un ir neatkarīgi neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem

-R^{AR3}, turklāt katrs -R^{AR3} ir neatkarīgi gredzena aizvietotājs,

-Z ir neatkarīgi -OH vai -O-W grupa,

J ir neatkarīgi -R^{alk}- grupa,

-R^{alk}- ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa, un ir neatkarīgi neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{AA}, turklāt katrs -R^{AA} ir neatkarīgi -F, -Cl, -Br, -I atoms, -OH vai -OMe grupa,

-W ir neatkarīgi:

-R^{E1},

-C(=O)-R^{E2},

-C(=O)-O-R^{E3},

-C(=O)-O-S(=O)₂OR^{E4},

-C(=O)-(CH₂)_n-C(=O)OR^{E5},

-C(=O)-(CH₂)_n-NR^{NE1}R^{NE2},

-C(=O)-(CH₂)_n-NR^{NE3}-C(=O)R^{E6},

-C(=O)-(CH₂)_n-C(=O)-NR^{NE4}R^{NE5} vai

-P(=O)(OR^{E7})(OR^{E8}),

turklāt:

katrs n ir neatkarīgi 1, 2, 3 vai 4, un

katrs no R^{E1}, R^{E2}, R^{E3}, R^{E4}, R^{E5}, R^{E6}, R^{E7}, R^{E8}, R^{NE1}, R^{NE2}, R^{NE3}, R^{NE4} un R^{NE5} ir neatkarīgi -H atoms, C₁₋₃alkilgrupa, fenilgrupa vai -CH₂-fenilgrupa, turklāt katra fenilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām grupām, izvēlētam no sekojošām:

-F, -Cl, -Br, -I atoms, -R^{A3}, -CF₃, -OH, -OR^{A3}, -OCF₃, -NH₂, -NHR^{A3}, -NR^{A3}, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{A3} un -C(=O)NR^{A3}, turklāt katrs R^{A3} ir neatkarīgi C₁₋₄alkilgrupa, turklāt katrs gredzena aizvietotājs ir neatkarīgi:

-F, -Cl, -Br, -I atoms, -R^{D1}, -CF₃, -OH, -OR^{D1}, -OCF₃,

-SH, -SR^{D1}, -CN, -NO₂, -NH₂, -NHR^{D1}, -NR^{D1}, -NR^{N1}R^{N2},

-C(=O)OH, -C(=O)OR^{D1}, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{D1}, -C(=O)NR^{D1},

-C(=O)NR^{N1}R^{N2}, -NHC(=O)OR^{D1}, -NR^{D1}C(=O)OR^{D1}, -NHC(=O)OR^{D1},

-NR^{D1}C(=O)OR^{D1}, -OC(=O)R^{D1}, -C(=O)R^{D1}, -NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR^{D1},

-NHC(=O)NR^{D1}, -NHC(=O)NR^{N1}R^{N2}, -NR^{D1}C(=O)NH₂, -NR^{D1}C(=O)NHR^{D1},

-NR^{D1}C(=O)NR^{D1}, -NR^{D1}C(=O)NR^{N1}R^{N2}, -NHSO₂R^{D1}, -NR^{D1}SO₂R^{D1},

-SO₂NH₂, -SO₂NHR^{D1}, -SO₂NR^{D1}, -SO₂NR^{N1}R^{N2}, -SO₂R^{D1}, -OSO₂R^{D1},

-P(=O)(OH)₂, -P(=O)(OH)(OR^{D1}), -P(=O)(OR^{D1})₂, -OP(=O)(OH)₂,

-OP(=O)(OH)(OR^{D1}), -OP(=O)(OR^{D1})₂, =O, =NR^{D1}, =NOH vai =NOR^{D1} grupa,

un turklāt ir papildu iespēja, ka divi blakus esoši gredzena aizvietotāji kopā veido grupu -O-L¹-O-, turklāt L¹ ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa,

un turklāt:

katrā -NR^{N1}R^{N2} grupā R^{N1} un R^{N2} kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, veido 5-, 6- vai 7-locekļu nearomātisku gredzenu, kura

sastāvā ir precīzi 1 gredzena heteroatoms vai precīzi 2 gredzena heteroatomu, turklāt viens no minētajiem precīzi 2 heteroatomiem ir N atoms, un otrs no minētajiem precīzi 2 gredzena heteroatomiem ir neatkarīgi N vai O atoms,

katrs -R^{D1} ir neatkarīgi -R^{D2}, -R^{D3}, -R^{D4}, -R^{D5}, -R^{D6}, -L²-R^{D3}, -L²-R^{D4}, -L²-R^{D5} vai -L²-R^{D6}, turklāt:

katrs -R^{D2} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₆alkilgrupa,

katrs -R^{D3} ir neatkarīgi fenilgrupa,

katrs -R^{D4} ir neatkarīgi C₅₋₆heteroarilgrupa,

katrs -R^{D5} ir neatkarīgi C₃₋₆cikloalkilgrupa vai C₃₋₆cikloalkenilgrupa,

katrs -R^{D6} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa un

katrs -L²- ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa,

un turklāt:

katrā C₁₋₆alkilgrupa, fenilgrupa, C₅₋₆heteroarilgrupa, C₃₋₆cikloalkilgrupa, C₃₋₆cikloalkenilgrupa, C₃₋₆heterociklilgrupa un C₁₋₃alkilēngrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no sekojošiem:

-F, -Cl, -Br, -I atoms, -R^{F1}, -CF₃, -OH, -OR^{F1}, -OCF₃, -SH, -SR^{F1}, -CN, -NO₂, -NH₂, -NHR^{F1}, -NR^{F1}, -NR^{N3}R^{N4}, -C(=O)OH, -C(=O)OR^{F1},

-C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{F1}, -C(=O)NR^{F1}, -C(=O)NR^{N3}R^{N4}, -L³-OH,

-L³-OR^{F1}, -L³-NH₂, -L³-NHR^{F1}, -L³-NR^{F1}, un -L³-NR^{N3}R^{N4} grupa, turklāt:

katrs -R^{F1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa,

katrs -L³- ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₂₋₅alkilēngrupa, un

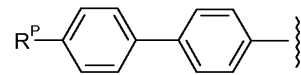
katrā NR^{N3}R^{N4} grupā R^{N3} un R^{N4} kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, veido 5-, 6- vai 7-locekļu nearomātisku gredzenu, kura sastāvā ir precīzi 1 gredzena heteroatoms vai precīzi 2 gredzena heteroatomu,

turklāt viens no minētajiem precīzi 2 heteroatomiem ir N atoms, un otrs no minētajiem precīzi 2 gredzena heteroatomiem ir neatkarīgi N vai O atoms.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt -Z ir neatkarīgi -OH grupa.

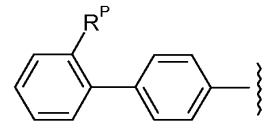
3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju:

turklāt Ar¹-Ar²- ir neatkarīgi grupa ar sekojošu formulu:



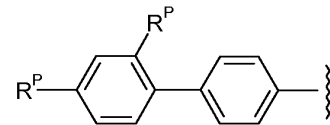
turklāt R^p ir neatkarīgi gredzena aizvietotājs, vai

turklāt Ar¹-Ar²- ir neatkarīgi grupa ar sekojošu formulu:



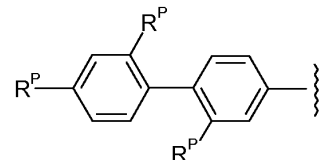
turklāt R^p ir neatkarīgi gredzena aizvietotājs, vai

turklāt Ar¹-Ar²- ir neatkarīgi grupa ar sekojošu formulu:



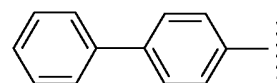
turklāt R^p ir neatkarīgi gredzena aizvietotājs vai

turklāt Ar¹-Ar²- ir neatkarīgi grupa ar sekojošu formulu:



turklāt R^p ir neatkarīgi gredzena aizvietotājs vai

turklāt Ar¹-Ar²- ir neatkarīgi grupa ar sekojošu formulu:



4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt -R^N ir neatkarīgi H atoms.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt -R^{alk}- ir neatkarīgi -CH₂- vai -(CH₂)₂- grupa.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt -R^{alk}- ir neatkarīgi -CH₂- grupa.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt katrs -R^{D1}, ja ir klātesošs, ir neatkarīgi -R^{D8}, turklāt katrs -R^{D8} ir neatkarīgi -R^{D2}, -R^{D3} vai -CH₂-R^{D3}.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt katrs -R^{D1}, ja ir klātesošs, ir neatkarīgi -R^{D9}, turklāt katrs -R^{D9} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃ alkilgrupa.

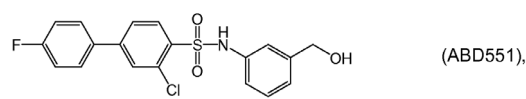
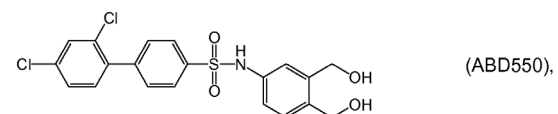
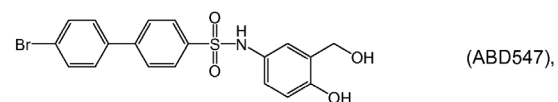
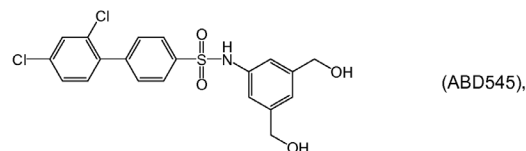
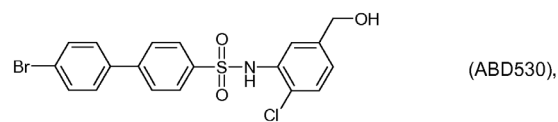
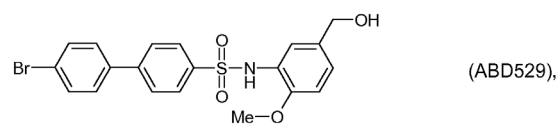
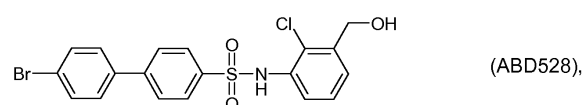
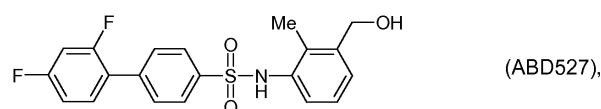
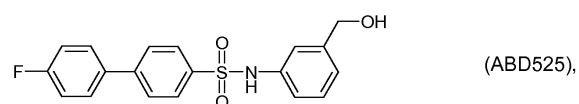
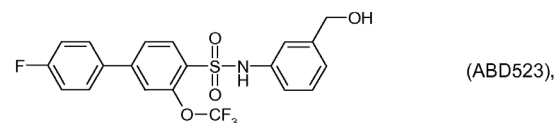
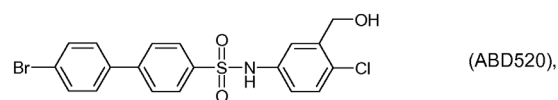
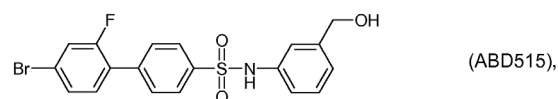
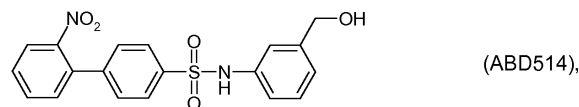
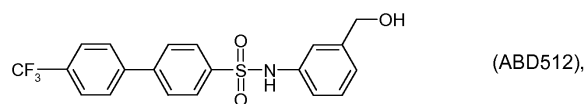
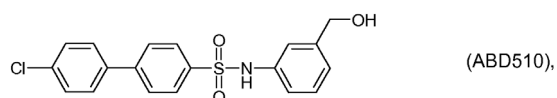
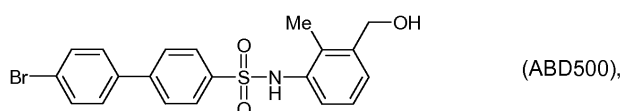
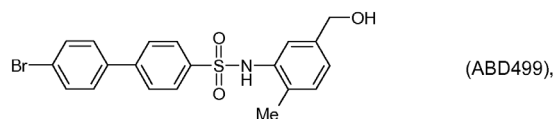
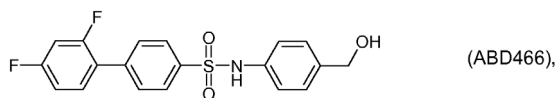
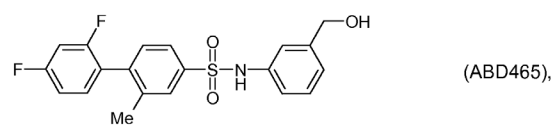
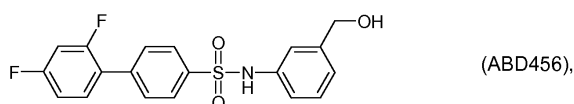
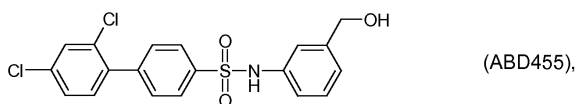
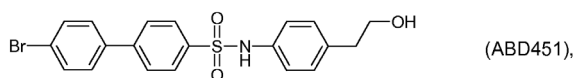
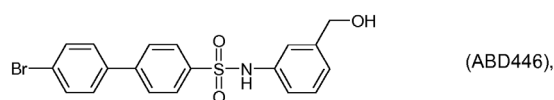
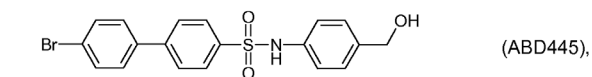
9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt katrs gredzena aizvietotājs, ja ir klātesošs, ir neatkarīgi: -F, -Cl, -Br, -I atoms, -R^{D8}, -CF₃, -OH, -OR^{D8}, -OCF₃, -SR^{D8}, -CN, -NO₂, -NH₂, -NHR^{D8}, -NR^{D2}, -C(=O)OH vai -C(=O)OR^{D8} grupa, turklāt katrs -R^{D8} ir neatkarīgi -R^{D2}, -R^{D3} vai -CH₂-R^{D3}.

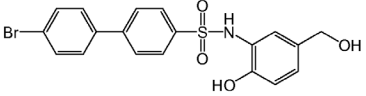
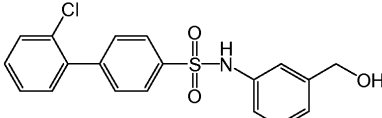
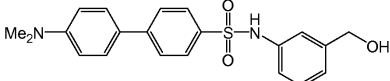
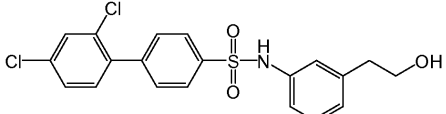
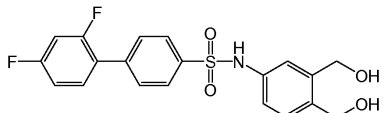
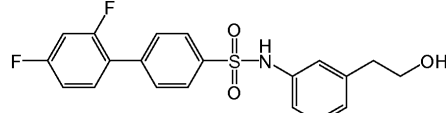
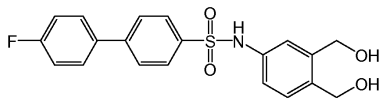
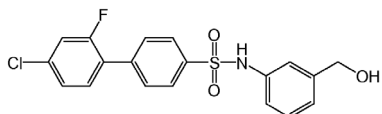
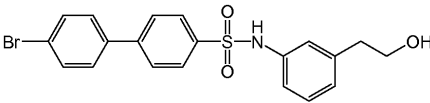
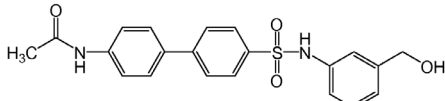
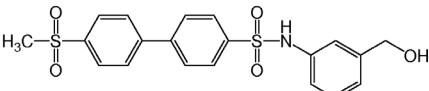
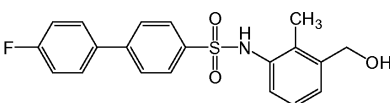
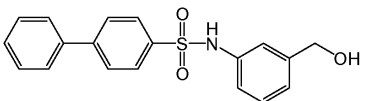
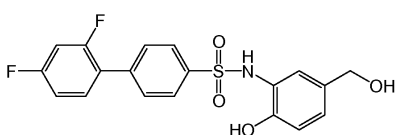
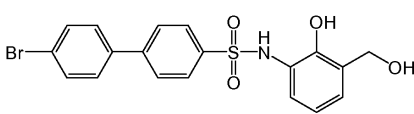
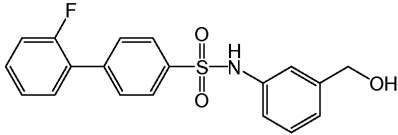
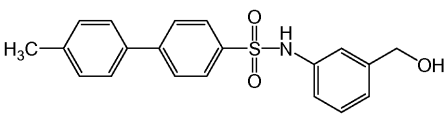
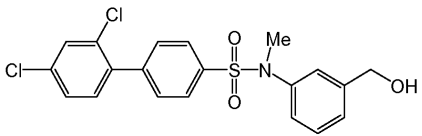
10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt katrs gredzena aizvietotājs, ja ir klātesošs, ir neatkarīgi: -F, -Cl, -Br, -I atoms, -Me, -CF₃, -OH, -OMe, -OCF₃, -NO₂, -NH₂, -NHMe vai -NMe₂ grupa.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt katrs gredzena aizvietotājs, ja ir klātesošs, ir neatkarīgi -F, -Cl vai -Br atoms.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, turklāt -Ar³- ir neatkarīgi neaizvietota grupa.

13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, izvēlēts no savienojumiem ar sekojošām formulām un to farmaceitiski pieņemamiem sāļiem, hidrātiem un solvātiem:



	(ABD554),		(ABD601),
	(ABD559),		(ABD625),
	(ABD565),		(ABD628),
	(ABD568),	un	
	(ABD575),		(ABD630).
	(ABD576),		14. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu nesēju vai atšķaidītāju.
	(ABD577),		15. Farmaceutiska kompozīcija perorālai ievadīšanai, kas ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu nesēju vai atšķaidītāju.
	(ABD578),		16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai pielietošanai cilvēka vai dzīvnieka terapeitiskā ārstēšanā.
	(ABD579),		17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai pielietošanai sekojošu slimību vai traucējumu ārstēšanā un/vai novēršanā: iekaisīgs traucējums vai autoimūns traucējums, traucējums, saistīts ar iekaisumu un/vai imūnsistēmas aktivāciju, traucējums, kas mediēts ar pārmērīgu un/vai nepiemērotu, un/vai paildzinātu imūnsistēmas aktivāciju, iekaisums, traucējums, saistīts ar iekaisumu vai imūnsistēmas aktivāciju, reimatoīdais artrīts, psoriāze, psoriātiskais artrīts, ankilozējošais spondilīts, iekaisīgu zarnu slimība, imūnā atbilde, kas noved pie orgāna vai transplantāta atgrūšanas pēc transplantācijas, audzējs, kurš pārmērīgi ekspresē TNFα, IL-1 vai RANKL, vai kurā TNFα, IL-1 vai RANKL inhibīcija veicina vai uzlabo citotoksisku pretvēža līdzekļu iedarbību, traucējums, kuru mediē osteoklasti, traucējums, atšķirīgs ar pārmērīgu kaulu resorbciju, kaulu masas zudums, kaulu masas zudums, saistīts ar iekaisumu, kaulu masas zudums, kas nav saistīts ar iekaisumu, kaulu masas zudums, saistīts ar pārmērīgu osteoklastu aktivāciju, locītavu destrukcija, locītavu destrukcija, saistīta ar iekaisumu, locītavu destrukcija, saistīta ar pārmērīgu osteoklastu aktivāciju, kaulu masas zudums, saistīts ar reimatoīdo artrītu, osteoporozi, ar vēzi saistītu kaulu slimību vai Pedžeta kaulu slimību, kaulu neoplāzija, hiperkalcēmija, kuras cēlonis ir stāvokļi, saistīti ar palielinātu kaulu resorbciju, prostētisko implantu aseptisks atslābums, osteopetroze, osteoartrīts vai ektoisku kaulu veidošanās.
	(ABD585),		18. Savienojums pielietošanai saskaņā ar 17. pretenziju, turklāt ārstēšana un/vai novēršana ietver savienojuma perorālu ievadīšanu.
	(ABD587),		19. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai pielietošana medikamenta ražošanā sekojošu slimību un stāvokļu ārstēšanai un/vai novēršanai: iekaisīgs traucējums vai autoimūns traucējums,
	(ABD588),		
	(ABD589),		
	(ABD600),		

traucējums, saistīts ar iekaisumu un/vai imūnsistēmas aktivāciju, traucējums, kas mediēts ar pārmērīgu un/vai nepiemērotu, un/vai paildzinātu imūnsistēmas aktivāciju, iekaisums, traucējums, saistīts ar iekaisumu vai imūnsistēmas aktivāciju, reimatoīdais artrīts, psoriāze, psoriātiskais artrīts, ankilozējošais spondilīts, iekaisīgu zarnu slimība, imūnā atbilde, kas noved pie orgāna vai transplantāta atgrūšanas pēc transplantācijas, audzējs, kurš pārmērīgi ekspresē TNF α , IL-1 vai RANKL, vai kurā TNF α , IL-1 vai RANKL inhibīcija veicina vai uzlabo citotoksisku pretvēža līdzekļu iedarbību, traucējums, kuru mediē osteoklasti, traucējums, atšķirīgs ar pārmērīgu kaulu resorbciju, kaulu masas zudums, kaulu masas zudums, saistīts ar iekaisumu, kaulu masas zudums, kas nav saistīts ar iekaisumu, kaulu masas zudums, saistīts ar pārmērīgu osteoklastu aktivāciju, locītavu destrukcija, locītavu destrukcija, saistīta ar iekaisumu, locītavu destrukcija, saistīta ar pārmērīgu osteoklastu aktivāciju, kaulu masas zudums, saistīts ar reimatoīdo artrītu, osteoporozī, ar vēzi saistītu kaulu slimību vai Pedžeta kaulu slimību, kaulu neoplāzija, hiperkalcēmija, kuras cēlonis ir stāvokļi, saistīti ar palielinātu kaulu resorbciju, prostētisko implantu aseptisks atslābums, osteopetroze, osteoartrīts vai ektopisku kaulu veidošanās.

20. Pielietošana saskaņā ar 19. pretenziju, turklāt medikaments ir medikaments perorālai lietošanai.

8. Zobu birste (10) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur piedziņas līdzekļi satur vismaz vienu piedziņas vārpstu (20), kas nodrošina vienas vai abu tīrīšanas kustību nodošanu galviņai (12).

9. Zobu birste (10) saskaņā ar 8. pretenziju, kur vismaz viena piedziņas vārpsta (20) ir izveidota, lai kustētos turp un atpakaļ, nododot pirmo tīrīšanas kustību galviņai (12), un rotētu būtībā ap piedziņas vārpstas garenisko asi (20), lai nodotu otro tīrīšanas kustību galviņai (12).

10. Zobu birste (10) saskaņā ar 9. pretenziju, kur piedziņas līdzekļi satur līdzekļus vismaz vienas piedziņas vārpstas turp un atpakaļ kustības pārvēršanai galviņas (12) rotēšanas kustībā ap pirmo asi.

11. Zobu birste (10) saskaņā ar 10. pretenziju, kur pārvēršanas līdzekļi satur kloķvārpstu (26).

12. Zobu birste (10) saskaņā ar 10. pretenziju, kur pārvēršanas līdzekļi satur vismaz vienu ekscentru, kas ir savienots ar galviņu (12), un atbilstošu bīdītāju, kas ir savienots ar piedziņas vārpstu (20).

13. Zobu birste (10) saskaņā ar 12. pretenziju, kur bīdītājs satur ietvaru, kas aptver ekscentru.

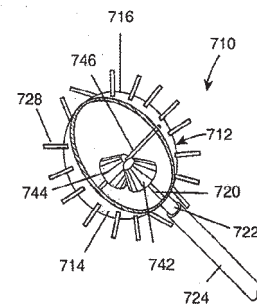
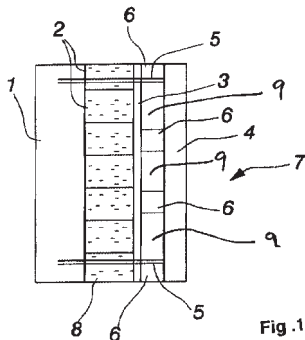


Fig. 18

- (51) **A61C 17/34**^(2006.01) (11) **2142138**
A61C 17/22^(2006.01)
- (21) 08735134.2 (22) 10.04.2008
 (43) 13.01.2010
 (45) 06.04.2016
 (31) 20070256 (32) 11.04.2007 (33) IE
 (86) PCT/EP2008/002824 10.04.2008
 (87) WO2008/125269 23.10.2008
 (73) Diamond, Jean, 10 Riverwood Dale, Carpenterstown, Dublin 15, IE
 (72) DIAMOND, Jean, IE
 (74) O'Neill, Brian, FRKelly, 27 Clyde Road, Ballsbridge, Dublin 4, IE
 Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **ZOBU BIRSTE**
A TOOTHBRUSH
- (57) 1. Zobu birste (10), kas satur būtībā sfērisku birstes galviņu (12), kas satur divas būtībā pussfēriskas sekcijas (14, 16), kuras ir nodalītas viena no otras ar kanālu (18), un piedziņas līdzekļus, kuri ir izvietoti kanālā (18) un pielāgoti vismaz pirmās un otrās neatkarīgās tīrīšanas kustības pārnesei uz galviņu (12).
2. Zobu birste (10) saskaņā ar 1. pretenziju, kur galviņa (12) ir rotējama ap pirmo asi, kad tai ir nodota pirmā tīrīšanas kustība, un neatkarīgi ap otro asi, kad tai ir nodota otrā tīrīšanas kustība.
3. Zobu birste (10) saskaņā ar 2. pretenziju, kur pirmā un otrā ass ir būtībā perpendikulāras.
4. Zobu birste (10) saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur pirmā un otrā ass šķērso galviņas (12) centru.
5. Zobu birste (10) saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 4. pretenzijai, kur galviņa (12) ir nepārtraukti rotējama uzdotajā virzienā ap pirmo un/vai otro asi.
6. Zobu birste (10) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur galviņa (12) satur saru kušķus (28), kas ir izvīzīti ārā no tās.
7. Zobu birste (10) saskaņā ar 6. pretenziju, kur sari (28) uz pirmās un otrās pussfēriskās sekcijas (14, 16), uz saskares virsmas vai tuvu tai starp sekcijām, ir orientēti tā, ka savirzoties tie veido aizsargājošu pārklājumu, kas būtībā aņem saskares virsmu.

- (51) **E04C 2/04**^(2006.01) (11) **2155983**
E04C 2/04^(2006.01)
- (21) 08775458.6 (22) 04.06.2008
 (43) 24.02.2010
 (45) 16.03.2016
 (31) 20070243 U (32) 07.06.2007 (33) FI
 (86) PCT/FI2008/050333 04.06.2008
 (87) WO2008/148940 11.12.2008
 (73) Paroc Group Oy, Energiakuja 3, 00180 Helsinki, FI
 Valkeakosken Betoni Oy, Sammonkatu 10, 37600 Valkeakoski, FI
 Narmapinnoitus OY, Jonkankatu 2 A 1, 20360 Turku, FI
 (72) SEVÓN, Jukka, FI
 LEHTINEN, Markku, FI
 NIKULA, Merja, FI
 (74) LEITZINGER OY, Tammasaarenkatu 1, 00180 Helsinki, FI
 Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **UGUNSDROŠA VENTILĒJAMA KONSTRUKCIJA ĒKAI**
FIRE-SAFE VENTILATED STRUCTURE FOR A BUILDING
- (57) 1. Ugunsdroša ventilējama konstrukcija (7) ēkai, kas kā sienas iekšējo apšuvumu satur betona elementu (1) un minerālšķiedru slāni (8), kurš ir savienots ar betona elementa ārējo pusi un kuram uz tā ārējās puses ir cietināts pretvēja aizsargpārklājums (3), kas tiek uzklāts javas stāvoklī uz minerālšķiedru slāņa un ir mitrumcaurlaidīgs un nedegošs, kā arī satur fasādes elementu (4), kas ar fiksatoriem (5) un distanceriem (6) caur pretvēja aizsargpārklājumu (3) un izolāciju (8) ir piestiprināts pie iekšējā betona apšuvuma (1) tā, lai starp fasādes elementu (4) un pretvēja aizsargpārklājumu (3) atstātu gaisa spraugu (9), kas nepieciešama ventilācijai.
2. Konstrukcija (7) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam pretvēja aizsargpārklājums (3) sastāv no materiāla, kura pamatā ir minerālšķiedras.
3. Konstrukcija (7) saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam viela, kuras pamatā ir minerālšķiedras, sastāv no apmetuma pamatkārtas.

4. Konstrukcija (7) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam izolācija (8) ir uzklāta uz iekšējā betona apšuvuma elementa (1) tā liešanas laikā.



- (51) **C07K 16/30**^(2006.01) (11) **2178921**
 (21) 08796249.4 (22) 17.07.2008
 (43) 28.04.2010
 (45) 06.01.2016
 (31) 959845 P (32) 17.07.2007 (33) US
 (86) PCT/US2008/070344 17.07.2008
 (87) WO2009/012394 22.01.2009
 (73) E. R. Squibb & Sons, L.L.C., Route 206 & Province Line Road, Princeton, NJ 08540, US
 (72) TERRETT, Jonathan, Alexander, US
 LU, Li-sheng, US
 HUANG, Haichun, US
 YAO, Dapeng, US
 PAN, Chin, US
 LEBLANC, Heidi, US
 SPROUL, Timothy, US
 YAMANAKA, Mark, US
 (74) Griffin, Philippa Jane, et al, Mathys & Squire LLP, 120 Holborn, London EC1N 2SQ, GB
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **MONOKLONĀLAS ANTIVIELAS PRET GLIPIKĀNU-3 MONOCLONAL ANTIBODIES AGAINST GLYPICAN-3**
 (57) 1. Izdalīta monoklonāla cilvēka anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, izvēlēta no grupas, kurā ietilpst:
 (i) anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, kas ietver:
 a) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 1,
 b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 4,
 c) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 7,
 d) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 10,
 e) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 13,
 un
 f) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 16,
 (ii) anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, kas ietver:
 a) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 2,
 b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 5,
 c) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 8,
 d) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 11,
 e) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 14,
 un
 f) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 17,
 (iii) anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, kas ietver:
 a) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 3,
 b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 6,
 c) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 9,
 d) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 12,
 e) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 15,
 un
 f) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 18,
 turklāt anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saistās ar gli-pi-cān-3.
 2. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver:
 a) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 1,

- b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 4,
 c) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 7,
 d) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 10,
 e) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 13,
 un
 f) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 16.
 3. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver:
 a) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 2,
 b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 5,
 c) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 8,
 d) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 11,
 e) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 14,
 un
 f) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 17.
 4. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver:
 a) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 3,
 b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 6,
 c) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 9,
 d) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1, kurš ietver SEQ ID NO: 12,
 e) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2, kurš ietver SEQ ID NO: 15,
 un
 f) vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3, kurš ietver SEQ ID NO: 18.
 5. Izdalīta monoklonāla cilvēka anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, izvēlēta no grupas, kurā ietilpst:
 i) anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, kas ietver:
 (a) smagās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 19, un
 (b) vieglās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 22,
 ii) anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, kas ietver:
 (a) smagās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 20, un
 (b) vieglās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 23, un
 iii) anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa, kas ietver:
 (a) smagās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 21, un
 (b) vieglās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 24,
 turklāt anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saistās ar gli-pi-cān-3.
 6. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar 5. pretenziju, kas ietver:
 (a) smagās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 19, un
 (b) vieglās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 22.
 7. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar 5. pretenziju, kas ietver:
 (a) smagās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 20, un
 (b) vieglās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 23.
 8. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar 5. pretenziju, kas ietver:
 (a) smagās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 21, un
 (b) vieglās ķēdes mainīgā reģionu, kurš ietver aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 24.
 9. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt minētā anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa.
 10. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kura ir pilna garuma IgG1 izotipa anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa.
 11. Anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kura ir pilna garuma IgG4 izotipa anti-*gli-pi-cān-3* saistošā daļa.
 12. Imunokonjugāts, kas ietver anti-*gli-pi-cān-3* saistošo daļu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, saistīts ar terapeitisku līdzekli.
 13. Imunokonjugāts saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt terapeitiskais līdzeklis ir citotoksīns.
 14. Imunokonjugāts saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt terapeitiskais līdzeklis ir radioaktīvs izotops.

16. Metode saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt saimniekšūna ir CHO šūna.

17. Cilvēka anti-TSLP anti-viela, kas iegūstama ar metodi saskaņā ar 16. pretenziju.

- (51) **A61M 11/00**^(2006.01) (11) **2265309**
A61M 16/08^(2006.01)
A61M 15/00^(2006.01)
A61M 16/14^(2006.01)
- (21) 09722804.3 (22) 17.03.2009
(43) 29.12.2010
(45) 16.12.2015
(31) 69850 P (32) 17.03.2008 (33) US
76442 P 27.06.2008 US
(86) PCT/US2009/037409 17.03.2009
(87) WO2009/117422 24.09.2009
(73) Discovery Laboratories, Inc., 2600 Kelly Road, Suite 100, Warrington, PA 18976-3622, US
(72) MAZELA, Jan, US
HENDERSON, Christopher, US
(74) Potter Clarkson LLP, The Belgrave Centre, Talbot Street, Nottingham NG1 5GG, GB
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **VENTILĀCIJAS KONTŪRA ADAPTERIS UN AEROSOLA PROKSIMĀLĀ PADEVES SISTĒMA**
VENTILATION CIRCUIT ADAPTOR AND PROXIMAL AEROSOL DELIVERY SYSTEM

(57) 1. Adapteris (10) aerosola veidā sagatavotas aktīvās vielas padevei pacientam ar vienlaicīgu ventilēšanu pie pozitīva spiediena (resp., pie spiediena, kas pārsniedz atmosfēras spiedienu), kas satur:

pacienta piekļuves portu (16), aerosola plūsmas kanālu (12) ar aerosola ieplūdes portu (14) un aerosola izplūdes portu (30), pie kam aerosola plūsmas kanāls (12), kas stiepjas no aerosola ieplūdes porta (14) līdz aerosola izplūdes portam (30), veido aerosola plūsmas ceļu (21) no viena gala līdz otram,

ventilēšanas gāzes plūsmas kanālu (19) fluīda komunikācijai ar aerosola izplūdes portu (30), pie tam minētajam kanālam ir ventilēšanas gāzes ieplūdes ports (20) un ventilēšanas gāzes izplūdes ports (22) un tas veido ventilēšanas gāzes plūsmas ceļu,

pie kam ventilēšanas gāzes plūsmas ceļš vismaz daļēji tiek novirzīts no aerosola plūsmas ceļa (21) un vismaz daļēji aptver aerosola plūsmas kanālu (12), lai ļautu ventilācijas gāzei plūst ap aerosola plūsmas kanālu (12).

2. Adapteris saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur vārstu aerosola ieplūdes portā.

3. Adapteris saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam minētais vārsts ir pietiekami elastīgs, lai vismaz vienā aerosola plūsmas kanālā (12), caur to un caur pacienta piekļuves portu (16) ļautu ievadīt vismaz vienu instrumentu, katetru, caurulīti vai šķiedru, kā arī vienlaikus nodrošinātu pozitīvu ventilēšanas spiedienu.

4. Adapteris saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam plūsmas kanāls (12) nodrošina praktiski taisnu aerosola plūsmas ceļu, izliektu aerosola plūsmas ceļu vai aerosola plūsmas leņķisku ceļu.

5. Adapteris saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam plūsmas kanālam (12) praktiski ir nemainīgs šķērsriezuma laukums.

6. Adapteris saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam plūsmas kanālam (12) šķērsriezuma laukums aerosola ieplūdes portā (14) ir lielāks nekā pacienta piekļuves portā (16).

7. Adapteris saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam fluīda komunikācija starp aerosola plūsmas kanālu (12) un ventilēšanas gāzes plūsmas kanālu (19) notiek vismaz caur vienu atveri.

8. Adapteris saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam: ventilēšanas plūsmas kanāls (19) veido kameru (28), kura ietver ventilēšanas gāzes ieplūdes portu (20), ventilēšanas gāzes izplūdes portu (22) un pacienta piekļuves portu (16); aerosola plūsmas kanāls (12) atrodas kamerā (28) un stiepjas no aerosola ieplūdes porta (14) kameras (28) vienā galā caur kameru (28) uz aerosola izplūdes portu (30) kamerā (28), kā arī ir iegremdēts padziļinājumā no pacienta piekļuves porta (16) kameras (28) pretējā galā; aerosola

plūsmas kanāls (12) ir ar pietiekamu garumu, lai stieptos aiz ventilēšanas gāzes ieplūdes porta (20) un ventilēšanas gāzes izplūdes porta (22).

9. Adapteris saskaņā ar 8. pretenziju, pie kam aerosola izplūdes ports (30) no pacienta piekļuves porta (16) puses ir iegremdēts vismaz par 8 milimetriem.

10. Adapteris saskaņā ar 8. pretenziju, pie kam kameras (28) tilpums starp aerosola izplūdes portu (30) un pacienta piekļuves portu (16) ir vismaz 1,4 mililitri.

11. Adapteris saskaņā ar 8. pretenziju, pie kam adapteris aerosola izplūdes portā (30) satur vienvirziena vārstu (34).

12. Sistēma (100) ar propelentu bagātinātās aerosolā pārvērstās aktīvās vielas ievadīšanai, vienlaicīgu izraisot pozitīvu spiedienu pacienta ventilēšanai, pie kam sistēma satur:

a) pozitīva spiediena ventilācijas kontūra ar pozitīva spiediena ģeneratoru, lai sagatavotu saspiestu ventilēšanas gāzi, pirmo padeves vadu (40) saspiestās ventilācijas gāzes pievadīšanai pacientam un otro padeves vadu (42) izelpotās gāzes plūsmas novirzīšanai prom no pacienta,

b) aerosola ģeneratoru (55) aktīvās vielas pārvēršanai aerosolā,

c) pacienta piekļuves portu (16) ventilācijas gāzes un aerosolā pārvērstās aktīvās vielas piegādei pacientam,

d) adapteri (10) komunikācijai ar pozitīva spiediena ventilēšanas kontūru, aerosola ģeneratoru (55) un pacienta piekļuves portu (16), pie kam adapteris (10) satur adapteri saskaņā ar 1. pretenziju,

e) aerosola bagātināšanas kameru (52), kas ir pielāgota, lai iegūtu propelentā plūsmā ierautu aerosolā pārvērstu aktīvo vielu, pie kam aerosola bagātināšanas kamera (52) ir savienota ar aerosola ģeneratoru (55),

f) papildu kontūru, kas ir savienots ar pirmo padeves vadu (40) saspiestas ventilēšanas gāzes pievadei pacientam, pie kam papildu kontūrs satur pirmo palīgvadu, kas savieno pirmo padeves vadu ar aerosola bagātināšanas kameru (52), pie kam:

pirmais palīgvads ir pielāgots, lai uzņemtu daļu no saspiestās ventilēšanas gāzes, kas ir atdalīta no saspiestās ventilēšanas gāzes galvenās plūsmas, kas vērsta uz adapteri un tiek izmantota kā apvalkgāze, lai pievadītu aerosolā pārvērsto aktīvo vielu un lai padotu daļu no saspiestās ventilēšanas gāzes uz aerosola bagātināšanas kameru (52) sajaukšanai ar aerosolā pārvērsto aktīvo vielu un iegūtu ar propelentu bagātinātu aerosolā pārvērsto aktīvo vielu,

aerosola bagātināšanas kamera (52) ir savienota ar adapteri (10).

13. Sistēma saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam: minētajai sistēmai ventilēšanas gāzes plūsmas kanāls (19) veido kameru (28), kurā ietilpst ventilēšanas gāzes ieplūdes ports (20), ventilēšanas gāzes izplūdes ports (22) un pacienta piekļuves ports (16); aerosola plūsmas kanāls (12), kas atrodas kamerā (28) un stiepjas no aerosola ieplūdes porta (14) kameras (28) vienā galā caur kameru (28) uz aerosola izplūdes portu (30) kamerā (28), ir iegremdēts padziļinājumā no pacienta piekļuves porta (16) kameras (28) pretējā galā; aerosola plūsmas kanāls (12) ir ar pietiekamu garumu, lai stieptos aiz ventilēšanas gāzes ieplūdes porta (20) un ventilēšanas gāzes izplūdes porta (22).

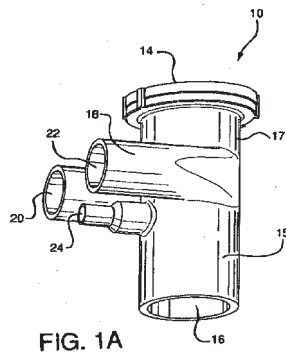
14. Sistēma saskaņā ar 13. pretenziju, pie kam adapteris (10) aerosola ieplūdes portā (14) papildus satur vārstu.

15. Sistēma saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam aerosola bagātināšanas kamera (52) ir tieši savienota ar adaptera (10) aerosola ieplūdes portu (14).

16. Sistēma saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam papildķēde satur aizsarggāzes caurulīti (51) un elpošanas pievadu (40), kas ir aprīkots ar T-veida savienotāju (39), lai novirzītu iepriekšnoteiktu daļu no saspiestās ventilēšanas gāzes uz aizsarggāzes caurulīti (51), kas ir veidota, balstoties uz pacienta elpas pīķa plūsmu.

17. Sistēma saskaņā ar 16. pretenziju, pie kam aizsarggāzes caurulīte (51) satur plūsmas ierobežotāju (50), kas pielāgots, lai regulētu aizsarggāzes plūsmu tā, lai aizsarggāzes plūsma būtu lielāka nekā pacienta elpas pīķa plūsma.

18. Sistēma saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam palīģķēde papildus satur otru palīgvadu, kurš savieno aerosola bagātināšanas kameru (52) ar adapteri (10), pie tam otrais palīģvads ir pielāgots, lai piegādātu ar propelentu bagātinātu aerosolā pārvērsto aktīvo vielu uz adapteri.



slāni (500) tiek apstrādāti plakanparalēlā veidā ar frēzēšanas ierīces (200) palīdzību.

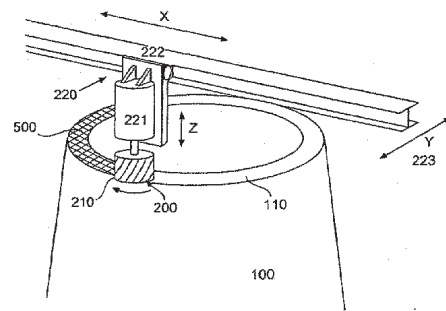


Fig.1

- (51) **F03D 11/04**^(0000.00) (11) **2279065**
B28B 11/12^(2006.01)
B28B 19/00^(2006.01)
B28B 21/02^(2006.01)
E04H 12/12^(2006.01)
B28B 1/00^(2006.01)
B28B 7/22^(2006.01)
B28B 11/08^(2006.01)
B28B 21/92^(2006.01)
- (21) 09727458.3 (22) 01.04.2009
(43) 02.02.2011
(45) 06.01.2016
(31) 102008016828 (32) 01.04.2008 (33) DE
(86) PCT/EP2009/002374 01.04.2009
(87) WO2009/121581 08.10.2009
(73) Wobben Properties GmbH, Borsigstrasse 26, 26607 Aurich, DE
(72) HÖLSCHER, Norbert, DE
(74) Eisenführ, Speiser & Partner, Postfach 10 60 78, 28060 Bremen, DE
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(54) **PAŅĒMIENS VĒJA ENERGOIEKĀRTAS TORŅA UZBŪVĒŠANAI**

METHOD OF ERECTING A WIND TURBINE TOWER

(57) 1. Paņēmiens vēja energoiekārtas torņa uzbūvēšanai no daudziem iepriekš izgatavotiem betona torņa segmentu komponentiem (100), katram no kuriem ir apakšējā un augšējā balstvirsmas (110), izpildot tādus soļus kā vēja energoiekārtas iepriekš izgatavoto torņa betona segmentu komponentu (100) izgatavošana, veicot betona ieliešanu liešanas formā ar horizontālu pamatni, lai izveidotu iepriekš izgatavoto betona komponentu (100) ar horizontālu apakšējo balstvirsmu, un betona sacietināšanu līdz iepriekš noteiktai minimālai stiprībai,

kas raksturīgs ar:

kompensācijas slāņa (500) uzklāšanu uz iepriekš izgatavotā betona komponenta (100) augšējās balstvirsmas (110), iepriekš izgatavotā betona komponenta (100) novietošanu ar horizontālo apakšējo balstvirsmu uz precīzi horizontāli orientētas plaknes (300),

kompensācijas slāņa (500) uz augšējās balstvirsmas (110) noņemšanu plakanparalēlā veidā attiecībā pret apakšējo balstvirsmu tā, ka no augšējās balstvirsmas (110) noņemtais kompensācijas slānis (500) tiek konstruktīvi novietots horizontāli un plakanparalēli attiecībā pret apakšējo balstvirsmu,

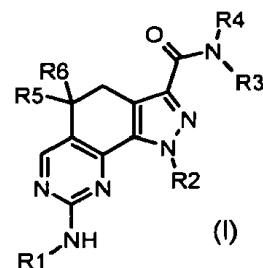
daudzu iepriekš izgatavoto vēja energoiekārtas torņa segmentu komponentu (100) montāžu viena uz otra.

2. Paņēmiens atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt kompensācijas slānis (500) ir sintētiskie sveķi.

3. Paņēmiens atbilstoši 1. vai 2. pretenzijai, turklāt kompensācijas slāņa (500) noņemšana tiek veikta ar frēzēšanas ierīci (200), kurai ir koriģēšanas vienība (220) frēzēšanas ierīces koriģēšanai X, Y un Z virzienā.

4. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt daudzi iepriekš izgatavotie betona komponenti (100) ar kompensācijas slāni (500) uz to augšējās atbalsta virsmas (110) tiek izkārtoti uz horizontālas plaknes (300) un kompensācijas

- (51) **A61K 31/519**^(2006.01) (11) **2303891**
C07D 239/70^(2006.01)
C07D 487/04^(2006.01)
- (21) 09769164.6 (22) 17.06.2009
(43) 06.04.2011
(45) 17.02.2016
(31) 08159114 (32) 26.06.2008 (33) EP
(86) PCT/EP2009/057512 17.06.2009
(87) WO2009/156315 30.12.2009
(73) Les Laboratoires Servier, Prospekt Vernadskogo 86, stroenie 5, 50 rue Carnot 92284 Suresnes cedex, FR
(72) CALDARELLI, Marina, IT
ANGIOLINI, Mauro, IT
COLOMBO, Riccardo, IT
DISINGRINI, Teresa, IT
NUVOLONI, Stefano, IT
POSTERI, Helena, IT
SALSA, Matteo, IT
SILVAGNI, Marco, IT
(74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **PIRAZOLHINAZOLĪNI KĀ PROTEĪNKINĀZES AKTIVITĀTES MODULATORI**
- PIRAZOLO-QUINAZOLINES AS PROTEIN KINASE ACTIVITY MODULATORS**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kurā:

R1 ir *ortho*-aizvietota arilgrupa vai heterociklilgrupa, vai (C₃-C₇)cikloalkilgrupa;

R2 ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₂-C₆)alkenilgrupa, (C₂-C₆)alkinilgrupa, (C₃-C₇)cikloalkilgrupa vai heterociklilgrupa ar lineāru vai sazarotu virkni;

R3 ir arilgrupa;

R4 ir ūdeņraža atoms, hidroksilgrupa vai (C₁-C₆)alkilgrupa, kas neobligāti var būt ciklizēta kopā ar vienu no grupas atomiem, kuras R3 var būt tāds, lai veidotu kondensētu (C₂-C₇)-ciklisku grupu;

R5 un R6 katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa vai neobligāti ir ciklizēts kopā ar oglekļa atomu, kuram tie ir piesaistīti, lai veidotu (C₃-C₇)cikloalkilgrupu;

turklāt: "arilgrupas" ir aromātiskas karbocikliskas vai heteroarilgrupas, kas satur no 1 līdz 2 gredzena daļām, kas ir vai nu kondensētas, vai

savstarpēji saistītas ar atsevišķām saitēm, turklāt vismaz viens no gredzeniem ir aromātisks; jebkurš aromātiskais heteroarilgredzens (pazīstams arī kā aromātiska heterociklilgrupa), ja tas ir klātesošs, satur 5- līdz 6-locekļu gredzenu, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas izvēlēti no N, O vai S atoma;

"*orto*-aizvietota arilgrupa" ir arilgrupa, kā definēts iepriekš, kas piesaistīta pie -NH- daļas, turklāt minētā arilgrupa vienmēr ir aizvietota *orto*-pozīcijā, kas ir gredzena atoms, kas atrodas blakus tam atomam, kas ir saistīts ar -NH- daļu, un neobligāti ir aizvietota arī citās brīvajās pozīcijās;

"heterociklilgrupa" (pazīstama arī kā "heterocikloalkilgrupa") ir 3- līdz 7-locekļu piesātināts vai daļēji nepiesātināts karbocikliskais gredzens, kur viens vai vairāki oglekļa atomi ir aizstāti ar heteroatomiem, piemēram, slāpekļa atomu, skābekļa atomu un sēra atomu;

"(C₃-C₇)cikloalkilgrupa", līdz ar to arī (C₄-C₇)cikloalkilgrupa, ir 3- līdz 7-locekļu oglekli saturošs monocikliskais gredzens, kas var saturēt vienu vai vairākas dubultsaites, bet kuram nav pilnīgi konjugētas π-elektronu sistēmas;

"(C₁-C₆)alkilgrupa ar lineāru vai sazarotu virkni", līdz ar to arī (C₁-C₄)alkilgrupa, ir jebkura no tādām grupām kā, piemēram: metilgrupa, etilgrupa, *n*-propilgrupa, izopropilgrupa, *n*-butilgrupa, izobutilgrupa, *terc*-butilgrupa, *sek*-butilgrupa, *n*-pentilgrupa, *n*-heksilgrupa;

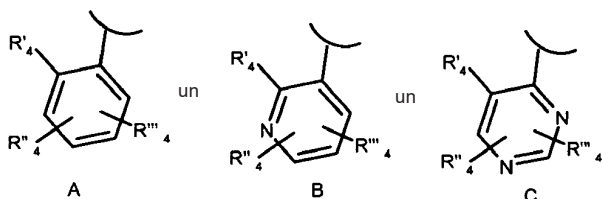
"(C₂-C₆)alkenilgrupa ar lineāru vai sazarotu virkni" ir jebkura no grupām, piemēram: vinilgrupa, allilgrupa, 1-propenilgrupa, izopropenilgrupa, 1-butenilgrupa, 2-butenilgrupa, 3-butenilgrupa, 2-pentenilgrupa, 1-heksenilgrupa; un

"(C₂-C₆)alkinilgrupa ar lineāru vai sazarotu virkni" ir jebkura no tādām grupām kā, piemēram: etinilgrupa, 2-propinilgrupa, 4-pentinilgrupa;

turklāt *orto*-aizvietotā arilgrupa, arilgrupa, heterociklilgrupa, (C₃-C₇)cikloalkilgrupa, (C₄-C₇)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₂-C₆)alkenilgrupa un (C₂-C₆)alkinilgrupa neobligāti var būt (papildus) aizvietotas ar vienu vai vairākām grupām, piemēram, no 1 līdz 6 grupām, kas neatkarīgi ir izvēlētas no rindas: halogēna atoms, nitrogrupa, oksogrupas (=O), ciāngrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, polifluorēta alkilgrupa, polifluorēta alkoksigrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, hidroksialkilgrupa, arilgrupa, arilalkilgrupa, heterociklilgrupa, (C₃-C₇)cikloalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkoksigrupa, ariloksigrupa, heterocikliloksigrupa, metilēndioksigrupa, alkilkarboniloksigrupa, arilkarboniloksigrupa, cikloalkeniloksigrupa, heterociklilkarboniloksigrupa, alkilidēnamīnoksigrupa, karboksigrupa, alkoksikarbonilgrupa, ariloksikarbonilgrupa, cikloalkiloksikarbonilgrupa, heterocikliloksikarbonilgrupa, amīngrupa, ureidogrupa, alkilamīngrupa, dialkilamīngrupa, arilamīngrupa, diarilamīngrupa, heterociklilamīngrupa, formilamīngrupa, alkilkarbonilamīngrupa, arilkarbonilamīngrupa, heterociklilkarbonilamīngrupa, amīnkarbonilgrupa, alkilamīnkarbonilgrupa, dialkilamīnkarbonilgrupa, arilamīnkarbonilgrupa, heterociklilamīnkarbonilgrupa, alkoksikarbonilamīngrupa, hidroksiamīnkarbonilgrupa, alkoksiamīnkarbonilgrupa, arilsulfonilamīngrupa, arilsulfonilamīngrupa, heterociklilsulfonilamīngrupa, formilgrupa, alkilkarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa, cikloalkilkarbonilgrupa, heterociklilkarbonilgrupa, alkilsulfonilgrupa, arilsulfonilgrupa, amīnsulfonilgrupa, alkilamīnsulfonilgrupa, dialkilamīnsulfonilgrupa, arilamīnsulfonilgrupa, heterociklilamīnsulfonilgrupa, ariltiogrupa, alkiltiogrupa, fosfonāts un alkilfosfonāts;

un tā farmaceitiski pieņemami sāļi.

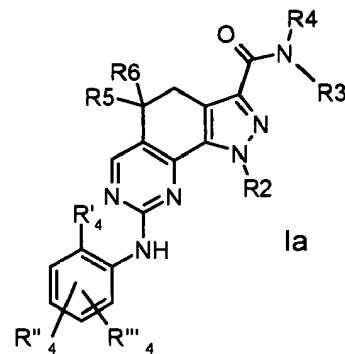
2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka R₁ ir *orto*-aizvietota arilgrupa ar formulu A, B vai C:



kurā R'₄ ir halogēna atoms, nitrogrupa, ciāngrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, polifluorēta alkilgrupa, polifluorēta alkoksigrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, hidroksialkilgrupa, arilgrupa, arilalkilgrupa, heterociklilgrupa, (C₃-C₇)cikloalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkoksigrupa, ariloksigrupa,

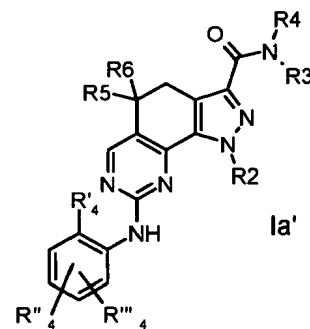
heterocikliloksigrupa, metilēndioksigrupa, alkilkarboniloksigrupa, arilkarboniloksigrupa, cikloalkeniloksigrupa, heterociklilkarboniloksigrupa, alkilidēnamīnoksigrupa, karboksigrupa, alkoksikarbonilgrupa, ariloksikarbonilgrupa, cikloalkiloksikarbonilgrupa, heterocikliloksikarbonilgrupa, amīngrupa, ureidogrupa, alkilamīngrupa, dialkilamīngrupa, arilamīngrupa, diarilamīngrupa, heterociklilamīngrupa, formilamīngrupa, alkilkarbonilamīngrupa, arilkarbonilamīngrupa, heterociklilkarbonilamīngrupa, amīnkarbonilgrupa, alkilamīnkarbonilgrupa, dialkilamīnkarbonilgrupa, arilamīnkarbonilgrupa, heterociklilamīnkarbonilgrupa, alkoksikarbonilamīngrupa, hidroksiamīnkarbonilgrupa, alkoksiamīnkarbonilgrupa, arilsulfonilamīngrupa, arilsulfonilamīngrupa, heterociklilsulfonilamīngrupa, formilgrupa, alkilkarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa, cikloalkilkarbonilgrupa, heterociklilkarbonilgrupa, alkilsulfonilgrupa, arilsulfonilgrupa, amīnsulfonilgrupa, alkilamīnsulfonilgrupa, dialkilamīnsulfonilgrupa, arilamīnsulfonilgrupa, heterociklilamīnsulfonilgrupa, ariltiogrupa, alkiltiogrupa, fosfonāts vai alkilfosfonāts; R'₄ un R''₄ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai viena no iepriekš minētajām R'₄ nozīmēm; un tā farmaceitiski pieņemami sāļi.

3. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir ar formulu (Ia):



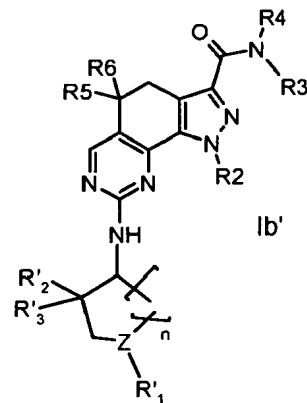
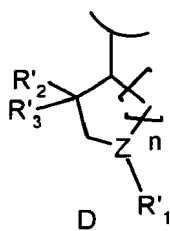
kurā:

R'₄, R''₄ un R'''₄ ir saskaņā ar 2. pretenziju;
R₂ ir neobligāti aizvietota (C₁-C₆)alkilgrupa vai (C₂-C₆)alkenilgrupa ar lineāru vai sazarotu virkni;
R₃ ir neobligāti aizvietota arilgrupa;
R₄ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa, kas neobligāti var būt ciklizēta kopā ar vienu no tās grupas atomiem, kuras R₃ ir tāds, lai veidotu kondensētu (C₄-C₇)-ciklisku grupu, un
R₅ un R₆ ir tādi, kā definēts 1. pretenzijā;
vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.
4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir ar formulu (Ia')



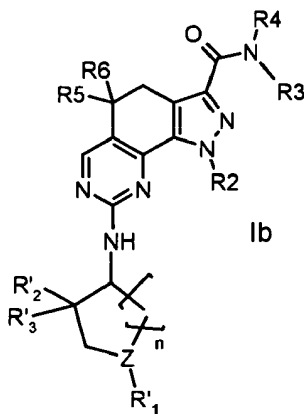
kurā:

R'₄, R''₄ un R'''₄ ir saskaņā ar 2. pretenziju;
R₂ ir neobligāti aizvietota (C₁-C₆)alkilgrupa vai (C₂-C₆)alkenilgrupa ar lineāru vai sazarotu virkni;
R₃ ir tāds, kā definēts 1. pretenzijā;
R₄ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa, kas neobligāti var būt ciklizēta kopā ar vienu no tās grupas atomiem, kuras R₃ ir tāds, lai veidotu kondensētu (C₄-C₇)-ciklisku grupu, un
R₅ un R₆ ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa;
vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.
5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka R₁ ir heterociklilgrupa vai (C₅-C₇)cikloalkilgrupa ar formulu D:



kurā Z ir oglekļa vai slāpekļa atoms, n ir 1, 2 vai 3; R₁ ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, polifluorēta alkilgrupa, polifluorēta alkoksigrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, hidroksialkilgrupa, arilgrupa, arilalkilgrupa, heterociklilgrupa, (C₃-C₇)cikloalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkoksigrupa, ariloksigrupa, heterocikliloksigrupa, metilēndioksigrupa, alkilkarboniloksigrupa, arilkarboniloksigrupa, cikloalkeniloksigrupa, heterociklilkarboniloksigrupa, alkilidēnamīnoksigrupa, karboksigrupa, alkoksikarbonilgrupa, ariloksikarbonilgrupa, cikloalkiloksikarbonilgrupa, heterocikliloksikarbonilgrupa, amīnogrups, ureidogrups, alkilamīnogrups, dialkilamīnogrups, arilamīnogrups, diarilamīnogrups, heterociklilamīnogrups, formilamīnogrups, alkilkarbonilamīnogrups, arilkarbonilamīnogrups, heterociklilkarbonilamīnogrups, amīnkarbonilgrups, alkilamīnkarbonilgrups, dialkilamīnkarbonilgrups, arilamīnkarbonilgrups, heterociklilamīnkarbonilgrups, alkoksikarbonilamīnogrups, hidroksiamīnkarbonilgrups, alkoksiimīnogrups, alkilsulfonilamīnogrups, arilsulfonilamīnogrups, heterociklilsulfonilamīnogrups, formilgrups, alkilkarbonilgrups, arilkarbonilgrups, cikloalkilkarbonilgrups, heterociklilkarbonilgrups, alkilsulfonilgrups, arilsulfonilgrups, amīnsulfonilgrups, alkilamīnsulfonilgrups, dialkilamīnsulfonilgrups, arilamīnsulfonilgrups, heterociklilamīnsulfonilgrups, ariltiogrups, alkiltiogrups, fosfonāts un alkilfosfonāts; un R₂ un R₃ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₃)alkilgrups, kas neobligāti ciklizēta kopā ar oglekļa atomu, kuram tā ir piesaistīta, lai veidotu ciklopropilgrupu.

6. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir ar formulu (Ib):



kurā:
Z ir oglekļa vai slāpekļa atoms, n ir 1 vai 2; R₁ ir tāds, kā definēts 5. pretenzijā, un

R₂ un R₃ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₂)alkilgrups;
R₂ ir neobligāti aizvietota (C₁-C₆)alkilgrups vai (C₂-C₆)alkenilgrups ar lineāru vai sazartu virkni;

R₃ ir neobligāti aizvietota arilgrups;
R₄ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₆)alkilgrups, kas neobligāti var būt ciklizēta kopā ar vienu no tās arilgrupas atomiem, kuras R₃ ir tāds, lai veidotu kondensētu (C₄-C₇)ciklisku grupu, un

R₅ un R₆ ir tādi, kā definēts 1. pretenzijā;
vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

7. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (Ib):

kurā:

Z ir oglekļa vai slāpekļa atoms, n ir 1 vai 2, R₁ ir tāds, kā definēts 5. pretenzijā, R₂ un R₃ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₂)alkilgrups;

R₂ ir neobligāti aizvietota (C₁-C₆)alkilgrups vai (C₂-C₆)alkenilgrups ar lineāru vai sazartu virkni;

R₃ ir neobligāti aizvietota arilgrups;

R₄ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₆)alkilgrups, kas neobligāti var būt ciklizēta kopā ar vienu no tās arilgrupas atomiem, kuras R₃ ir tāds, lai veidotu kondensētu (C₄-C₇)ciklisku grupu, un

R₅ un R₆ ir ūdeņraža atoms vai metilgrups;

vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

8. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas ir viens no šādiem savienojumiem:

- 1) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((4-((1-metilpiperidin-4-il)karbamoil)-2-(trifluormetoksi)fenil)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 2) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-((1-metilpiperidin-4-il)karbamoil)fenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 3) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((4-(4-metilpiperazin-1-il)-2-(trifluormetoksi)fenil)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 4) 8-((4-karbamoil-2-metilfenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 5) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 6) 8-((4-brom-2-metoksifenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 7) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((3-(dimetilamīn)propil)(metil)amīn)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 8) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((4-(dimetilamīn)piperidin-1-il)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds);
- 9) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-(4-metil-1,4-diazepan-1-il)fenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 10) *tert*-butil 4-((3-((2,6-dietilfenil)karbamoil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-il)amīn)-3-metoksibenzoāts;
- 11) 4-((3-((2,6-dietilfenil)karbamoil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-il)amīn)-3-metoksibenzoskābe;
- 12) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((2-(dimetilamīn)etil)(metil)amīn)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 13) 8-((4-karbamoil-2-metoksifenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 14) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((2-(dimetilamīn)etil)karbamoil)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 15) 1-metil-8-((4-((1-metilpiperidin-4-il)karbamoil)-2-(trifluormetoksi)fenil)amīn)-N-fenil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 16) N-(2-etilfenil)-1-metil-8-((4-((1-metilpiperidin-4-il)karbamoil)-2-(trifluormetoksi)fenil)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;

- 17) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-nitrofenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 18) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(2-metoksietil)karbamoil]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 19) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(4-[(4-(dimetilamīn)piperidin-1-il]karbonil)-2-metoksifenil]amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 20) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(2S)-2-(pirolidin-1-il-metil)pirolidin-1-il]karbonil]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 21) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(2R)-2-(pirolidin-1-il-metil)pirolidin-1-il]karbonil]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 22) N-(2-etilfenil)-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 23) N-(2,3-dihidro-1H-inden-5-il)-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 24) 8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-N-(5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-il)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 25) 3-(2,3-dihidro-1H-indol-1-ilkarbonil)-N-[2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-amīns;
- 26) N-(2,6-dimetilfenil)-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 27) N-(2-etil-6-metilfenil)-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 28) 8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-N-(2-metoksifenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 29) N-1,3-benzotiazol-5-il-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 30) N-(2-hlor-6-metilfenil)-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 31) N-[2,6-bis(1-metiletil)fenil]-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 32) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(4-[(2-hidroksietil)karbamoil]-2-metoksifenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 33) 8-[(2-ciān-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 34) 8-[(2-ciān-4-(4-metil-1,4-diazepan-1-il)fenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 35) 8-[(2-hlorfenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 36) 8-[(4-brom-2-ciānfenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 37) 8-[(2-bromfenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 38) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksifenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 39) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(3-pirolidin-1-ilazetidīn-1-il)karbonil]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 40) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-(3-pirolidin-1-ilazetidīn-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 41) N-(2,6-dimetilfenil)-8-[(2-metoksi-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1,5,5-trimetil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 42) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(4-metil-1,4-diazepan-1-il)karbonil]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 43) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(2-metoksietil)amīn]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 44) 8-[(4-brom-2-metoksifenil)amīn]-N-(2,6-dimetilfenil)-1,5,5-trimetil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 45) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-jodofenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 46) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(4-[(3S)-3-(dimetilamīn)pirolidin-1-il]-2-metoksifenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 47) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(4-[(3R)-3-(dimetilamīn)pirolidin-1-il]-2-metoksifenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 48) 8-[(5-brom-2-metoksifenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 49) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-5-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 50) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(4-[(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il]-2-metoksifenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 51) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(4-[(2-(dimetilamīn)etil)amīn]-2-metoksifenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 52) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(2-metoksi-4-[(4-metilpiperazin-1-il)karbonil]fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 53) *tert*-butil 4-[(3-[(2,6-dietilfenil)karbamoil]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-il)amīn]piperidīn-1-karboksilāts;
- 54) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-(piperidin-4-ilamīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīda hidrohlorsāts;
- 55) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(1-(etenilsulfonil)piperidin-4-il)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 56) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(2-(metilamīn)etil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 57) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 58) 8-[(1-acetilpiperidin-4-il)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 59) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-(fenilkarbonil)piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 60) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(1-metilpiperidin-4-il)karbonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 61) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(4-metilpiperazin-1-il)karbonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 62) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-(fenilsulfonil)piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 63) 8-[(1-akriloilpiperidin-4-il)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 64) 8-[(1-benzilpiperidin-4-il)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 65) 8-[(1-[(3-hlorpropil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 66) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-(N-metil-*beta*-alanil)piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 67) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(1-(N,N-dimetil-*beta*-alanil)piperidin-4-il)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 68) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(1-etilpiperidin-4-il)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 69) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(3-(metilamīn)propil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīda hidrohlorsāts;
- 70) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(2-(4-metilpiperazin-1-il)etil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 71) N-(2,6-dietilfenil)-8-[(1-[(2-(dimetilamīn)etil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 72) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(2-piperidin-1-iletil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 73) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-[(1-[(2-morfolin-4-iletil)sulfonil]piperidin-4-il)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;

- 74) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((2-pirolidin-1-iletil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 75) 8-((1-((2-amīnetil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 76) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-(4-pirolidin-1-il)piperidin-1-il)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 77) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-(tetrahidro-2H-piran-4-il)amīn)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 78) *terc*-butil 4-((3-((2,6-dietilfenil)karbamoiļ)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-il)amīn)-3-metilbenzoāts;
- 79) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-((1-metilpiperidin-4-il)amīn)fenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 80) 8-((1-((3-hlormetil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 81) 8-((4-amīn-2-metoksifenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 82) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-((1-metilpiperidin-4-il)karbonil)amīn)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 83) 4-((3-((2,6-dietilfenil)karbamoiļ)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-il)amīn)-3-metilbenzoksābe;
- 84) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((4-(dimetilamīn)piperidin-1-il)karbonil)-2-metilfenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 85) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((2-(dimetilamīn)etil)karbamoiļ)-2-metilfenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 86) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((4-(dimetilamīn)butanoil)amīn)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīda trifluoracetāts;
- 87) 8-((4-brom-2-hlorfenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 88) 8-((2-hlor-4-(4-metilpiperazin-1-il)fenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 89) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((2-metil-4-((2*R*)-2-(pirolidin-1-il)metil)pirolidin-1-il)karbonil)fenil)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 90) 8-((2-hlor-4-((3-(dimetilamīn)propil)(metil)amīn)fenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 91) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((2-metil-4-((4-metil-1,4-diazepan-1-il)karbonil)fenil)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 92) 8-((2-hlor-4-(4-(dimetilamīn)piperidin-1-il)fenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 93) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-((4-hidroksicikloheksil)amīn)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 94) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-((3-piperidin-1-il)propano-il)amīn)fenil)amīn]-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 95) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((2-metil-4-((4-pirolidin-1-il)piperidin-1-il)karbonil)fenil)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 96) 8-((4-(1-azabicyclo[2,2,2]okt-3-ilamīn)-2-metoksifenil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 97) 8-((4-((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metil)-2-metoksifenil)amīn]-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 98) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-(hidroksimetil)-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 99) N-(2,6-dietilfenil)-8-((2-metoksi-4-((4-metilpiperazin-1-il)metil)fenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 100) *terc*-butil 4-((3-((2,6-dietilfenil)karbamoiļ)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-8-il)amīn)-3,3-dimetilpiperidin-1-karboksilāts;
- 101) N-(2,6-dietilfenil)-8-((3,3-dimetil-1-((2-(metilamīn)etil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 102) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((2,2,2-trifluoretil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 103) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((trifluormetil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 104) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(1H-pirazol-4-ilsulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 105) N-(2,6-dietilfenil)-8-((1-(1H-imidazol-4-ilsulfonil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 106) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((4-metil-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoksazin-7-il)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 107) N-(2,6-dietilfenil)-8-((1-(dimetilsulfamoil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 108) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((1-metil-1H-imidazol-4-il)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 109) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(piridin-3-ilsulfonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 110) 8-((1-((4-(acetilamīn)fenil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 111) 8-((1-((4-amīnfenil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīda hidrohlorīds;
- 112) N-(2,6-dietilfenil)-8-((1-((2-hidroksietil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 113) N-(2,6-dietilfenil)-8-((1-((2-metoksietil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 114) 8-((*trans*-4-amīncikloheksil)amīn)-N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 115) N-(2,6-dietilfenil)-8-((1-((2-(etilamīn)etil)sulfonil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 116) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((5-metilizoksazol-4-il)karbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 117) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-((1-metil-1H-imidazol-4-il)karbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 118) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(pirimidin-4-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 119) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(1H-pirol-2-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 120) N-(2,6-dietilfenil)-8-((1-(1H-imidazol-4-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 121) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(piridin-3-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 122) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(piridin-2-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 123) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(1H-pirazol-4-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 124) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(tiofen-3-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 125) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(piridin-4-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 126) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((1-(1H-pirol-3-ilkarbonil)piperidin-4-il)amīn)-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds;
- 127) N-(2,6-dietilfenil)-1-metil-8-((*trans*-4-((2-(metilamīn)etil)sulfonil)amīn)cikloheksil)amīn]-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds un
- 128) N-(2,6-dietilfenil)-8-((4-formil-2-metoksifenil)amīn)-1-metil-4,5-dihidro-1H-pirazolo[4,3-h]hinazolīn-3-karboksamīds.
9. Farmaceutiska kompozīcija, kas kā aktīvo vielu satur savienojumu ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai maisījumā ar pieņemamu šķīdinātāju vai nesējvielu.
10. Savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām terapeitiskai izmantošanai.

11. Savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām slimību, kuras izraisa un/vai kuras saistītas ar izmainītu proteīnkināzes aktivitāti, ārstēšanai.

12. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izmainītā proteīnkināzes aktivitāte ir MPS-1.

13. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 11. vai 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka slimība, kuru izraisa un/vai kura saistīta ar izmainītu proteīnkināzes aktivitāti, ir vēzis vai šūnu proliferatīvie traucējumi.

14. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 13. pretenziju, kas raksturīgs ar to, vēzis ir izvēlēts no karcinomas, kas ir, piemēram, urīnpūšļa, krūts, resnās zarnas, nieru, aknu, plaušu, tostarp sīkšūnu plaušu vēzis, barības vada, žultspūšļa, olnīcu, aizkuņģa dziedzera, kuņģa, dzemdes kakla, vairogdziedzera, prostatas un ādas karcinoma, ieskaitot plakanšūnu karcinomu; limfoido audu hematopoētiskie audzēji, tostarp leukēmija, akūta limfocītiska leukēmija, akūta limfoblastiska leukēmija, B-šūnu limfoma, T-šūnu limfoma, Hodžkina limfoma, ne-Hodžkina limfoma, mataino šūnu limfoma un Bērķita limfoma; mieloīdo šūnu hematopoētiskie audzēji, tostarp akūta un hroniska mielogēnā leukēmija, mielodisplastiskais sindroms un promielocītiskā leukēmija; mezenhimālas izcelsmes audzēji, tostarp fibrosarkoma un rabdomiosarkoma; centrālās un perifērās nervu sistēmas audzēji, tostarp astrocitoma, neiroblastoma, glioma un švannomas; citi audzēji, tostarp melanoma, seminoma, teratokarcinoma, osteosarkoma, pigmenta kseroderma, keratoksantoma, vairogdziedzera folikulu vēzis un Kapoši sarkoma, mezotelioma, ļoti aneiploīdi audzēji un audzēji, kas pārmērīgi ekspresē mitotisko kontrolpunktu komponentus, piemēram, MPS1, MAD2, MAD1, BUB1, BUBR1, BUB3 un citas.

15. *In vitro* paņēmiens proteīnkināzes aktivitātes inhibēšanai, kas ietver minētās kināzes kontaktēšanu ar efektīvu daudzumu savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju.

izstrādājuma apakšslānim: no ūdensnecauraidīgas plēves, kas satur polipienskābi (PLA) vai polihidroksialkanoātus (PHA) vai noārdīšanos veicinošu aģentu saturošu polietilēnu, vai no laminēta ūdensnecauraidīgas plēves un neausta auduma slāņa, turklāt ūdensnecauraidīgā plēve satur PLA, PHA vai noārdīšanos veicinošu aģentu saturošu polietilēnu, un neaustais audums satur PLA, PHA, kokvilnu vai noārdīšanos veicinošu aģentu,

absorbējošajam centrālā slāņa materiālam: no celulozes šķiedrām, augsti absorbējošajam materiālam: no daļiņām, kas satur vismaz 20 % biodegradējamu daļiņu,

aizsargatlokai: no PLA, PHA vai noārdīšanos veicinošu aģentu saturoša neausta auduma,

elastīgajiem līdzekļiem: no lateksa, dabīgā kaučuka vai elastīgiem materiāliem, kas satur poliolefinu kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu,

nostiprināšanas sistēmai: no lenšu pāra un priekšējās lentes, kas izgatavotas no PHA vai PLA, vai noārdīšanos veicinošu aģentu saturoša polietilēna vai polipropilēna;

saistītājlīdzekļiem: no PHA vai PLA saturošiem adhezīviem;

turklāt izstrādājuma virsslānis ir neausts audums ar blīvumu starp 10 un 15 g/m², kas ir veidots no kodola un apvalka tipa divkomponentu šķiedrām ar kodolu, kas satur 80 līdz 100 % polipienskābes, un apvalku, kas satur 80 līdz 100 % polipropilēna.

2. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka necauraidīgais apakšslānis ir zema blīvuma polietilēna plēve ar blīvumu apmēram no 10 līdz 25 g/m², kas satur noārdīšanos veicinošu aģentu, saturošu pārziepota taukskābes un kalciju.

3. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka necauraidīgais apakšslānis ir no polipienskābes izgatavota plēve.

4. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka necauraidīgais apakšslānis ir no polihidroksialkanoātiem veidota plēve.

5. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka necauraidīgais apakšslānis ir laminēts ar neausto audumu ar blīvumu apmēram 10 līdz 15 g/m² un saturošu divkomponentu kodola un apvalka šķiedras ar kodolu, kas satur apmēram 80 līdz apmēram 100 % polipienskābes, un apvalku, kas satur apmēram 80 līdz apmēram 100 % polipropilēna.

6. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka necauraidīgais apakšslānis ir uzklāts neaustajam audumam ar blīvumu apmēram 10 līdz 15 g/m², saturošam divkomponentu kodola un apvalka šķiedras ar kodolu, kas satur apmēram 80 līdz apmēram 100 % polihidroksialkanoāta, un apvalku, kas satur apmēram 80 līdz apmēram 100 % polipropilēna.

7. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka necauraidīgais apakšslānis ir uzklāts neaustajam audumam ar blīvumu apmēram 10 līdz 15 g/m², saturošam vismaz apmēram 20 % kokvilnas šķiedru.

8. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka augsti absorbējošais centrālais slānis ir veidots no celulozes šķiedrām un divu veidu homogēni samaisītām daļiņām:

a) nātrija vai kālija poliakrilāta daļiņām,

b) no kukurūzas cietes iegūtām absorbējošām daļiņām.

9. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka maisījums satur apmēram no 50 līdz apmēram 95 % nātrija vai kālija poliakrilāta daļiņu un no apmēram 5 līdz apmēram 50 % no kukurūzas cietes iegūtu absorbējošu daļiņu.

10. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka ārējie aizsargatloki ir veidoti no neausta auduma plēves ar blīvumu apmēram no 10 līdz apmēram 15 g/m², kas veidota no divkomponentu kodola un apvalka šķiedrām ar kodolu, kas satur apmēram no 80 līdz apmēram 100 % polipienskābes, un apvalku, kas satur apmēram no 80 līdz apmēram 100 % polipropilēna.

11. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka ārējie aizsargatloki ir veidoti no neausta auduma plēves ar blīvumu apmēram no 10 līdz apmēram 15 g/m², kas veidota no divkomponentu

- (51) **A61L 15/62**^(2006.01) (11) **2305862**
D01F 8/06^(2006.01)
A61F 13/15^(2006.01)
A61L 15/60^(2006.01)
A61L 15/26^(2006.01)
- (21) 09742444.4 (22) 08.05.2009
(43) 06.04.2011
(45) 06.01.2016
- (31) 2008006155 (32) 09.05.2008 (33) MX
(86) PCT/IB2009/005526 08.05.2009
(87) WO2009/136271 12.11.2009
- (73) Grupo P.I. Mabe, S.A. de C.V., Av. San Pablo Xochimehuacán No. 7213-E, Colonia La Loma, 72230 Puebla, MX
- (72) CANALES ESPINOSA DE LOS MONTEROS, Carlos, MX
ZAMUDIO AHUMADA, Andrés, MX
SÁNCHEZ FERNÁNDEZ, Lucia, MX
- (74) Gil-Vega, Victor, Corazón de María, 6, E-28002 Madrid, ES
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **VIDEI DRAUDZĪGS VIENREIZLIETOJAMS ABSORBĒJOŠS IZSTRĀDĀJUMS ENVIRONMENTALLY-FRIENDLY DISPOSABLE ABSORBENT ARTICLE**
- (57) 1. Vienreizlietojams absorbējošs izstrādājums, kas satur caurlaidīgu virsslāni, necauraidīgu apakšslāni, starp virsslāni un apakšslāni izvietotu absorbējošu centrālo slāni, kas satur absorbējoša materiāla šķiedras un augsti absorbējoša materiāla daļiņas, ārējus aizsargatlokus, elastīgus līdzekļus viduklim un kājām, nostiprināšanas sistēmu un saistītājlīdzekļus, kas raksturīgs ar to, ka vismaz 50 % šo detaļu satur biodegradējamās vielas, turklāt šīs biodegradējamās vielas ir veidotas no dabā sastopamām vielām tā, lai pēc noteikta laika tās sadalītos un pārvērstos mazāk komplicētās vielās, līdz tās sasniedz to izejas komponentu stāvokli; turklāt biodegradējamās vielas ir izvēlētas: izstrādājuma virsslānim: no kokvilnu saturoša neausta auduma, polipienskābi (PLA) vai polihidroksialkanoātus (PHA) saturoša neausta auduma vai noārdīšanos veicinošu aģentu saturoša neausta auduma,

kodola un apvalka šķiedrām ar kodolu, kas satur apmēram no 80 līdz apmēram 100 % polihidroksialkanoātu, un apvalku, kas satur apmēram no 80 līdz apmēram 100 % polipropilēna.

12. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka ārējie aizsargatloki ir veidoti no neausta auduma plēves ar blīvumu apmēram no 10 līdz apmēram 15 g/m², kas satur vismaz 15 % kokvilnas šķiedru.

13. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka izstrādājuma kāju un vidukļa elastīgie līdzekļi ir latekss vai dabiskais kaučuks.

14. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka izstrādājuma kāju un vidukļa elastīgie līdzekļi ir izgatavoti no poliolefiniem kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu.

15. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka izstrādājuma nostiprināšanas sistēma sastāv no sasiešanas lenšu pāra, kas novietotas vidukļa mugurpusē, un lentes, kas novietota tā vidukļa priekšējās daļas ārpusē, turklāt sasiešanas lentes un/vai lente ir veidotas no poliolefiniem kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu, saturošu pārziepotas taukskābes un kalciju.

16. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka nostiprināšanas sistēma sastāv no sasiešanas lenšu pāra, kas novietotas vidukļa mugurpusē, un lentes, kas novietota tā vidukļa priekšējās daļas ārpusē, turklāt sasiešanas lentes un/vai lente satur polipienskābi vai polihidroksialkanoātus.

17. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas satur elastīgas zonas, kas sastāv no starp divām plēvēm ievietota elastomēra materiāla, turklāt elastomēra materiāls ir poliolefīns kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu, saturošu pārziepotas taukskābes un kalciju, un plēves ir neaustas plēves.

18. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas satur elastīgas zonas, kas sastāv no starp divām plēvēm ievietota elastomēra materiāla, turklāt elastomēra materiāls ir poliolefīns kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu, saturošu pārziepotas taukskābes un kalciju, un plēves ir neausts audums ar blīvumu apmēram no 10 līdz 15 g/m², kuru veido divkomponentu kodola un apvalka šķiedras ar kodolu, kas satur apmēram no 80 līdz apmēram 100 % polipienskābes, un apvalku, kas satur apmēram no 80 līdz apmēram 100 % polipropilēna.

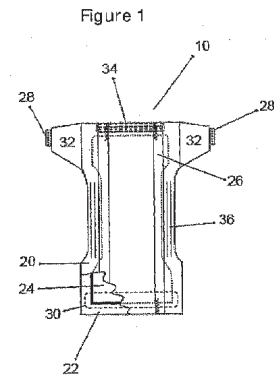
19. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas satur elastīgas zonas, kas sastāv no starp divām plēvēm ievietota elastomēra materiāla, turklāt elastomēra materiāls ir poliolefīns kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu, saturošu pārziepotas taukskābes un kalciju, un plēves ir neausts audums ar blīvumu apmēram no 10 līdz 15 g/m², kuru veido divkomponentu kodola un apvalka šķiedras ar kodolu, kas satur apmēram 80 līdz apmēram 100 % polihidroksialkanoātu, un apvalku, kas satur apmēram 80 līdz apmēram 100 % polipropilēna.

20. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas satur elastīgas zonas, kas sastāv no starp divām plēvēm ievietota elastomēra materiāla, turklāt elastomēra materiāls ir poliolefīns kopā ar noārdīšanos veicinošu aģentu, saturošu pārziepotas taukskābes un kalciju, un plēves ir neausts audums ar blīvumu apmēram no 10 līdz 15 g/m², kuras satur vismaz apmēram 20 % kokvilnas šķiedru.

21. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas satur kompozīciju ādas kopšanai, kas ir augu eļļas, galvenokārt avokado eļļu un saldo mandeļu eļļu saturošs sastāvs.

22. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas satur kompozīciju ādas kopšanai, kas ir ēterisko eļļu maisījumu saturošs sastāvs.

23. Vienreizlietojamais absorbējošais izstrādājums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas kā dezodorantu satur hlorofilu vai hlorofila atvasinājumus.



- (51) **C12N 5/10**^(2006.01) (11) **2313495**
C12N 15/81^(2006.01)
C12P 7/10^(2006.01)
C12R 1/645^(2006.01)
C12N 9/92^(2006.01)
C12P 19/24^(2006.01)
- (21) 09772164.1 (22) 01.07.2009
(43) 27.04.2011
(45) 02.12.2015
(31) 102008031350 (32) 02.07.2008 (33) DE
(86) PCT/EP2009/004762 01.07.2009
(87) WO2010/000464 07.01.2010
(73) Lesaffre et Compagnie, 41, rue Etienne Marcel, 75001 Paris, FR
(72) BRAT, Dawid, DE
BOLES, Eckhard, DE
KELLER, Marco, DE
ROTHER, Beate, DE
(74) Cabinet Plasseraud, 52, rue de la Victoire, 75440 Paris Cedex 09, FR
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
(54) **PROKARIOTU KSILOZES IZOMERĀZE KSILOZI FERMENTĒJOŠU RAUGU KONSTRUĒŠANAI**
PROKARYOTIC XYLOSE ISOMERASE FOR THE CONSTRUCTION OF XYLOSE FERMENTING YEASTS
(57) 1. Nukleīnskābes molekulas, kas ietver prokariotu ksilozes izomerāzi (XI) kodējošu nukleīnskābes sekvenci, kas ir par vismaz 95 % identiska, labāk par 99 % identiska nukleīnskābes sekvencei atbilstoši SEQ ID NO: 2, vai, kas ir par vismaz 95 % identiska, labāk par 99 % identiska nukleīnskābes sekvencei atbilstoši SEQ ID NO: 3, izmantošana šūnas transformēšanai priekš rekombinantas ksilozes izomerāzes ekspresijas un producēšanas, un/vai ksilozes pārveidošanas par ksilulozi ar šūnas palīdzību, turklāt ksilozes izomerāze (XI) tiek iegūta no *Clostridium phytofermentans* un ietver aminoskābes sekvenci, kas ir par vismaz 95 % identiska, labāk par 99 % identiska aminoskābes sekvencei atbilstoši SEQ ID NO: 1.
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju
- ksilozī saturoša biomateriāla pārveidošanai un/vai metabolīmam,
- bioloģiskas izcelsmes ķīmisku vielu ražošanai,
- biobutanola un/vai bioetanola ražošanai.
3. Izmantošana saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt prokariotu ksilozes izomerāzi (XI) kodējošā nukleīnskābes sekvence SEQ ID NO: 3 ietver kodonoptimizētu nukleīnskābes sekvenci izmantošanai saimnieciskūnā.
4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt nukleīnskābes molekula ir promotera un terminatora sekvences ietverošs nukleīnskābes ekspresijas konstrukts, turklāt promoters ir funkcionāli pievienots ksilozes izomerāzi (XI) kodējošai nukleīnskābes sekvencei, turklāt labāk, ja nukleīnskābes ekspresijas konstrukts ietver arī 5' un/vai 3' atpazīšanas sekvences un/vai atlases marķierus.
5. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt šūna ir rauga šūna vai filamentus veidojošas sēnes

šūna, turklāt vēlams, ka rauga šūna ir ģints, kas izvēlēta no grupas *Saccharomyces*, *Kluyveromyces*, *Candida*, *Pichia Schizosaccharomyces*, *Hansenula*, *Kloeckera*, *Schwanniomyces*, *Arxula* un *Yarrowia* locekle, labāk, ir viena no sugas, kas izvēlēta no grupas *S. cerevisiae*, *S. bulderi*, *S. barnetti*, *S. exiguus*, *S. uvarum*, *S. diastaticus*, *K. lactis*, *K. marxianus* un *K. fragilis*, locekle, turklāt īpaši vēlams, ka filamentus veidojošas sēnes šūna ir ģints, kas izvēlēta no grupas *Aspergillus*, *Trichoderma*, *Humicola Acremonium*, *Fusarium*, un *Penicillium*, locekle.

6. Ar nukleīnskābes ekspresijas konstruktū pārveidota šūna, kas ietver:

a) prokariotu ksilozes izomerāzi (XI) kodējošu nukleīnskābes sekvenci, turklāt ksilozes izomerāze (XI) tiek iegūta no *Clostridium phytofermentans* un satur aminoskābes sekvenci, kas ir par vismaz 95 % identiska, labāk par 99 % identiska aminoskābes sekvencei atbilstoši SEQ ID NO: 1,

b) promoteru, kas ir funkcionāli saistīts ar nukleīnskābes sekvenci, tādējādi padarot iespējamu ksilozes izomerāzes (XI) ekspresiju šūnā, turklāt nukleīnskābes ekspresijas konstrukta ekspresija nodrošina šūnas spēju izomerizēt ksilozi par ksilulozi tieši, turklāt šūna ir eikariotiska šūna un turklāt šūna ir transformēta ar nukleīnskābes molekulu, kā definēts 1. līdz 5. pretenzijā.

7. Šūna saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt šūna ir rauga šūna vai filamentus veidojošas sēnes šūna, turklāt vēlams, ka rauga šūna ir ģints, kas izvēlēta no grupas *Saccharomyces*, *Kluyveromyces*, *Candida*, *Pichia*, *Schizosaccharomyces*, *Hansenula*, *Kloeckera*, *Schwanniomyces*, *Arxula* un *Yarrowia*, locekle, labāk, ir viena no sugas, kas izvēlēta no grupas *S. cerevisiae*, *S. bulderi*, *S. barnetti*, *S. exiguus*, *S. uvarum*, *S. diastaticus*, *K. lactis*, *K. marxianus* un *K. fragilis* locekle, turklāt īpaši vēlams, ka filamentus veidojošas sēnes šūna ir ģints kas izvēlēta no grupas *Aspergillus*, *Trichoderma*, *Humicola*, *Acremonium*, *Fusarium* un *Penicillium* locekle.

8. Šūna saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 7. pretenzijai, kas ir pārējoši vai nemainīgi pārveidota ar nukleīnskābes ekspresijas konstruktū vai nukleīnskābes molekulu, kā definēts 1. līdz 5. pretenzijā.

9. Šūna saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 8. pretenzijai, kas turklāt ekspresē vienu vai vairākus enzīmus, kas dod šūnai spēju veidot papildu metabolisma produktus, turklāt vēlams, ka papildu metabolisma produkti ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no bioloģiskas izcelsmes ķīmiskām vielām, piemēram, pienskābes, etiķskābes, dzintarskābes, ābolskābes, 1-butanola, izobutanola, 2-butanola, citiem spirtiem, aminoskābēm, 1,3-propāndiols, etilēna, glicerīna, beta-laktāma antibiotikām vai cefalosporīna, alkāniem, terpēniem, izoprenoīdiem vai pretmalārijas aktīvās sastāvdaļas artemisinīna amorfa diēna prekursora molekulas.

10. Šūnas izmantošana saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 8. pretenzijai ksilozi saturoša biomateriāla pārveidošanai un metabolismam, īpaši fermentācijai, un/vai bioetanola ražošanai.

11. Šūnas izmantošana saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 9. pretenzijai ksilozi saturoša biomateriāla pārveidošanai un metabolismam, īpaši fermentācijai, un/vai metabolisma produkta ražošanai, turklāt vēlams, ka metabolisma produkts ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no bioloģiskas izcelsmes ķīmiskām vielām, piemēram, pienskābes, etiķskābes, dzintarskābes, ābolskābes, 1-butanola, izobutanola, 2-butanola, citiem spirtiem, aminoskābēm, 1,3-propāndiols, etilēna, glicerīna, beta-laktāma antibiotikām vai cefalosporīna, alkāniem, terpēniem, izoprenoīdiem vai pretmalārijas aktīvās sastāvdaļas artemisinīna amorfa diēna prekursora molekulas.

12. Bioetanola ražošanas metode, kas ietver šādus soļus:

a) ksilozes avotu saturošas vides reakciju ar šūnu saskaņā ar 6. līdz 8. pretenziju, kas pārvērš ksilozi etanolā,

b) neobligāti, etanola iegūšanu, turklāt labāk, ja vide satur papildu oglekļa avotu, galvenokārt glikozi.

13. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt bioetanola ražošanas notiek ar ātrumu vismaz 0,03 g etanola uz 1 g rauga sausas vienas stundā.

14. Metodes saskaņā ar jebkuru no 12. līdz 13. pretenzijai, turklāt etanola ieguves apjoms ir vismaz 0,3 g etanola uz 1 g ksilozes.

15. Metode metabolisma produkta ražošanai, kas ietver soļus:

a) ksilozes avotu saturošas vides reakciju ar šūnu saskaņā ar 9. pretenziju, kas pārvērš ksilozi, lai ražotu metabolisma produktu,

b) neobligāti, metabolisma produkta iegūšanu, turklāt vēlams, ka metabolisma produkts ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no bioloģiskas izcelsmes ķīmiskām vielām, piemēram, pienskābes, etiķskābes, dzintarskābes, ābolskābes, 1-butanola, izobutanola, 2-butanola, citiem spirtiem, aminoskābēm, 1,3-propāndiols, etilēna, glicerīna, beta-laktāma antibiotikām vai cefalosporīna, alkāniem, terpēniem, izoprenoīdiem vai pretmalārijas aktīvās sastāvdaļas artemisinīna amorfa diēna prekursora molekulas, turklāt labāk, ja vide satur papildu oglekļa avotu, galvenokārt glikozi.

- (51) **C07K 16/28**^(2006.01) (11) **2322556**
A61K 39/395^(2006.01)
C07K 16/18^(2006.01)
- (21) 10177407.3 (22) 02.09.2005
(43) 18.05.2011
(45) 21.10.2015
(31) 607377 P (32) 03.09.2004 (33) US
(62) EP05810856.4 / EP1784426
(73) Genentech, Inc., 1 DNA Way, South San Francisco CA 94080-4990, US
(72) DENNIS, Mark, S., US
FONG, Sherman, US
(74) Walton, Sejin Malcolm, et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **HUMANIZĒTI ANTI-BETA-7 ANTAGONISTI UN TO PIELIETOJUMI**
HUMANIZED ANTI-BETA7 ANTAGONISTS AND USES THEREFOR
- (57) 1. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:
HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDDLLH (SEQ ID NO: 9), KYASQSSIS (SEQ ID NO: 2), QQGNSLPNT (SEQ ID NO: 3), GFFITNNYWG (SEQ ID NO: 4), GYISYSGSTSYNPSLKS (SEQ ID NO: 5) un ARTGSSGYFDF (SEQ ID NO: 64).
2. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:
HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDDLLH (SEQ ID NO: 9), KYASQSSIS (SEQ ID NO: 2), QQGNSLPNT (SEQ ID NO: 3), GFFITNNYWG (SEQ ID NO: 4), GYISYSGSTSYNPSLKS (SEQ ID NO: 5) un MTGSSGYFDF (SEQ ID NO: 6).
3. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:
HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDDLLH (SEQ ID NO: 9), KYASQSSIS (SEQ ID NO: 2), QQGNSLPNT (SEQ ID NO: 3), GFFITNNYWG (SEQ ID NO: 4), GYISYSGSTSYNPSLKS (SEQ ID NO: 5) un AMTGSSGYFDF (SEQ ID NO: 63).
4. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:
HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDDLLH (SEQ ID NO: 9), KYASQSSIS (SEQ ID NO: 2), QQGNSLPNT (SEQ ID NO: 3), GFFITNNYWG (SEQ ID NO: 4), GYISYSGSTSYNPSLKS (SEQ ID NO: 5) un RTGSSGYFDF (SEQ ID NO: 66).
5. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:
HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDSLLH (SEQ ID NO: 7), SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 5 un SEQ ID NO: 64.
6. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:
HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDSLLH (SEQ ID NO: 7), SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 5 un SEQ ID NO: 6.
7. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:

HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver RASESVDTLH (SEQ ID NO: 8), SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 5 un SEQ ID NO: 64.

8. Izdalīta nukleīnskābe, kas kodē humanizētu anti-*beta*-7 antivielu, kura ietver:

HVR-L1, HVR-L2, HVR-L3, HVR-H1, HVR-H2 un HVR-H3, turklāt katrs pēc kārtas ietver ASESVDTLH (SEQ ID NO: 8), SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 5 un SEQ ID NO: 6.

9. Vektors, kas ietver nukleīnskābi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai.

10. Saimniekšūna, kas ietver vektoru saskaņā ar 9. pretenziju.

11. Saimniekšūna saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt saimniekšūna ir prokariotiska šūna.

12. Saimniekšūna saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt saimniekšūna ir *E. coli*.

13. Saimniekšūna saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt saimniekšūna ir eikariotiska šūna.

14. Saimniekšūna saskaņā ar 13. pretenziju, turklāt saimniekšūna ir zīdītāja šūna.

15. Saimniekšūna saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt saimniekšūna ir Ķīnas kāmjā olnīcu šūna.

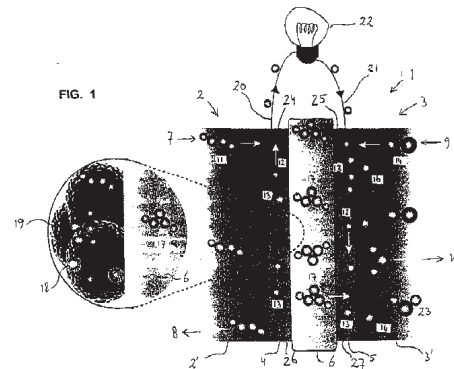
16. Metode humanizētas anti-*beta*-7 antivielas iegūšanai, turklāt minētā metode ietver rekombinanta vektora saskaņā ar 9. pretenziju ekspresiju saimniekšūnā saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 15. pretenzijai un minētās antivielas izdalīšanu.

6. Elektroķīmiska šūna, kas satur elektroda kameru saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai.

7. Vienlaidus mikroemulsija, kas ietver hidrofobu fāzi un virsmaktīvu vielu, kā arī katalizatoru vismaz vienā no fāzēm – hidrofilajā vai hidrofobajā fāzē, pie kam katalizators ir ģenerēts *in situ* nogulsnešanās reakcijā, reducējot metāla kompleksu, un minētā vienlaidus mikroemulsija tiek iegūta, samaisot (i) pirmo nepārtrauktas darbības mikroemulsiju, kas satur hidrofilo fāzi, hidrofobo fāzi un virsmaktīvu vielu, pie tam vienlaidus mikroemulsijas katalizatora materiāla sāls vai metāla komplekss tiek padots uz hidrofilo fāzi, ar (ii) otro vienlaidus mikroemulsiju, kas satur hidrofilo fāzi, hidrofobo fāzi un virsmaktīvu vielu, kas papildus satur reducējošu materiālu, pie tam maisīšanas rezultātā notiek nogulsnešanās reakcija, kurā veidojas katalizators.

8. Elektroda kameras saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai atjaunināšanas sistēma, kas sastāv no rezerves konteineru, kurš satur vienlaidus mikroemulsiju saskaņā ar 7. pretenziju un uzglabāšanas konteineru izlietotajai vienlaidus mikroemulsijai, kabeļkanālus katra konteineru savienošanai ar elektroda kameru un transportēšanas elementu emulsijas virzīšanai.

9. Atjaunināšanas sistēma saskaņā ar 8. pretenziju, kas ietver rezerves konteinerus un piegādes līdzekli vismaz viena oksidētāja, reducētāja un fluīda piegādei elektroda kamerai.



- (51) **H01M 4/88**^(2006.01) (11) **2335313**
- H01M 4/90**^(2006.01)
- H01M 4/92**^(2006.01)
- H01M 4/86**^(2006.01)
- H01M 8/04**^(2006.01)
- H01M 8/10**^(2006.01)
- (21) 09737480.5 (22) 06.10.2009
- (43) 22.06.2011
- (45) 23.03.2016
- (31) 2002071 (32) 07.10.2008 (33) NL
- (86) PCT/NL2009/050596 06.10.2009
- (87) WO2010/041937 15.04.2010
- (73) CarbonX B.V., Julianalaan 136, 2628 BL Delft, NL
- (72) VAN RAALTEN, Rutger Alexander David, NL
- KOWLGI, Krishna Narayan Kumar, NL
- KOPER, Gerardus Joseph Maria, NL
- (74) Nederlandsch Octrooibureau, P.O. Box 29720, 2502 LS The Hague, NL
- Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **ELEKTRODA KAMERA ELEKTROĶĪMISKAI ŠŪNAI, TĀS ATJAUNINĀŠANAS SISTĒMA UN ŠIM NOLŪKAM IZMANTOJAMA EMULSIJA**
ELECTRODE COMPARTMENT FOR AN ELECTROCHEMICAL CELL, A REFRESHING SYSTEM FOR IT AND AN EMULSION TO BE USED THEREFORE

(57) 1. Elektroda kamera elektroķīmiskai šūnai, kas satur binepārtrauktu/vienlaidus (angliski *bicontinuous*; vāciski *bikontinuierliche*) mikroemulsiju, pie kam katalītiskas daļas tiek ģenerētas *in situ* nogulsnešanās reakcijā minētajā vienlaidus mikroemulsijā.

2. Elektroda kamera saskaņā ar 1. pretenziju kā katoda kamera.

3. Elektroda kamera saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā ietver padeves sistēmu skābekļa padevei uz kameru.

4. Elektroda kamera saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka tā ir atjaunināšanas sistēmas daļa ar rezerves konteineru emulsijai un uzglabāšanas konteineru izmantotajai emulsijai, kabeļkanāliem katra konteineru savienošanai ar elektroda kameru un transportēšanas elementu, piemēram, sūkni, emulsijas virzīšanai.

5. Elektroda kamera saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka sistēma satur arī piegādes līdzekli vismaz viena oksidētāja, reducētāja un fluīda piegādei.

- (51) **C12N 15/113**^(2010.01) (11) **2350279**
- A61K 31/711**^(2006.01)
- (21) 09748890.2 (22) 22.10.2009
- (43) 03.08.2011
- (45) 27.01.2016
- (31) 196995 P (32) 22.10.2008 (33) US
- 198931 P 11.11.2008 US
- PCT/IL2009/000179 15.02.2009 WO
- (86) PCT/US2009/061570 22.10.2009
- (87) WO2010/048352 29.04.2010
- (73) Quark Pharmaceuticals, Inc., 6501 Dumbarton Circle, Fremont, California 94555, US
- (72) FEINSTEIN, Elena, IL
- ALPERT, Evgenia, IL
- METT, Igor, IL
- BAR-ILAN, Amir, IL
- SPIVAK, Igor, IL
- KALINSKI, Hagar, IL
- SLAGER, Netanja, IL
- (74) Sellin, Carole, et al, Ernest Gutmann - Yves Plasseraud S.A.S, 88, Boulevard des Belges, 69452 Lyon Cedex 06, FR
- Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **METODES ACU SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**
METHODS FOR TREATING EYE DISORDERS
- (57) 1. Divpavedienu RNS savienojums ar šādu struktūru:
5' iB-GCCAGAAUGUGGAACUCCU 3' (kodējošais pavediens; SEQ ID NO: 9015),
3' CGGUCUACACCUUGAGGA 5' (nekodējošais pavediens; SEQ ID NO: 9516),
turklāt katrs A, C, U un G ir ribonukleotīds, un katrs sekojošais ribonukleotīds ir savienots ar nākamo ribonukleotīdu ar fosfodiesteru saiti;

turklāt kodējošais pavediens, skaitot no 5' gala, satur nemo-modificētu ribonukleotīdu 1., 2., 3., 4., 5., 6., 7., 8., 9., 10., 11., 12., 13., 14., 15., 16., 17. un 19. pozīcijā, L-dezoksicitidīnu 18. pozīcijā un invertēta dezoksiabāziska fragmenta (iB) 5' gala "cepuri" (5' cap); un

turklāt nekodējošais pavediens, skaitot no 5' gala, satur 2'-O-ME cukura modificētu ribonukleotīdu 2., 4., 6., 8., 11., 13., 15., 17. un 19. pozīcijā un nemo-modificētu ribonukleotīdu 1., 3., 5., 7., 9., 10., 12., 14., 16. un 18. pozīcijā; vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētā invertētā dezoksiabāziskā fragmenta (iB) 5' "cepure" ir invertēts abāzisks dezoksiribozes fragments.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētā invertētā dezoksiabāziskā fragmenta (iB) 5' "cepure" ir 3',5' invertēts abāzisks dezoksiribozes 5'-fosfāts.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai terapijā.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai terapijā pacienta, kas sirgst ar acu slimību, redzes traucējumu, acu traumā, redzes lauka zudumu, ārstēšanai, vai acu neiroprotekcijas nodrošināšanai.

6. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt acu slimība, redzes traucējums vai acu trauma ir saistīta ar patoloģiskām anomālīgām/izmaiņām redzes sistēmas audos; un/vai, kur acu slimība, redzes traucējums vai acu trauma ietver neirodeģenerāciju; un/vai, kur acu slimība, redzes traucējums vai acu trauma ir saistīta ar tīklenes ganglija šūnu zudumu vai ar tīklenes ganglija šūnu bojājumu.

7. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt tīklenes ganglija šūnu zudums vai tīklenes ganglija šūnu bojājums ir paaugstināta acs iekšējā spiediena (AIS) mediēts.

8. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt redzes lauka zudums ir saistīts ar tīklenes ganglija šūnu bojāeju.

9. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt acu slimība, redzes traucējums vai acu trauma ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no okulāras neiropatijas, paaugstināta acs iekšējā spiediena (AIS), glaukomas, sausās acs, Šēgrēna sindroma, diabētiskās retinopātijas (DR), diabētiskās makulas tūskas (DMT), ar vecumu saistītas makulas deģenerācijas (VMD), optiskā neirīta, tīklenes centrālās vēnas oklūzijas, tīklenes vēnas zaru oklūzijas, išēmiskās optiskās neiropatijas, redzes nerva traumas, neiznēsātu bērnu retinopātijas (NBR), pigmentozā retinīta (PR), tīklenes gangliju deģenerācijas, makulas deģenerācijas, pārmantotās optiskās neiropatijas, Lēbera pārmantotās optiskās neiropatijas, metabolās optiskās neiropatijas, toksiskas vielas izraisītas neiropatijas un zāļu blakņu vai vitamīnu trūkuma izraisītas neiropatijas.

10. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt išēmiskā optiskā neiropatija ietver priekšējo išēmisko optisko neiropatiju un/vai aizmugurējo išēmisko optisko neiropatiju.

11. Kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli un farmaceitiski pieņemamu palīgvielu vai nesēju, vai to maisījumu.

12. Kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai daudzumā, kas ir efektīvs CASP2 gēna ekspresijas mazināšanai acs šūnā, kas izvēlēta no grupas, kura sastāv no asaru dziedzera acinārās šūnas, asaru dziedzera duktālās šūnas, tīklenes ganglija šūnas (TGŠ), tīklenes pigmenta epitēlija (TPE) šūnas, horoidālās šūnas, radzenes šūnas, cilīrajā procesā iesaistītās šūnas un trabekulārā tīkla šūnas vai to kombinācijas.

13. Kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt savienojuma gala koncentrācija ir no aptuveni 5 µg/µl līdz 60 µg/µl no kompozīcijas tilpuma.

14. Kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt šī kompozīcija ir veidota kā krēms, putas, pasta, ziede, emulsija, šķidrums, šķīdums, acu pilieni, gels, aerosols, suspensija, mikroemulsija, mikrosfēras, mikrokapsulas, nanosfēras, nanodaļiņas, lipīdu vezikulas, liposomas, polimēru vezikulas, plāksteris vai kontaktlēca.

15. Kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt šī kompozīcija ir veidota kā acu pilieni.

16. Kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt šī kompozīcija ir veidota kā šķidrums šķīdums intravitreālai injekcijai.

(51) **H02H 7/04**^(2006.01)
H02M 5/22^(2006.01)

(11) **2356728**

(21) 09775264.6

(22) 08.12.2009

(43) 17.08.2011

(45) 06.01.2016

(31) 0822404

(32) 09.12.2008

(33) GB

(86) PCT/GB2009/051661

08.12.2009

(87) WO2010/067104

17.06.2010

(73) Southern Fox Investments Limited, Queensgate House, South Church Street, Grand Cayman, KY

(72) JUBY, Lee, GB

RILEY, Philip M., GB

MANGAN, Stephen, GB

(74) Harrison Goddard Foote, Belgrave Hall, Belgrave Street, Leeds LS2 8DD, GB

Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV

(54) **SPRIEGUMA SAMAZINĀŠANAS IERĪCES PĀRSLODZES AIZSARDZĪBA**

OVERLOAD PROTECTION OF A VOLTAGE REDUCTION DEVICE

(57) 1. Sistēma maiņstrāvas sprieguma samazināšanai no elektroapgādes avota slodzes patērētājam ar mērķi uzlabot energoefektivitāti, pie kam šī sistēma satur:

a) transformatoru (13), kuram ir primārais un sekundārais tinums ķēdē starp maiņstrāvas elektroapgādes avotu un slodzi, un

b) šuntēšanas līdzekli, lai transformatoru izslēgtu no ķēdes un elektroapgādes avotu savienotu tieši ar slodzi transformatora iepriekš noteiktas pārslodzes gadījumā,

kas raksturīga ar to, ka:

c) šuntēšanas līdzeklis satur:

i) šuntēšanas slēdzi (S), lai novirzītu apgādes avotu tieši uz slodzi,

ii) līdzekli (14), lai noteiktu transformatora temperatūru,

iii) līdzekli (17), lai mērītu elektrisko strāvu caur slodzi,

iv) vadības līdzekli (15), lai saņemtu signālus no temperatūras noteikšanas līdzekļa un no strāvas mērīšanas līdzekļa un lai darbinātu šuntēšanas slēdzi minētās temperatūras un/vai strāvas maksimālajā iepriekš noteiktajā līmenī;

un raksturīga ar to, ka šī sistēma papildus satur:

d) drošības līdzekli, lai pārtrauktu strāvu caur transformatora sekundāro tinumu gadījumā, ja šuntēšanas slēdzis nenostādā vismaz vienā no iepriekš noteiktajiem maksimālajiem līmeņiem, turklāt drošības līdzeklis ietver:

i) termisku atslēgšanas ierīci (TCO), kas savienota ar transformatora sekundāro tinumu un pielāgota tā, lai pārtrauktu transformatora sekundārā tinuma savienojumu ar elektroapgādes avotu transformatora iepriekš noteiktajā paaugstinātajā temperatūrā pēc iepriekš noteiktā laika posma,

ii) drošinātāju (F2), kas ir saslēgts virknē ar elektroapgādes avotu un termisko atslēgšanas ierīci un ir pielāgots tā, lai pārtrauktu transformatora sekundārā tinuma savienojumu ar elektroapgādes avotu iepriekš noteiktajā paaugstinātajā strāvas līmenī zem termiskās atslēgšanas ierīces maksimālās strāvas vērtības.

2. Sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt elektroapgādes avots ir savienots ar transformatora sekundāro tinumu.

3. Sistēma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt drošinātājs (F2) ir aizsargāts no kļūdainas pārtraukšanas ar pastāvīgo strāvas mērīšanas līdzekli (17), kas ar vadības līdzekļa palīdzību ir pielāgots tā, lai darbinātu šuntēšanas slēdzi (S) strāvas līmenī zem drošinātāja maksimālās strāvas vērtības.

4. Sistēma saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kas ietver elektroapgādes avota drošinātāju (F1), kas pieslēgts starp elektroapgādes avotu un slodzi un pielāgots tā, lai aizsargātu slodzi, kad transformators ir šuntēts.

5. Sistēma saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas ietver jaudas pārveidotāju (12), kas pieslēgts starp elektroapgādes avotu un transformatora primāro tinumu.

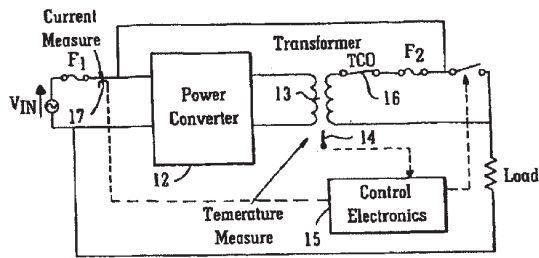


FIG. 11

- (51) **C07D 473/30**^(2006.01) (11) **2356987**
C07D 473/34^(2006.01)
C07D 487/04^(2006.01)
A61K 31/519^(2006.01)
A61K 31/52^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
A61K 31/353^(2006.01)
C07D 311/80^(2006.01)
A61P 1/08^(2006.01)
A61P 3/00^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
- (21) 10179374.3 (22) 18.11.2005
(43) 17.08.2011
(45) 06.01.2016
(31) 919568 P (32) 23.03.2007 (33) US
630556 P 22.11.2004 US
- (62) EP05807597.9 / EP1824475
(73) EURO-CELTIQUE S.A., 2, avenue Charles de Gaulle, 1653 Luxembourg, LU
(72) GUTMAN, Arie L., IL
NISNEVICH, Gennady A., IL
RUKHMAN, Igor, IL
TISHIN, Boris, IL
ETINGER, Marina M., IL
FEDOTEV, Irina M., IL
PERTSIKOV, Boris M., IL
KHANOLKAR, Ram, IN
- (74) Vos, Derk, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstraße 3, 80335 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **METODES TRANS(-)-DELTA⁹-TETRAHIDROKANABINOLA UN TRANS(+)-DELTA⁹-TETRAHIDROKANABINOLA ATĪRĪŠANAI**
METHODS FOR PURIFYING TRANS(-)-DELTA⁹-TETRAHYDROCANNABINOL AND TRANS(+)-DELTA⁹-TETRAHYDROCANNABINOL
- (57) 1. Metode piemaisījumu aizvākšanai no kompozīcijas, kas satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu, pirms (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola kristalizācijas, turklāt metode ietver: (a) *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola un *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola pakļaušanu kontaktam ar pirmo organisko šķīdinātāju, kas nejaucas ar ūdeni, spirtu, kas jaucas ar ūdeni, ūdeni un sārmu metāla hidroksīdu, tādējādi veidojot divfāzu kompozīciju, kas satur (i) pirmo organisko fāzi un (ii) spirta kaustisko fāzi, kura satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu;
(b) spirta kaustiskās fāzes, kas satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu, atdalīšanu no pirmās organiskās fāzes;
(c) spirta kaustiskās fāzes pakļaušanu kontaktam ar skābi, lai iegūtu ar skābi apstrādātu spirta fāzi.
2. Metode piemaisījumu aizvākšanai no kompozīcijas, kas satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu vai *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu, pirms (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola kristalizācijas, turklāt metode ietver:
(a) *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola vai *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola pakļaušanu kontaktam ar pirmo organisko šķīdinātāju,

kas nejaucas ar ūdeni, spirtu, kas jaucas ar ūdeni, ūdeni un sārmu metāla hidroksīdu, tādējādi veidojot divfāzu kompozīciju, kas satur (i) pirmo organisko fāzi un (ii) spirta kaustisko fāzi, kura satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu vai *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu;
(b) spirta kaustiskās fāzes, kas satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu vai *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu, atdalīšanu no pirmās organiskās fāzes;
(c) spirta kaustiskās fāzes pakļaušanu kontaktam ar skābi, lai iegūtu ar skābi apstrādātu spirta fāzi.

3. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt skābe ir citronskābe vai etiķskābe.

4. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt skābe tiek pievienota daudzumā, kas ir pietiekams, lai sasniegtu pH no 5 līdz 9.

5. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas ietver šādu papildu soli:

(d) ar skābi apstrādātās spirta fāzes pakļaušanu kontaktam ar otro organisko šķīdinātāju, kas nejaucas ar ūdeni, lai veidotu (i) otro organisko fāzi, kas satur Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un (ii) ar skābi apstrādātu spirta fāzi.

6. Metode saskaņā ar 5. pretenziju, kas ietver šādu papildu soli:

(e) otrās organiskās fāzes atdalīšanu no ar skābi apstrādātās spirta fāzes.

7. Metode kristāliska (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola iegūšanai, kas ietver:

ļaušanu *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolam un *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolam kristalizēties no pirmās kompozīcijas, kas satur *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu, *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un nepolāru organisku šķīdinātāju, lai iegūtu kristālisku (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu, turklāt pirmā kompozīcija tika iegūta,

(a) realizējot metodi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai,

(b) izdalot Δ^9 -tetrahidrokanabinolu no rezultātā iegūtās Δ^9 -tetrahidrokanabinolu saturošās fāzes un

(c) soļā (b) Δ^9 -tetrahidrokanabinolu pakļaujot kontaktam ar nepolāru organisku šķīdinātāju un eventuāli tā enantiomēru, lai veidotu pirmo kompozīciju.

8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt nepolārais organiskais šķīdinātājs ir lineāras virknes vai sazarotas virknes (C_4 - C_{10}) alifātisks ogļūdeņradis, (C_4 - C_{10}) cikloalifātisks ogļūdeņradis vai jebkurš to maisījums, turklāt labāk, ja lineārās virknes vai sazarotās virknes ogļūdeņradis ir pentāns, heksāns, heptāns, izooktāns vai jebkurš to maisījums, un vēl labāk, ja tas ir *n*-heptāns.

9. Metode *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola kompozīcijas gatavošanai, kas ietver:

ļaušanu kompozīcijai, kas satur (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un eluējošu šķīdinātāju, sadalīties hirālā stacionārā fāzē, lai iegūtu *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola kompozīciju, vai

trans-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola kompozīcijas gatavošanai, kas ietver:

ļaušanu kompozīcijai, kas satur (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinolu un eluējošu šķīdinātāju, sadalīties hirālā stacionārā fāzē, lai iegūtu *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola kompozīciju,

turklāt (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinols tiek iegūts no kristāliska (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola un turklāt kristāliskais (+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinols tiek iegūts ar metodi saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju.

10. Metode saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 9. pretenzijai, turklāt *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinols pirmajā kompozīcijā ir daudzumā no 0,75 līdz 1,25 molāriem ekvivalentiem, labāk no 0,9 līdz 1,1 molāram ekvivalentam, vēl labāk no 0,95 līdz 1,05 molāriem ekvivalentiem un pat vēl labāk 1 molārais ekvivalents uz molāro ekvivalentu *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola.

11. Metode saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 10. pretenzijai, turklāt (\pm)- Δ^9 -tetrahidrokanabinols satur vismaz 95 masas %, labāk vismaz 98 masas % un vēl labāk vismaz 99 masas % *trans*-(-)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola un *trans*-(+)- Δ^9 -tetrahidrokanabinola, par pamatu ņemot kanabinoīdu kopējo daudzumu.

- (51) **H04L 9/08**^(2006.01) (11) **2361462**
(21) 10794465.4 (22) 05.07.2010
(43) 31.08.2011

- (45) 27.01.2016
- (31) 0900918 (32) 03.07.2009 (33) SE
222949 P 03.07.2009 US
- (86) PCT/SE2010/050780 05.07.2010
- (87) WO2011/002412 06.01.2011
- (73) Kelisec AB, Björn Barkmans väg 2, 148 32 Ösmo, SE
- (72) REVELL, Elise, SE
- (74) Ström & Gulliksson AB, Box 5275, 102 46 Stockholm, SE
Arnolds ZVIRGZDS, Aģentūra ARNOPATENTS, Brīvības
iela 162-17, a/k 13, LV-1012 Rīga, LV
- (54) **METODE ŠIFRĒŠANAS/ATŠIFRĒŠANAS ATSLĒGAS ĢENERĒŠANAI**
METHOD FOR GENERATING AN ENCRYPTION/DECRYPTION KEY

(57) 1. Metode šifrēšanas/atšifrēšanas atslēgas ģenerēšanai, kura ir lietojama drošiem sakariem starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B), turklāt ģenerētā atslēga ir derīga tikai vienai sakaru sesijai starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B) un kamēr sakaru sesija ir aktīva, turklāt minētā metode satur šādus soļus: pieprasījuma sūtīšanu no pirmā mezgla (A) uz centrālo serveri (T), lai iestatītu drošus sakarus ar otro mezglu (B), pirmā atslēgas ģenerēšanas faila sūtīšanu no centrālā servera (2) uz pirmo mezglu (A) un otrā atslēgas ģenerēšanas faila sūtīšanu uz otro mezglu (B), atbildot uz pieprasījumu no pirmā mezgla (A), pirmā atslēgas ģenerēšanas faila apstrādes uzsākšanu pirmajā mezglā (A) un otrā atslēgas ģenerēšanas faila apstrādes uzsākšanu otrajā mezglā (B), pirmās starpdatu kopas ģenerēšanu pirmajā mezglā (A) un otrās starpdatu kopas ģenerēšanu otrajā mezglā (B), pirmās starpdatu kopas sūtīšanu no pirmā mezgla (A) uz otro mezglu (B), pirmās starpdatu kopas bitu salīdzināšanu ar attiecīgajiem otrās starpdatu kopas bitiem, trešās starpdatu kopas izveidošanu, balstoties uz katra bita salīdzināšanu starp pirmo un otro starpdatu kopu, iestatot pirmo vērtību, ja salīdzinātie biti ir vienādi, un otru vērtību, ja salīdzinātie biti nav vienādi, trešās starpdatu kopas sūtīšanu no otrā mezgla (B) uz pirmo mezglu (A), trešās starpdatu kopas bitu salīdzināšanu ar attiecīgajiem pirmās starpdatu kopas bitiem, pirmās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanu, balstoties uz katra bita salīdzināšanu starp trešo un pirmo starpdatu kopu, paturot pirmās starpdatu kopas bita vērtību, ja trešās starpdatu kopas attiecīgais bits ir iestatīts pirmajā vērtībā, un ignorējot pirmās starpdatu kopas bitu, ja trešās starpdatu kopas attiecīgais bits ir iestatīts otrajā vērtībā, otrās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanu, balstoties uz katra bita salīdzināšanu starp pirmo un otro starpdatu kopu, paturot otrās starpdatu kopas bita vērtību, ja pirmās starpdatu kopas attiecīgais bits ir tāds pats, un ignorējot otrās starpdatu kopas bitu, ja salīdzinātie biti nav vienādi, turklāt minētā pirmā un otrā kriptogrāfiskā atslēga ir vienādas.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pirmā atslēgas ģenerēšanas faila sūtīšanas solis uz pirmo mezglu (A) un otrā atslēgas ģenerēšanas faila sūtīšanas solis uz otro mezglu (B) satur arī metadatu, kuri attiecīgi pievienoti katram atslēgas ģenerēšanas failam, sūtīšanu.

3. Metode saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt metadati satur konstanti, kas lietojama gan pirmās, gan otrās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanai.

4. Metode saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, turklāt metadati satur informāciju par kriptogrāfiskās atslēgas garumu.

5. Metode saskaņā ar 4. pretenziju, kas papildus satur kriptogrāfiskās atslēgas garuma gadījumģenerēšanas soli iepriekš noteiktā intervālā.

6. Metode šifrēšanas/atšifrēšanas atslēgas ģenerēšanai pirmajā mezglā (A), kas ir lietojama drošiem sakariem starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B), turklāt ģenerētā atslēga ir derīga tikai vienai sakaru sesijai starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B) un kamēr sakaru sesija ir aktīva, turklāt minētā metode satur šādus soļus:

pieprasījuma sūtīšanu uz centrālo serveri (T) drošu sakaru iestatīšanai ar otro mezglu (B), pirmā atslēgas ģenerēšanas faila saņemšanu no centrālā servera (2), atbildot uz pieprasījumu, pirmā atslēgas ģenerēšanas faila apstrādi, pirmās starpdatu kopas ģenerēšanu, pirmās starpdatu kopas sūtīšanu uz otro mezglu (B), trešās starpdatu kopas saņemšanu no otrā mezgla (B), trešās starpdatu kopas bitu salīdzināšanu ar attiecīgajiem pirmās starpdatu kopas bitiem, pirmās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanu, balstoties uz katra bita salīdzināšanu starp trešo un pirmo starpdatu kopu,

paturot pirmās starpdatu kopas bita vērtību, ja trešās starpdatu kopas attiecīgais bits ir iestatīts pirmajā vērtībā, un ignorējot pirmās starpdatu kopas bitu, ja trešās starpdatu kopas attiecīgais bits ir iestatīts otrajā vērtībā.

7. Metode saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt pirmā atslēgas ģenerēšanas faila saņemšanas solis arī satur minētajam failam pievienoto metadatu saņemšanu.

8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt metadati satur konstanti, kas izmantojama pirmās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanai.

9. Metode saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, turklāt metadati satur informāciju par kriptogrāfiskās atslēgas garumu.

10. Metode šifrēšanas/atšifrēšanas atslēgas ģenerēšanai otrajā mezglā (B), kas ir lietojama drošiem sakariem starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B), turklāt ģenerētā atslēga ir derīga tikai vienai sakaru sesijai starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B) un kamēr sakaru sesija ir aktīva, turklāt minētā metode satur šādus soļus:

otrā atslēgas ģenerēšanas faila saņemšanu no centrālā servera (2), atbildot uz pirmā mezgla (A) pieprasījumu, lai uzsāktu drošus sakarus starp pirmo mezglu (A) un otro mezglu (B), otrā atslēgas ģenerēšanas faila apstrādi, otrās starpdatu kopas ģenerēšanu, pirmās starpdatu kopas saņemšanu no pirmā mezgla (A), pirmās starpdatu kopas bitu salīdzināšanu ar attiecīgajiem otrās starpdatu kopas bitiem, jaunas trešās starpdatu kopas izveidošanu, balstoties uz katra bita salīdzināšanu starp pirmo un otro starpdatu kopu, iestatot pirmo vērtību, ja salīdzinātie biti ir vienādi, un otru vērtību, ja salīdzinātie biti nav vienādi, trešās starpdatu kopas sūtīšanu uz pirmo mezglu (A), otrās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanu, balstoties uz katra bita salīdzināšanu starp pirmo un otro starpdatu kopu, paturot otrās starpdatu kopas bita vērtību, ja pirmās starpdatu kopas attiecīgais bits ir tāds pats, un ignorējot otrās starpdatu kopas bitu, ja salīdzinātie biti nav vienādi.

11. Metode saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt otrā atslēgas ģenerēšanas faila saņemšanas solis arī satur minētajam failam pievienoto metadatu saņemšanu.

12. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt metadati satur konstanti, kas izmantojama otrās kriptogrāfiskās atslēgas ģenerēšanai.

13. Metode saskaņā ar 11. vai 12. pretenziju, turklāt metadati satur informāciju par kriptogrāfiskās atslēgas garumu.

14. Datorprogramma, kas satur programmas kodu visu soļu realizācijai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, kad ir uzsākta programmas izpilde ar datoru.

15. Datorprogrammas produkts, kas satur programmas kodu, kas glabājas datorlasāmā vidē, metodes saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai realizācijai, kad ir uzsākta minētās programmas izpilde ar datoru.

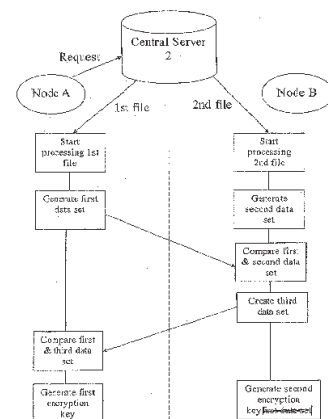
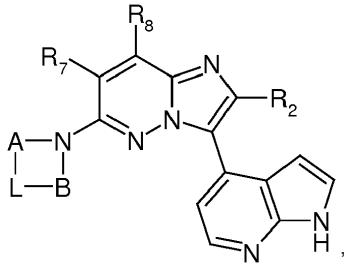


Fig. 1

- (51) C07D 519/00(2006.01)
- (11) 2370446
- (21) 09797121.2
- (22) 30.11.2009
- (43) 05.10.2011
- (45) 25.11.2015
- (31) 0806723
- (32) 01.12.2008
- (33) FR

- (86) PCT/FR2009/052336 30.11.2009
 (87) WO2010/063929 10.06.2010
 (73) SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR
 (72) PACAUD, Christophe, FR
 PUECH, Frédéric, FR
 (74) Le Coupanec, Pascale A.M.P., et al, Cabinet Nony, 3, rue de Penthièvre, 75008 Paris, FR
 Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
 (54) **6-CIKLOAMINO-3-(1H-PIROLO[2,3-B]PIRIDIN-4-IL)IMIDAZO[1,2-B]PIRIDAZĪNA ATVASINĀJUMI, TO IEGŪŠANA UN TO TERAPEITISKA IZMANTOŠANA**
6-CYCLOAMINO-3-(1H-PYRROLO[2,3-B]PYRIDIN-4-YL)IMIDAZO[1,2-B]PYRIDAZINE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF AND THERAPEUTIC USE THEREOF
 (57) 1. Savienojums ar vispārīgo formulu (I):



kurā:

R_2 apzīmē arilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no halogēna atomiem un C_{1-6} alkil-, C_{1-6} alkiloksi-, C_{1-6} alkiltio-, C_{1-6} fluoralkil-, C_{1-6} fluoralkiloksi- un -CN grupām vai R_2 apzīmē C_{1-6} alkilgrupu, C_{1-6} fluoralkilgrupu, C_{3-7} cikloalkilgrupu vai C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkilgrupu;
 A apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai divām R_a grupām;
 B apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar R_b grupu;
 L apzīmē vai nu slāpekļa atomu, kas neobligāti ir aizvietots ar R_c vai R_d grupām, vai oglekļa atomu, kas ir aizvietots ar R_{e1} grupu un R_d grupu vai divām R_{e2} grupām;
 A un B oglekļa atomi ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākām R_f grupām, kas var būt vienādas vai atšķirīgas viena no otras;
 R_a , R_b un R_c grupas ir definētas tādā veidā, ka:
 divas R_a grupas kopā var veidot C_{1-6} alkilēngrupu;
 R_a un R_b kopā var veidot saiti vai C_{1-6} alkilēngrupu;
 R_a un R_c kopā var veidot saiti vai C_{1-6} alkilēngrupu;
 R_b un R_c kopā var veidot saiti vai C_{1-6} alkilēngrupu;
 R_d apzīmē grupu, kas ir izvēlēta no ūdeņraža atoma un C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-7} cikloalkilgrupas, C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkilgrupas, hidroksi- C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} alkiloksi- C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} alkiltio- C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} fluoralkilgrupas vai benzilgrupas;
 R_{e1} apzīmē - NR_5 grupu vai ciklisku monoamīnu, kas neobligāti satur skābekļa atomu, turklāt cikliskais monoamīns ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no fluora atoma un C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} alkiloksigrupas un hidroksilgrupas;
 divas R_{e2} grupas veido ar oglekļa atomu, kuram tās ir pievienotas, ciklisku monoamīnu, kas neobligāti satur skābekļa atomu, turklāt cikliskais monoamīns ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām R_f grupām, kas var būt vienādas vai atšķirīgas viena no otras;
 R_f apzīmē C_{1-6} alkilgrupu, C_{3-7} cikloalkilgrupu, C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkilgrupu, C_{1-6} alkiloksi- C_{1-6} alkilgrupu, hidroksi- C_{1-6} alkilgrupu, C_{1-6} fluoralkilgrupu, fenilgrupu vai benzilgrupu;
 R_4 un R_5 grupas neatkarīgi viena no otras apzīmē ūdeņraža atomu vai C_{1-6} alkilgrupu, C_{3-7} cikloalkilgrupu vai C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkilgrupu; un R_7 un R_8 grupas neatkarīgi viena no otras apzīmē ūdeņraža atomu vai C_{1-6} alkilgrupu;
 bāzes vai pievienotās skābes sāls formā.

2. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka:

R_2 apzīmē fenilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai C_{1-6} alkil- vai C_{1-6} fluoralkilgrupām.

3. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka:

R_2 apzīmē grupu, kas ir izvēlēta no C_{1-6} alkil-, C_{1-6} fluoralkil-, C_{3-7} cikloalkil- vai C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkilgrupām.

4. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka:

R_7 un R_8 grupas neatkarīgi viena no otras apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu.

5. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka:

A apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai divām R_a grupām;

B apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar R_b grupu;

L apzīmē slāpekļa atomu, kas neobligāti ir aizvietots ar R_c vai R_d grupu;

A un B oglekļa atomi ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākām R_f grupām, kas var būt vienādas vai atšķirīgas viena no otras;

divas R_a grupas kopā var veidot C_{1-6} alkilēngrupu;

R_a un R_b kopā var veidot saiti vai C_{1-6} alkilēngrupu;

R_a un R_c kopā var veidot saiti vai C_{1-6} alkilēngrupu;

R_b un R_c kopā var veidot saiti vai C_{1-6} alkilēngrupu;

R_d apzīmē grupu, kas ir izvēlēta no ūdeņraža atoma un C_{1-6} alkil-

grupas, C_{3-7} cikloalkilgrupas, C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkilgrupas, hidr-

oksi- C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} alkiloksi- C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} alkiltio- C_{1-6} alkil-

grupas, C_{1-6} fluoralkilgrupas vai benzilgrupas; un

R_f apzīmē C_{1-6} alkilgrupu, C_{3-7} cikloalkilgrupu, C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkil-

grupu, C_{1-6} alkiloksi- C_{1-6} alkilgrupu, hidroksi- C_{1-6} alkilgrupu, C_{1-6} fluor-

alkilgrupu vai fenilgrupu.

6. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka:

A apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai divām R_a grupām;

B apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar R_b grupu;

L apzīmē oglekļa atomu, kas neobligāti ir aizvietots ar divām R_{e2}

grupām;

A un B oglekļa atomi ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākām

R_f grupām, kas var būt vienādas vai atšķirīgas viena no otras;

divas R_{e2} grupas veido ar oglekļa atomu, kuram tās ir pievienotas,

ciklisku monoamīnu, kas neobligāti satur skābekļa atomu, turklāt

cikliskais monoamīns ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām

R_f grupām, kas var būt vienādas vai atšķirīgas viena no otras; un

R_f apzīmē C_{1-6} alkilgrupu.

7. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka:

A apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu;

B apzīmē C_{1-7} alkilēngrupu;

L apzīmē oglekļa atomu, kas neobligāti ir aizvietots ar R_{e1} grupu

un R_d grupu;

R_d apzīmē ūdeņraža atomu;

R_{e1} apzīmē - NR_4R_5 grupu vai ciklisku monoamīnu, kas neobligāti

satur skābekļa atomu, turklāt cikliskais monoamīns ir neobligāti

aizvietots ar vienu vai vairākām R_f grupām, kas var būt vienādas

vai atšķirīgas viena no otras; un

R_f apzīmē C_{1-6} alkilgrupu, C_{3-7} cikloalkilgrupu vai C_{3-7} cikloalkil- C_{1-6} alkil-

grupu.

8. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru 1., 3., 4. un 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka:

R_2 apzīmē metilgrupu;

cikliskais amīns, kas ir veidots ar -N-A-L-B-, apzīmē (*R*)-3-metil-

piperazin-1-ilgrupu, 3,3-dimetilpiperazin-1-ilgrupu, (*cis*)-3,5-di-

metilpiperazin-1-ilgrupu, 4-izopropilpiperazin-1-ilgrupu vai (*cis*)-

5-metilheksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-ilgrupu; un

R_7 un R_8 apzīmē ūdeņraža atomus.

9. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru

1., 2., 4. un 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka:

R_2 apzīmē 3-fluorfenilgrupu vai 4-fluorfenilgrupu;

cikliskais amīns, kas ir veidots ar -N-A-L-B-, apzīmē (*R*)-3-metilpiper-

azin-1-ilgrupu, 3,3-dimetilpiperazin-1-ilgrupu, (*cis*)-3,5-dimetilpiper-

azin-1-ilgrupu, 4-izopropilpiperazin-1-ilgrupu, 6,9-diazaspiro[4,5]dec-

9-ilgrupu, 3-fenilpiperazin-1-ilgrupu, 4-benzilpiperazin-1-ilgrupu,

3-hidroksimetilpiperazin-1-ilgrupu, 4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il-

grupu, (*R*)-4-(2-hidroksipropil)piperazin-1-ilgrupu, (*S*)-4-(2-hidroksi-

propil)piperazin-1-ilgrupu, 4-(1-hidroksi-2-metilpropan-2-il)piperazin-

1-ilgrupu, 4-(2-hidroksi-2-metilpropil)piperazin-1-ilgrupu, 4-(3-hidr-

oksi-3-metilbutil)piperazin-1-ilgrupu, (*R*)-3-fenilpiperazin-1-ilgrupu,

(*S*)-3-fenilpiperazin-1-ilgrupu, 4-benzilpiperazin-1-ilgrupu, (*cis*)-5-

metilheksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-ilgrupu, (*cis*)-5-(2-hidroksi-

etil)heksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-ilgrupu, (4*aR*,7*aR*)-1-metil-

oktahidro-6H-pirol[3,4-b]piridin-6-ilgrupu, (4aS,7aS)-1-metiloktahidro-6H-pirol[3,4-b]piridin-6-ilgrupu vai (1S,4S)-5-metil-2,5-diazabicyklo[2,2,1]hept-2-ilgrupu; un

R₇ un R₈ grupas neatkarīgi viena no otras apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu.

10. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru 1., 2., 4. un 6. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka:

R₂ apzīmē 4-fluorfenilgrupu;

cikliskais amīns, kas ir veidots ar -N-A-L-B-, apzīmē 2,9-diazaspiro[5,5]undec-9-ilgrupu; un

R₇ un R₈ apzīmē ūdeņraža atomus.

11. Savienojums ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru 1., 2., 4. un 7. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka:

R₂ apzīmē 4-fluorfenilgrupu;

cikliskais amīns, kas ir veidots ar -N-A-L-B-, apzīmē 4-(pirolidin-1-il)-piperidin-1-ilgrupu;

R₇ un R₈ apzīmē ūdeņraža atomus.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no rindas:

1. 2-metil-6-[(R)-3-metilpiperazin-1-il]-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

2. 6-(3,3-dimetilpiperazin-1-il)-2-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns un tā trihidrohlorīds;

3. 6-[(cis)-3,5-dimetilpiperazin-1-il]-2-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns un tā trihidrohlorīds;

4. 6-(4-izopropilpiperazin-1-il)-2-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns un tā trihidrohlorīds;

5. 2-metil-6-[(cis)-5-metilheksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-il]-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns un tā trihidrohlorīds;

6. 2-(4-fluorfenil)-6-[(3R)-3-metilpiperazin-1-il]-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

7. {4-[2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]-piperazin-2-il}metanols;

8. 6-(3,3-dimetilpiperazin-1-il)-2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

9. 6-(3,3-dimetilpiperazin-1-il)-2-(3-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

10. 6-(3,3-dimetilpiperazin-1-il)-2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

11. 6-[(cis)-3,5-dimetilpiperazin-1-il]-2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

12. 2-{4-[2-(3-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}etanols;

13. 2-{4-[2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}etanols;

14. 2-(4-fluorfenil)-6-(4-izopropilpiperazin-1-il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

15. 2-(4-fluorfenil)-6-(4-izopropilpiperazin-1-il)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

16. (R)-1-{4-[2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}propan-2-ols;

17. (S)-1-{4-[2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}propan-2-ols;

18. 6-(6,9-diazaspiro[4,5]dec-9-il)-2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

19. 2-{4-[2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}-2-metilpropan-1-ols;

20. 1-{4-[2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}-2-metilpropan-2-ols;

21. 1-{4-[2-(3-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}-2-metilpropan-2-ols;

22. 1-{4-[2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}-2-metilpropan-2-ols;

23. 4-{4-[2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]piperazin-1-il}-2-metilbutan-2-ols;

24. (R)-2-(4-fluorfenil)-6-[3-fenilpiperazin-1-il]-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns un tā trihidrohlorīds;

25. (S)-2-(4-fluorfenil)-6-[3-fenilpiperazin-1-il]-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns un tā trihidrohlorīds;

26. 2-(4-fluorfenil)-8-metil-6-[3-fenilpiperazin-1-il]-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

27. 6-(4-benzilpiperazin-1-il)-2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

28. (cis)-2-(4-fluorfenil)-6-(5-metilheksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-

il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

29. (cis)-2-(4-fluorfenil)-8-metil-6-(5-metilheksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

30. (cis)-2-{5-[2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]heksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-il}etanols;

31. (cis)-2-{5-[2-(4-fluorfenil)-8-metil-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]heksahidropirol[3,4-c]pirol-2(1H)-il}etanols;

32. 2-(4-fluorfenil)-8-metil-6-((4aR,7aR)-1-metiloktahidro-6H-pirol[3,4-b]piridin-6-il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

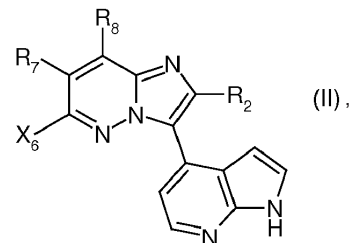
33. 2-(4-fluorfenil)-8-metil-6-((4aS,7aS)-1-metiloktahidro-6H-pirol[3,4-b]piridin-6-il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

34. 2-(4-fluorfenil)-6-((1S,4S)-5-metil-2,5-diazabicyklo[2,2,1]hept-2-il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns;

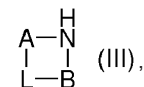
35. 9-[2-(4-fluorfenil)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il]-2,9-diazaspiro[5,5]undekāns;

36. 2-(4-fluorfenil)-6-(4-pirolidin-1-il)piperidin-1-il)-3-(1H-pirol[2,3-b]piridin-4-il)imidazo[1,2-b]piridazīns.

13. Paņēmiens savienojuma ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (II):

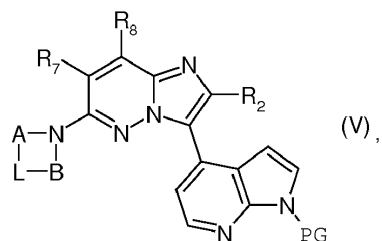


kurā R₂, R₇ un R₈ ir, kā definēts saskaņā ar 1. pretenziju, un X₆ apzīmē aizejošo grupu, tiek pakļauts reakcijai ar amīnu ar vispārīgo formulu (III):



kurā A, L un B ir, kā definēts saskaņā ar 1. pretenziju.

14. Paņēmiens savienojuma ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (V):



kurā R₂, A, L, B, R₇ un R₈ ir, kā definēts saskaņā ar 1. pretenziju, un PG apzīmē benzol- vai toluolsulfonilgrupu, tiek pakļauts aizsarggrupu noņemšanai, izmantojot bāzi.

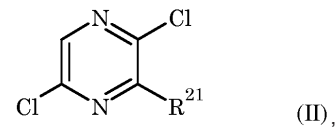
15. Medikaments, kas raksturīgs ar to, ka tas satur savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai bāzes vai farmaceitiski pieņemamas pievienotās skābes sāls formā.

16. Farmaceutiska kompozīcija, kas raksturīga ar to, ka tā satur savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai bāzes vai farmaceitiski pieņemamas pievienotās skābes sāls formā, kā arī vismaz vienu farmaceitiski pieņemamu palīgvielu.

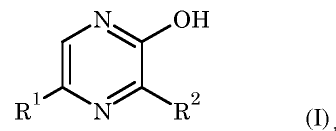
17. Savienojuma ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai, kas paredzēts miega traucējumu, diennakts ritma traucējumu, garastāvokļa traucējumu, ar nemiera sajūtu un depresiju saistītu traucējumu, slimību, kas ir asociētas ar narkotisko vielu atkarību, slimību, kas ir saistītas ar tau-proteīna hiperfosforilēšanu, slimību, kas ir izraisītas vai saasinātas ar šūnu proliferāciju vai iekaisuma slimību novēršanai vai ārstēšanai.

- (51) **B27D 1/04**^(2006.01) (11) **2373463**
B32B 21/14^(2006.01)
B32B 27/20^(2006.01)
C08G 12/38^(2006.01)
- (21) 09831517.9 (22) 30.11.2009
(43) 12.10.2011
(45) 02.03.2016
(31) 20086176 (32) 08.12.2008 (33) FI
(86) PCT/FI2009/050961 30.11.2009
(87) WO2010/066944 17.06.2010
(73) Metsäliitto Osuuskunta, PL 10, 02020 Metsä, FI
Dynea Austria GmbH, Hafenstrasse 77, 3500 Krems, AT
- (72) SOKKA, Kasper, FI
SILVENTOINEN, Ilpo, FI
PORKKA, Merja, FI
LEPISTÖ, Harri, FI
HAVUAHO, Seppo, FI
EKMAN, Jussi, FI
- (74) Seppo Laine Oy, Itämerenkatu 3 B, 00180 Helsinki, FI
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **METODE KOKA SAPLĀKŠŅA LOKSNES RAŽOŠANAI
A METHOD FOR PREPARING A WOOD VENEER PLATE**
- (57) 1. Metode koka saplākšņa loksnes ražošanai, kur metodē sveķi tiek uzklāti uz pirms tam neimpregnētām koka saplākšņa virsmām, un koka saplākšņa loksnes tiek saliktas viena uz otras un karsti sapresētas kopā, lai cietinātu sveķus, kas raksturīga ar to, ka sveķi uz virsmām, kas saskaras viena ar otru, kad plāksnes ir saliktas kopā, tiek uzklāti tā, ka tie aplāj vismaz 50%, labāk vismaz 75%, vislabāk 100% no virsmām, kas saskaras, kad plāksnes ir saliktas cita citai pretī.
2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka sveķi uz virsmām, kas saskaras, kad ir saliktas kopā, tiek uzklāti daudzumā no 100 līdz 300 g/m², labāk no 155 līdz 175 g/m².
3. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka koka saplākšņa biezums ir no 0,5 līdz 5,0 mm, labāk no 1,0 līdz 3,5 mm.
4. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka koka saplākšņu skaits ir no 3 līdz 70, labāk no 12 līdz 24.
5. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka koka saplākšņi ir no materiāla, kas izvēlēts no bērza, apses, priedes, egles vai citas koku sugas, kas ir piemērota metodei, un labākais ir bērzs.
6. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka sveķi uz koka saplākšņa virsmām tiek uzklāti ar izsmidzināšanu, liešanu, uzpuošānu, izmantojot šķidru ekstrūziju un/vai izmantojot ruļļus, vislabāk izmantojot ruļļus.
7. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka sveķi ir fenolsveķi, fenolrezorcīna sveķi, melamīnsveķi vai urīnvielas melamīnsveķi, labāk melamīnsveķi vai urīnvielas melamīnsveķi, vislabāk melamīnsveķi.
8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka melamīnsveķi ir tāda ūdens šķīduma veidā, kurā cietu daļiņu saturs ir no 45 līdz 70 masas %, labāk no 55 līdz 65 masas %.
9. Metode saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka formaldehīda un melamīna molārā proporcija melamīnsveķos ir starp 1,4 un 3,0.
10. Metode saskaņā ar 7., 8. vai 9. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka melamīnsveķi ir modificēti ar acetoguanamīnu, kaprolaktāmu, urīnvielu un/vai glikolu.
11. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka sveķi satur pildvielu.
12. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka pildviela ir izvēlēta no sekojošas rindas, kas satur krītu, kaolīnu, koksnes miltus, celulozi, cieti un proteīnu, un labāk ir sojas milti.
13. Metode saskaņā ar 11. vai 12. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tīro sveķu, ūdens un pildvielas daudzums tiek izvēlēts tā, ka uzklājamo sveķu viskozitāte ir starp 10 un 60 s (Fordā piltuve 6/20°C).
14. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka sveķi satur antimikrobu, pretkukaiņu, mitrumizturīgus un ugunsizturīgus materiālus.

- (51) **C07D 241/16**^(2006.01) (11) **2392566**
C07D 241/24^(2006.01)
- (21) 10735589.3 (22) 14.01.2010
(43) 07.12.2011
(45) 02.03.2016
(31) 2009016221 (32) 28.01.2009 (33) JP
(86) PCT/JP2010/000177 14.01.2010
(87) WO2010/087117 05.08.2010
(73) Nippon Soda Co., Ltd., 2-1, Ohtemachi 2-chome, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8165, JP
- (72) HARA, Tamio, JP
NORIMATSU, Naoki, JP
KURUSHIMA, Hiroaki, JP
KANO, Takuya, JP
- (74) Cabinet Plasseraud, 66, rue de la Chaussée d'Antin, 75440 Paris Cedex 09, FR
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **METODE DIHLORPIRAZĪNA ATVASINĀJUMA IEGŪŠANAI
METHOD FOR PRODUCING DICHLOROPYRAZINE DERIVATIVE**
- (57) 1. Metode dihlorpirazīna atvasinājuma, kas atbilst formulai (II):



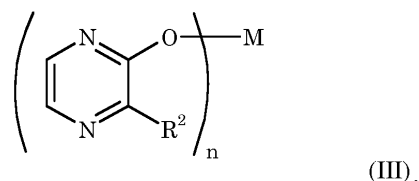
iegūšanai, turklāt R²¹ ir nitrilgrupa, N-neaizvietota vai N-aizvietota karbamoilgrupa, estergrupa vai karboksilgrupa; metode ietver hidroksipirazīna atvasinājuma, kas atbilst formulai (I):



kur R¹ ir halogēna atoms un R² ir nitrilgrupa, N-neaizvietota vai N-aizvietota karbamoilgrupa, estergrupa vai karboksilgrupa, pakļaušanu reakcijai ar hlōrēšanas līdzekli.

2. Metode dihlorpirazīna atvasinājuma saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, turklāt hidroksipirazīna atvasinājums, kas atbilst formulai (I), ir savienojums, kas tiek iegūts, pirazīna atvasinājumu, kas atbilst formulai (III):

[Ķīmiskā formula 11]



kur R² ir nitrilgrupa, N-neaizvietota vai N-aizvietota karbamoilgrupa, estergrupa vai karboksilgrupa, M ir katjons, kas spēj veidot sāli, un n ir skaitlis, kas atbilst M vērtībai, pakļaujot reakcijai ar halogenēšanas līdzekli.

3. Metode hidroksipirazīna atvasinājuma saskaņā ar 2. pretenziju iegūšanai, turklāt M ir katjons, kas veidots no metāla, kurš pieder pie ķīmisko elementu periodiskās tabulas I grupas, IIa grupas vai IIIa grupas.

4. Metode hidroksipirazīna atvasinājuma saskaņā ar 2. pretenziju iegūšanai, turklāt halogenēšanas līdzeklis ir broms un R¹ ir broma atoms.

- (51) **A61K 31/501**^(2006.01) (11) **2393360**
A61P 25/18^(2006.01)
C07D 403/04^(2006.01)
C07D 401/14^(2006.01)
C07D 403/14^(2006.01)
C07D 413/04^(2006.01)

C07D 405/04^(2006.01)

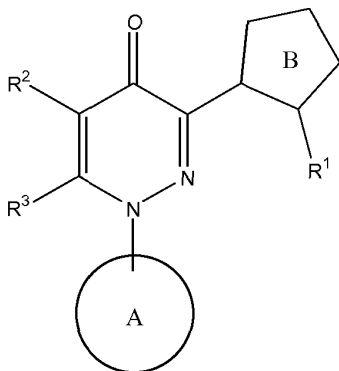
C07D 409/04^(2006.01)

C07D 405/14^(2006.01)

C07D 413/14^(2006.01)

C07D 409/14^(2006.01)

- (21) 10738857.1 (22) 04.02.2010
 (43) 14.12.2011
 (45) 04.11.2015
 (31) 202207 P (32) 05.02.2009 (33) US
 213927 P 30.07.2009 US
 (86) PCT/US2010/000307 04.02.2010
 (87) WO2010/090737 12.08.2010
 (73) Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1 Doshomachi
 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, JP
 (72) TANIGUCHI, Takahiko, GB
 KAWADA, Akira, JP
 KONDO, Mitsuyo, JP
 QUINN, John, F., US
 KUNITOMO, Jun, JP
 YOSHIKAWA, Masato, JP
 FUSHIMI, Makoto, JP
 (74) Jones, Nicholas Andrew, et al, Withers & Rogers LLP,
 Goldings House, 2 Hays Lane, London SE1 2HW, GB
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082,
 LV
 (54) **PIRIDAZINONA SAVIENOJUMI**
PYRIDAZINONE COMPOUNDS
 (57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kurā:

R¹ apzīmē aizvietotāju,
 R² apzīmē aizvietotāju,
 R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai aizvietotāju,
 gredzens A apzīmē aromātisku gredzenu, kas var būt aizvietots,
 un

gredzens B apzīmē 5-locekļu heteroaromātisku gredzenu, kas var būt aizvietots;

turklāt aizvietotājs R¹, R² vai R³, aizvietotāji „aromātisks gredzens, kas var būt aizvietots” gredzenam A vai aizvietotāji „5-locekļu heteroaromātisks gredzens, kas var būt aizvietots” gredzenam B ir izvēlēti no aizvietotāju grupas A;

[aizvietotāju grupa A]

- (1) halogēna atoms;
- (2) nitrogrupa;
- (3) ciāngrupa;
- (4) karboksilgrupa, kas var būt esterificēta;
- (5) C₁₋₁₀ alkilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (6) C₂₋₆ alkenilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (7) C₂₋₆ alkinilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (8) C₃₋₇ cikloalkilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (9) C₆₋₁₄ arilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (10) C₇₋₁₆ aralkilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (11) C₆₋₁₄ aril-C₂₋₆ alkenilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (12) heterocikliska grupa, kas var būt aizvietota;
- (13) hidroksilgrupa;
- (14) C₁₋₁₀ alkoksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (15) C₃₋₇ cikloalkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (16) C₆₋₁₄ ariloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (17) C₇₋₁₆ aralkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (18) C₁₋₁₀ alkilkarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;

- (19) C₁₋₁₀ alkoksikarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (20) mono-C₁₋₁₀ alkilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (21) di-C₁₋₁₀ alkilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (22) C₆₋₁₄ arilkarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (23) mono- vai di-C₆₋₁₄ arilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (24) heterocikliska oksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (25) C₁₋₁₀ alkilsulfoniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (26) merkaptogrupa;
- (27) C₁₋₁₀ alkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (28) C₃₋₇ cikloalkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (29) C₆₋₁₄ arilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (30) C₇₋₁₆ aralkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (31) heterocikliska sulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (32) formilgrupa;
- (33) C₁₋₁₀ alkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (34) C₃₋₇ cikloalkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (35) C₆₋₁₄ arilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (36) C₇₋₁₆ aralkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (37) heterocikliska karbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (38) C₁₋₁₀ alkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (39) C₃₋₇ cikloalkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (40) C₆₋₁₄ arilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (41) heterocikliska sulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (42) C₁₋₁₀ alkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (43) C₃₋₇ cikloalkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (44) C₆₋₁₄ arilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (45) heterocikliska sulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (46) sulfogrupa;
- (47) sulfamoilgrupa;
- (48) sulfinamoilgrupa;
- (49) sulfēnamoilgrupa;
- (50) tiokarbamoilgrupa;
- (51) karbamoilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (52) aminogrupa,
 mono- vai di-C₁₋₁₀ alkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 mono- vai di-C₃₋₇ cikloalkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 mono- vai di-C₆₋₁₄ arilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 mono- vai di-C₇₋₁₆ aralkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 heterocikliska aminogrupa, kas var būt aizvietota;
 C₆₋₁₄ arilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 formilaminogrupa;
 C₁₋₁₀ alkilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 C₃₋₇ cikloalkilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 heterocikliska karbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 C₃₋₇ cikloalkiloksikarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 heterocikliska oksikarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 karbamoilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 C₁₋₁₀ alkilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 C₃₋₇ cikloalkilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 heterocikliska sulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 C₆₋₁₄ arilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
 un iepriekšminētajā aizvietotāju grupā A
 "C₁₋₁₀ alkoksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₂₋₆ alkenilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₂₋₆ alkinilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₂₋₆ alkoksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilkarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkoksikarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono-C₁₋₁₀ alkilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "di-C₁₋₁₀ alkilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilkarbamoilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono- vai di-C₁₋₁₀ alkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono-(C₁₋₁₀ alkilkarbonil)-aminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₁₋₁₀ alkoksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota" un
 "C₁₋₁₀ alkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota"
 aizvietotāji var būt izvēlēti no tālāk minētās aizvietotāju grupas B,
 turklāt aizvietotāju skaits ir diapazonā no 1 līdz maksimālajam
 skaitam, kas var būt aizvietots, vēlāmāk no 1 līdz 3;

[aizvietotāju grupa B]

- (a) halogēna atoms;
- (b) hidroksilgrupa;
- (c) nitrogrupa;
- (d) ciāngrupa;
- (e) C₆₋₁₄arilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (f) C₆₋₁₄ariloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (g) C₇₋₁₆aralkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (h) mono- vai diaizvietota 5- līdz 10-locekļu heterocikliska grupa ar 1 līdz 4 heteroatomiem, kas izvēlēti no slāpekļa, sēra un skābekļa atoma, kurš var būt aizvietots;
- (i) aminogrupa, kas var būt aizvietota;
- (j) C₃₋₇cikloalkilgrupa;
- (k) C₁₋₁₀alkoksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (l) formilgrupa;
- (m) C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupa;
- (n) C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupa;
- (o) C₆₋₁₄arilkarbonilgrupa;
- (p) C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupa;
- (q) C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupa;
- (r) C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupa;
- (s) C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupa;
- (t) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupa;
- (u) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa;
- (v) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa;
- (w) karbamoilgrupa;
- (x) tiokarbamoilgrupa;
- (y) mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupa;
- (z) di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupa;
- (aa) mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupa un
- (bb) mono- vai diaizvietota 5- līdz 7-locekļu heterocikliska karbamoilgrupa ar 1 līdz 4 heteroatomiem, kas izvēlēti no slāpekļa, sēra un skābekļa atoma;

un iepriekšminētajā aizvietotāju grupā A

- "C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄aril-C₂₋₆alkenilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas grupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄ariloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilkarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas oksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "aromātiskas heterocikliskas oksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas karbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "karbamoilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "aminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₃₋₇cikloalkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas aminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas karbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkiloksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas oksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",

"karbamoilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "alkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas sulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota" un
 "C₆₋₁₄arilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota"
 aizvietotāji var būt izvēlēti no iepriekšminētās aizvietotāju grupas B un tālāk minētās aizvietotāju grupas B', turklāt aizvietotāju skaits ir diapazonā no 1 līdz maksimālajam skaitam, kas var būt aizvietots, vēlāmāk no 1 līdz 3 aizvietotājiem;

[aizvietotāju grupa B']

(a) C₁₋₁₀alkilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₆₋₁₄aralkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas;

(b) C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas; un

(c) C₂₋₆alkinilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas; un
 vai tā sāls.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt R² apzīmē halogēna atomu, hidroksilgrupu, C₁₋₁₀alkilgrupu, kas var būt aizvietota, vai C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R² apzīmē C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C₁₋₁₀alkoksigrupas un C₃₋₇cikloalkilgrupas.

4. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R² apzīmē C₁₋₁₀alkoksigrupu.

5. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota, un C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota.

6. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C₁₋₁₀alkilgrupas un C₁₋₁₀alkoksigrupas.

7. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 halogēna atomiem.

8. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota.

9. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai C₁₋₁₀alkoksigrupu.

10. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R³ apzīmē ūdeņraža atomu.

11. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas var būt aizvietots ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no:

- (1) halogēna atoma,

(2) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (3) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota,
 (4) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti,
 (5) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (6) C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (7) ciāngrupas,
 (8) karbamoilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (9) C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas, kas var būt aizvietota,
 (10) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (11) tetrahidropiranilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (12) dihidropiranilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (13) mono-(C₁₋₁₀alkilkarbonil)-aminogrupas, kas var būt aizvietota,
 (14) C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota,
 (15) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota un
 (16) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota.

12. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas var būt aizvietots ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no:

- (1) halogēna atoma,
- (2) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (3) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota,
- (4) C₃₋₇cikloalkilgrupas,
- (5) halogēn-C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas,
- (6) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas un
- (7) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota, un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota.

13. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas var būt aizvietots ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no:

- (1) halogēna atoma,
- (2) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 3 halogēna atomiem,
- (3) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 3 halogēna atomiem,
- (4) C₃₋₇cikloalkilgrupas,
- (5) halogēn-C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas,
- (6) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas un
- (7) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu, un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu.

14. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas ir aizvietots ar:

- (1) (i) 1 vai 2 halogēna atomiem vai (ii) vienu C₁₋₁₀alkoksigrupu un
- (2) vienu 4- līdz 6-locekļu heterociklisku grupu, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu, un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu.

15. Savienojums saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt 4- līdz 6-locekļu heterocikliska grupa, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, apzīmē morfolingrupu, pirolilgrupu, dihidropirolilgrupu, pirazolilgrupu, dihidropirazolilgrupu, piperidilgrupu, azetidilgrupu, pirolidinilgrupu, oksazolidinilgrupu, imidazolilgrupu vai imidazolidinilgrupu.

16. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens B apzīmē imidazola gredzenu, pirazola gredzenu, triazola gredzenu vai tetrazola gredzenu, no kuriem katrs papildus var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu.

17. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens B apzīmē pirazola gredzenu, kas papildus var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu.

18. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt gredzens B apzīmē pirazola gredzenu.

19. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt:

R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota, un C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota,

R² apzīmē halogēna atomu, hidroksilgrupu, C₁₋₁₀alkilgrupu, kas var būt aizvietota, vai C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota,

gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas var būt aizvietots ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no:

- (1) halogēna atoma,
- (2) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (3) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota,
- (4) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti,
- (5) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (6) C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (7) ciāngrupas,
- (8) karbamoilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (9) C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas, kas var būt aizvietota,
- (10) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (11) tetrahidropiranilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (12) dihidropiranilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (13) mono-(C₁₋₁₀alkilkarbonil)-aminogrupas, kas var būt aizvietota,
- (14) C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (15) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota un
- (16) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota, un

gredzens B apzīmē imidazola gredzenu, pirazola gredzenu, triazola gredzenu vai tetrazola gredzenu, no kuriem katrs papildus var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu.

20. Savienojums saskaņā ar 19. pretenziju, turklāt gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas var būt aizvietots ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no:

- (1) halogēna atoma,
- (2) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota,
- (3) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota,
- (4) C₃₋₇cikloalkilgrupas,
- (5) halogēn-C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas,
- (6) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas un
- (7) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota, un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota.

21. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt:

R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C₁₋₁₀alkilgrupas un C₁₋₁₀alkoksigrupas,

R² apzīmē C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C₁₋₁₀alkoksigrupas un C₃₋₇cikloalkilgrupas,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai C₁₋₁₀alkoksigrupu,

gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas var būt aizvietots ar 1 līdz 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no:

- (1) halogēna atoma,
- (2) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 3 halogēna atomiem,
- (3) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 3 halogēna atomiem,
- (4) C₃₋₇cikloalkilgrupas,
- (5) halogēn-C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas,
- (6) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas un
- (7) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu, un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu,

gredzens B apzīmē pirazola gredzenu, kas papildus var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu.

22. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt:

R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 halogēna atomiem,

R² apzīmē C₁₋₁₀alkoksigrupu,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu,

gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas ir aizvietots ar:

(1) (i) 1 vai 2 halogēna atomiem vai (ii) vienu C₁₋₁₀alkoksigrupu un

(2) vienu 4- līdz 6-locekļu heterociklisku grupu, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu, un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu, gredzens B apzīmē pirazola gredzenu.

23. Savienojums saskaņā ar 22. pretenziju, turklāt 4- līdz 6-locekļu heterocikliskā grupa, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, apzīmē morfolingrupu, pirolilgrupu, dihidropirolilgrupu, pirazolilgrupu, dihidropirazolilgrupu, piperidilgrupu, azetidilgrupu, pirolidilgrupu, oksazolidinilgrupu, imidazolilgrupu vai imidazolidinilgrupu.

24. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt:

R¹ apzīmē aromātisku grupu, kas var būt aizvietota,

gredzens A apzīmē aromātisku gredzenu, kas ir aizvietots ar:

(a) vienu aizvietotāju, kas izvēlēts no:

(1) C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota, un

(2) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 1 līdz 5 heteroatomus, kas izvēlēti no slāpekļa atoma, sēra atoma un skābekļa atoma, kas var būt aizvietoti, un

(b) vienu vai vairākiem papildu aizvietotājiem.

25. Savienojums saskaņā ar 24. pretenziju, turklāt:

R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota,

R² apzīmē halogēna atomu, hidroksilgrupu, C₁₋₁₀alkilgrupu, kas var būt aizvietota, vai C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai C₁₋₁₀alkoksigrupu, kas var būt aizvietota,

gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas ir aizvietots ar vienu aizvietotāju, kas izvēlēts no:

(1) C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota,

(2) dihidropirānilgrupas, kas var būt aizvietota,

(3) tetrahidropirānilgrupas, kas var būt aizvietota, un

(4) 4- līdz 6-locekļu heterocikliskas grupas, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti un var būt aizvietoti ar papildu aizvietotājiem, un

gredzens B apzīmē imidazola gredzenu, pirazola gredzenu, triazola gredzenu, tetrazola gredzenu, izoksazola gredzenu, 1,3-oksazola gredzenu, furāna gredzenu vai tiofēna gredzenu, no kuriem katrs var būt aizvietots.

26. Savienojums saskaņā ar 25. pretenziju, turklāt 4- līdz 6-locekļu heterocikliskā grupa, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, apzīmē morfolingrupu, pirolilgrupu, dihidropirolilgrupu, pirazolilgrupu, dihidropirazolilgrupu, piperidilgrupu, azetidilgrupu, pirolidilgrupu, oksazolidinilgrupu, imidazolilgrupu, imidazolidinilgrupu, izoksazolilgrupu, piridilgrupu, piperazinilgrupu vai tiazolilgrupu.

27. Savienojums saskaņā ar 24. pretenziju, turklāt papildu aizvietotāji ir 1 līdz 4 aizvietotāji, kas izvēlēti no:

(1) halogēna atoma,

(2) oksogrupas,

(3) hidroksilgrupas,

(4) C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota,

(5) C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota,

(6) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas,

(7) morfolin-4-ilsulfonilgrupas,

(8) ciāngrupas,

(9) karbamoilgrupas,

(10) halogēn-C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupas,

(11) C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkilgrupas,

(12) di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas,

(13) mono-(C₁₋₁₀alkilkarbonil)-aminogrupas,

(14) C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas,

(15) fenoksigrupas,

(16) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas,

(17) benzimidazol-2-ilosigrupas un

(18) benzimidazol-2-ilsulfonilgrupas.

28. Savienojums saskaņā ar 24. pretenziju, turklāt:

R¹ apzīmē fenilgrupu, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 5 halogēna atomiem,

R² apzīmē C₁₋₁₀alkoksigrupu,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu,

gredzens A apzīmē benzola gredzenu, kas ir aizvietots ar vienu 4- līdz 6-locekļu heterociklisku grupu, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, kas var būt aizvietoti ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, oksogrupas, halogēn-C₁₋₁₀alkoksigrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas un C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota ar halogēna atomu un kas papildus var būt aizvietota ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma un C₁₋₁₀alkoksigrupas, un

gredzens B apzīmē pirazola gredzenu.

29. Savienojums saskaņā ar 28. pretenziju, turklāt 4- līdz 6-locekļu heterocikliskā grupa, kas satur 0 vai 1 skābekļa atomu un 1 līdz 3 slāpekļa atomus kā heteroatomus, apzīmē morfolingrupu, pirolilgrupu, dihidropirolilgrupu, pirazolilgrupu, dihidropirazolilgrupu, piperidilgrupu, azetidilgrupu, pirolidilgrupu, oksazolidinilgrupu, imidazolilgrupu vai imidazolidinilgrupu.

30. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[2-fluor-4-(3,3,4,4-tetrafluorpirolidin-1-il)fenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

31. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[2-fluor-4-(2-oksopirolidin-1-il)fenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

32. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[4-(3,4-difluor-1H-pirol-1-il)-2-fluorfenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

33. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[2-fluor-4-(1H-pirazol-1-il)fenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

34. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[4-(4-hlor-1H-pirazol-1-il)-2-fluorfenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

35. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[2-fluor-4-(2-okso-1,3-oksazolidin-3-il)fenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

36. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 3-[1-(2-fluorfenil)-1H-pirazol-5-il]-1-[2-fluor-4-(1H-pirazol-1-il)fenil]-5-metoksi-piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

37. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 3-[1-(3-hlorfenil)-1H-pirazol-5-il]-1-[2-fluor-4-(1H-pirazol-1-il)fenil]-5-metoksi-piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

38. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[4-(4,4-dimetil-2-oksopirolidin-1-il)-2-fluorfenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

39. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 1-[4-(5,5-dimetil-2-okso-1,3-oksazolidin-3-il)-2-fluorfenil]-5-metoksi-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

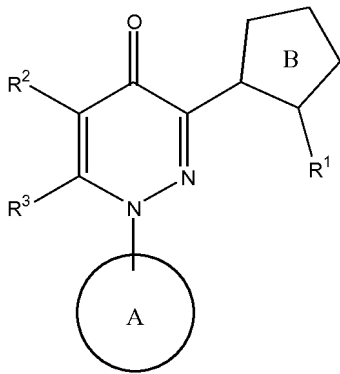
40. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 5-metoksi-1-[2-metoksi-4-(1H-pirazol-1-il)fenil]-3-(1-fenil-1H-pirazol-5-il)piridazin-4(1H)-ons vai tā sāls.

41. Medikaments, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1 līdz 40. pretenzijai.

42. Medikaments saskaņā ar 41. pretenziju izmantošanai fosfodiesterāzes 10A inhibēšanā.

43. Medikaments saskaņā ar 41. pretenziju izmantošanai šizofrēnijas, autisma, Alcheimera slimības, bipolāra traucējuma, Pārkinsona slimības, Hantingtona slimības, aptaukošanās, zāļu atkarības vai uzmanības deficīta/hiperaktivitātes traucējuma profilaksē vai ārstēšanā.

44. Savienojuma ar formulu (I₀):



kurā:

R¹ apzīmē aizvietotāju,

R² apzīmē aizvietotāju,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai aizvietotāju,

gredzens A apzīmē aromātisku gredzenu, kas var būt aizvietots, un

gredzens B apzīmē 5-locekļu heteroaromātisku gredzenu, kas var būt aizvietots,

turklāt aizvietotājs R¹, R² vai R³, aizvietotāji „aromātisks gredzens, kas var būt aizvietots” gredzenam A vai aizvietotāji „5-locekļu heteroaromātisks gredzens, kas var būt aizvietots” gredzenam B ir izvēlēti no aizvietotāju grupas A;

[aizvietotāju grupa A]

- (1) halogēna atoms;
- (2) nitrogrupa;
- (3) ciāngrupa;
- (4) karboksilgrupa, kas var būt esterificēta;
- (5) C₁₋₁₀alkilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (6) C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (7) C₂₋₆alkinilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (8) C₃₋₇cikloalkilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (9) C₆₋₁₄arilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (10) C₇₋₁₆aralkilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (11) C₆₋₁₄aril-C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (12) heterocikliska grupa, kas var būt aizvietota;
- (13) hidroksilgrupa;
- (14) C₁₋₁₀alkoksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (15) C₃₋₇cikloalkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (16) C₆₋₁₄ariloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (17) C₇₋₁₆aralkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (18) C₁₋₁₀alkilkarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (19) C₁₋₁₀alkoksikarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (20) mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (21) di-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (22) C₆₋₁₄arilkarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (23) mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (24) heterocikliska oksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (25) C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (26) merkaptogrupa;
- (27) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (28) C₃₋₇cikloalkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (29) C₆₋₁₄arilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (30) C₇₋₁₆aralkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (31) heterocikliska sulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (32) formilgrupa;
- (33) C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (34) C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (35) C₆₋₁₄arilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (36) C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (37) heterocikliska karbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (38) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (39) C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (40) C₆₋₁₄arilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (41) heterocikliska sulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (42) C₁₋₁₀alkilsulfinilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (43) C₃₋₇cikloalkilsulfinilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (44) C₆₋₁₄arilsulfinilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (45) heterocikliska sulfinilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (46) sulfogrupa;

- (47) sulfamoilgrupa;
- (48) sulfinamoilgrupa;
- (49) sulfēnamoilgrupa;
- (50) tiokarbamoilgrupa;
- (51) karbamoilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (52) aminogrupa,
- mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- mono- vai di-C₃₋₇cikloalkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska aminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₆₋₁₄arilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- formilaminogrupa,
- C₁₋₁₀alkilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₃₋₇cikloalkilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska karbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₃₋₇cikloalkiloksikarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska oksikarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- karbamoilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₁₋₁₀alkilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₃₋₇cikloalkilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska sulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₆₋₁₄arilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- un iepriekšminētajā aizvietotāju grupā A
- "C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₂₋₆alkenilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkoksikarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "di-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilsulfinilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono-(C₁₋₁₀alkil-karbonil)-aminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkoksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota" un
- "C₁₋₁₀alkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- aizvietotāji var būt izvēlēti no tālāk minētās aizvietotāju grupas B, turklāt aizvietotāju skaits svārstās no 1 līdz maksimālajam skaitam, kas var būt aizvietots, vēlāmāk no 1 līdz 3;
- [aizvietotāju grupa B]
- (a) halogēna atoms;
- (b) hidroksilgrupa;
- (c) nitrogrupa;
- (d) ciāngrupa;
- (e) C₆₋₁₄arilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (f) C₆₋₁₄ariloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (g) C₇₋₁₆aralkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (h) mono- vai diaizvietota 5- līdz 10-locekļu heterocikliska grupa ar 1 līdz 4 heteroatomiem, kas izvēlēti no slāpekļa, sēra un skābekļa atoma, kas var būt aizvietots;
- (i) aminogrupa, kas var būt aizvietota;
- (j) C₃₋₇cikloalkilgrupa;
- (k) C₁₋₁₀alkoksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (l) formilgrupa;
- (m) C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupa;
- (n) C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupa;
- (o) C₆₋₁₄arilkarbonilgrupa;
- (p) C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupa;
- (q) C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupa;
- (r) C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupa;
- (s) C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupa;
- (t) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupa;
- (u) C₁₋₁₀alkilsulfinilgrupa;
- (v) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa;
- (w) karbamoilgrupa;
- (x) tiokarbamoilgrupa;
- (y) mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupa;

(z) di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupa;
 (aa) mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupa un
 (bb) mono- vai diaizvietota 5- līdz 7-locekļu heterocikliska karbamoilgrupa ar 1 līdz 4 heteroatomiem, kas izvēlēti no slāpekļa, sēra un skābekļa atoma;

un starp iepriekšminētās aizvietotāju grupas A
 "C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₇₋₁₆aralkilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄aril-C₂₋₆alkenilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas grupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄ariloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₇₋₁₆aralkiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilkarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas oksigrupas, kas var būt aizvietota",
 "aromātiskas heterocikliskas oksigrupa, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₇₋₁₆aralkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas sulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas karbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas sulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas sulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "karbamoilgrupas, kas var būt aizvietota",
 "aminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono- vai di-C₃₋₇cikloalkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas aminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₆₋₁₄arilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas karbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkiloksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas oksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "karbamoilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "alkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "C₃₋₇cikloalkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
 "heterocikliskas sulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota" un
 "C₆₋₁₄arilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota"
 aizvietotāji var būt izvēlēti no iepriekšminētās aizvietotāju grupas B un tālāk minētās aizvietotāju grupas B', turklāt aizvietotāju skaits svārstās no 1 līdz maksimālajam skaitam, kas var būt aizvietots, vēlāmāk no 1 līdz 3 aizvietotājiem;

[aizvietotāju grupa B']

(a) C₁₋₁₀alkilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas;

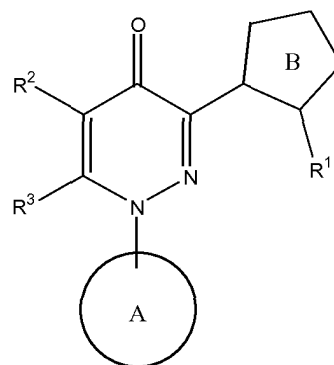
(b) C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksi-

karbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas; un

(c) C₂₋₆alkinilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas;

vai tā sāls izmantošana medikamenta ražošanā šizofrēnijas, autisma, Alcheimera slimības, bipolāra traucējuma, Pārkinsona slimības, Hantingtona slimības, aptaukošanās, zāļu atkarības vai uzmanības deficīta/hiperaktivitātes traucējuma profilaksei vai ārstēšanai.

45. Savienojums ar formulu (I₀):



kurā:

R¹ apzīmē aizvietotāju,

R² apzīmē aizvietotāju,

R³ apzīmē ūdeņraža atomu vai aizvietotāju,

gredzens A apzīmē aromātisku gredzenu, kas var būt aizvietots, un

gredzens B apzīmē 5-locekļu heteroaromātisku gredzenu, kas var būt aizvietots,

turklāt aizvietotājs R¹, R² vai R³, aizvietotāji „aromātiskais gredzens, kas var būt aizvietots” gredzenam A vai aizvietotāji „5-locekļu heteroaromātiskais gredzens, kas var būt aizvietots” gredzenam B ir izvēlēti no aizvietotāju grupas A;

[aizvietotāju grupa A]

(1) halogēna atoms;

(2) nitrogrupa;

(3) ciāngrupa;

(4) karboksilgrupa, kas var būt esterificēta;

(5) C₁₋₁₀alkilgrupa, kas var būt aizvietota;

(6) C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota;

(7) C₂₋₆alkinilgrupa, kas var būt aizvietota;

(8) C₃₋₇cikloalkilgrupa, kas var būt aizvietota;

(9) C₆₋₁₄arilgrupa, kas var būt aizvietota;

(10) C₇₋₁₆aralkilgrupa, kas var būt aizvietota;

(11) C₆₋₁₄aril-C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota;

(12) heterocikliska grupa, kas var būt aizvietota;

(13) hidroksilgrupa;

(14) C₁₋₁₀alkoksigrupa, kas var būt aizvietota;

(15) C₃₋₇cikloalkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(16) C₆₋₁₄ariloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(17) C₇₋₁₆aralkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(18) C₁₋₁₀alkilkarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(19) C₁₋₁₀alkoksikarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(20) mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(21) di-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(22) C₆₋₁₄arilkarboniloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(23) mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoiloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(24) heterocikliska oksigrupa, kas var būt aizvietota;

(25) C₁₋₁₀alkilsulfoniloksigrupa, kas var būt aizvietota;

(26) merkaptogrupa;

- (27) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (28) C₃₋₇cikloalkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (29) C₆₋₁₄arilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (30) C₇₋₁₆aralkilsulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (31) heterocikliska sulfanilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (32) formilgrupa;
- (33) C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (34) C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (35) C₆₋₁₄arilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (36) C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (37) heterocikliska karbonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (38) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (39) C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (40) C₆₋₁₄arilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (41) heterocikliska sulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (42) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (43) C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (44) C₆₋₁₄arilsulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (45) heterocikliska sulfonilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (46) sulfogrupa;
- (47) sulfamoilgrupa;
- (48) sulfinamoilgrupa;
- (49) sulfēnamoilgrupa;
- (50) tiokarbamoilgrupa;
- (51) karbamoilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (52) aminogrupa,
- mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- mono-vai di-C₃₋₇cikloalkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska aminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₆₋₁₄arilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- formilaminogrupa,
- C₁₋₁₀alkilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₃₋₇cikloalkilkarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska karbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₃₋₇cikloalkiloksikarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliska oksikarbonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- karbamoilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₁₋₁₀alkilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₃₋₇cikloalkilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- heterocikliskas sulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- C₆₋₁₄arilsulfonilaminogrupa, kas var būt aizvietota;
- un iepriekšminētās aizvietotāju grupas A
- "C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₂₋₆alkenilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkoksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkoksikarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "di-C₁₋₁₀alkilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono-(C₁₋₁₀alkil-karbonil)-aminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₁₋₁₀alkoksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota" un
- "C₁₋₁₀alkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota"
- aizvietotāji var būt izvēlēti no tālāk minētās aizvietotāju grupas B, turklāt aizvietotāju skaits svārstās no 1 līdz maksimālajam skaitam, kas var būt aizvietots, vēlāmāk no 1 līdz 3;
- [aizvietotāja grupa B]
- (a) halogēna atoms;
- (b) hidroksilgrupa;
- (c) nitrogrupa;
- (d) ciāngrupa;
- (e) C₆₋₁₄arilgrupa, kas var būt aizvietota;
- (f) C₆₋₁₄ariloksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (g) C₇₋₁₆aralkiloksigrupa, kas var būt aizvietota;

- (h) mono- vai diaizvietota 5- līdz 10-locekļu heterocikliska grupa ar 1 līdz 4 heteroatomiem, kas izvēlēti no slāpekļa, sēra un skābekļa atoma, kas var būt aizvietots;
- (i) aminogrupa, kas var būt aizvietota;
- (j) C₃₋₇cikloalkilgrupa;
- (k) C₁₋₁₀alkoksigrupa, kas var būt aizvietota;
- (l) formilgrupa;
- (m) C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupa;
- (n) C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupa;
- (o) C₆₋₁₄arilkarbonilgrupa;
- (p) C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupa;
- (q) C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupa;
- (r) C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupa;
- (s) C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupa;
- (t) C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupa;
- (u) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa;
- (v) C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupa;
- (w) karbamoilgrupa;
- (x) tiokarbamoilgrupa;
- (y) mono-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupa;
- (z) di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupa;
- (aa) mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupa un
- (bb) mono- vai diaizvietota 5- līdz 7-locekļu heterocikliska karbamoilgrupa ar 1 līdz 4 heteroatomiem, kas izvēlēti no slāpekļa, sēra un skābekļa atoma,
- un iepriekšminētās aizvietotāju grupas A
- "C₆₋₁₄ariloksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkiloksikarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkil-C₂₋₆alkinilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄aril-C₂₋₆alkenilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas grupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄ariloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilkarboniloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoiloksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas oksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "aromātiskas heterocikliskas oksigrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkilsulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfanilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas karbonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilsulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfonilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "karbamoilgrupas, kas var būt aizvietota",
- "aminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₃₋₇cikloalkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas aminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₆₋₁₄arilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilkarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas karbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkiloksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas oksikarbonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "karbamoilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "alkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "C₃₋₇cikloalkilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota",
- "heterocikliskas sulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota" un
- "C₆₋₁₄arilsulfonilaminogrupas, kas var būt aizvietota"
- aizvietotāji var būt izvēlēti no iepriekšminētās aizvietotāju grupas B un tālāk minētās aizvietotāju grupas B', turklāt aizvietotāju skaits svārstās no 1 līdz maksimālajam skaitam, kas var būt aizvietots,

labāk no 1 līdz 3 aizvietotājiem;
[aizvietotāju grupa B']

(a) C₁₋₁₀alkilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksi-karbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksi-karbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas;

(b) C₂₋₆alkenilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksi-karbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksi-karbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas; un

(c) C₂₋₆alkinilgrupa, kas var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilaminogrupas, mono- vai di-C₆₋₁₄arilaminogrupas, mono- vai di-C₇₋₁₆aralkilaminogrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₁₀alkoksigrupas, formilgrupas, C₁₋₁₀alkilkarbonilgrupas, C₃₋₇cikloalkilkarbonilgrupas, C₆₋₁₄arilkarbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkilkarbonilgrupas, C₁₋₁₀alkoksikarbonilgrupas, C₆₋₁₄ariloksi-karbonilgrupas, C₇₋₁₆aralkiloksi-karbonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfanilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, C₁₋₁₀alkilsulfonilgrupas, karbamoilgrupas, tiokarbamoilgrupas, mono- vai di-C₁₋₁₀alkilkarbamoilgrupas un mono- vai di-C₆₋₁₄arilkarbamoilgrupas; vai tā sāls izmantošanai šizofrēnijas, autismā, Alcheimera slimības, bipolāra traucējuma, Pārkinsona slimības, Hantingtona slimības, aptaukošanās, zāļu atkarības vai uzmanības deficīta/hiperaktivitātes traucējuma profilaksē vai ārstēšanā.

punkta temperatūras, kas ir atkarīga no siltumnesēja temperatūras plūsmas virzienā aiz komplekta pirmās siltummaiņa ierīces (6),

kas atšķiras ar to, ka padeves temperatūra tiek regulēta atbilstoši padeves kontrolpunkta temperatūrai, kas ir atkarīga no ārpus sistēmas esošajiem parametriem,

turklāt recirkulācijas kontrolpunkta temperatūra tiek regulēta, reaģējot uz padeves kontrolpunkta temperatūras regulēšanu.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā plūsmas ātrums tiek regulēts atbilstoši siltumnesēja recirkulācijas kontrolpunkta temperatūrai aiz pēdējās siltummaiņa ierīces (6), skatoties plūsmas virzienā.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā padeves kontrolpunkta temperatūra tiek regulēta atkarībā no sistēmas ārpusē esošās temperatūras.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējā pretenzijām, pie kam sistēma papildus satur:

- plūsmas regulatoru (9), kas ir savienots ar recirkulācijas cauruļvadu (4), turklāt plūsmas regulators (9) ir piemērots plūsmas ātruma regulēšanai recirkulācijas cauruļvadā (4),

- iedarbināšanas ierīci (10), kas darbina plūsmas regulatoru (9), un

- temperatūras sensoru (11), kas ir ievietots recirkulācijas cauruļvadā (4) siltummaiņa savienojumā ar siltumnesēju.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kurā katrs plūsmas regulators (9) ir piemērots pastāvīgas plūsmas uzturēšanai neatkarīgi no spiediena izmaiņām galvenajā barošanas cauruļvadā (1).

6. Paņēmiens saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, pie kam ārējās temperatūras sensors (8) ir uzstādīts temperatūras mērīšanai ārpus sistēmas.

7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam elektronisks kontroleris (18) ir savienots ar katru iedarbināšanas ierīci (10), bet temperatūras sensors (11) ir savienots ar siltummaiņa ierīces (6) recirkulācijas cauruli (4), kurā tas ir uzstādīts siltummaiņa savienojumā.

8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, pie kam elektroniskais kontroleris ir savienots ar temperatūras sensoru (19), kas ir savienots ar galveno barošanas cauruļvadu (1).

9. Paņēmiens saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kurā katra iedarbināšanas ierīce tiek iedarbināta ar impulsu.

10. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam vismaz viena iedarbināšanas ierīce (10) ir elektromagnētisks, pneimatiskais, hidrauliskais vai elektriskais izpildmehānisms.

11. Paņēmiens saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, pie kam katra iedarbināšanas ierīce (10) ir tiešā veidā savienota ar temperatūras sensoru (11), ir automātiska un ietver recirkulācijas temperatūras kontrolpunkta regulēšanas līdzekli, pie tam iedarbināšanas ierīce (10) ir termostats.

12. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam katras siltummaiņa ierīces (6) barošanas cauruļvads un recirkulācijas cauruļvads (4) papildus ir savienoti ar apvades cauruļvadu (5).

- (51) **F24D 19/10**^(2006.01) (11) **2395289**
F24H 9/12^(2006.01)
F24D 19/00^(2006.01)
- (21) 11004707.3 (22) 09.06.2011
(43) 14.12.2011
(45) 23.03.2016
(31) 201000503 (32) 10.06.2010 (33) DK
(73) Danfoss A/S, Nordborgvej 81, 6430 Nordborg, DK
(72) HARTMANN, Michael, DE
JEDRZEJEWSKI, Mariusz, PL
OSOJNIK, Matjaz, SI
- (74) Copsey, Timothy Graham, et al, Kilburn & Strode LLP, 20 Red Lion Street, London WC1R 4PJ, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **VIENCAURULES SILTUMAPGĀDES SISTĒMAS REGULĒŠANAS PAŅĒMIENS**
METHOD TO REGULATE A ONE-PIPE HEAT SUPPLY SYSTEM
- (57) 1. Sistēmas regulēšanas paņēmiens, kas ietver:
- siltummaiņa ierīču (6) komplektu, kuras ir saslēgtas virknē tā, ka vienas siltummaiņa ierīces recirkulācijas cauruļvads (4) ir nākošās siltummaiņa ierīces (6) barošanas cauruļvads (3),
- galveno barošanas cauruļvadu (1), kas ir savienots ar pirmās siltummaiņa ierīces barošanas cauruļvadu (3), skatoties plūsmas virzienā,
- galveno recirkulācijas cauruļvadu (2), kas ir savienots ar pēdējās siltummaiņa ierīces recirkulācijas cauruļvadu (4), skatoties plūsmas virzienā,
pie kam siltumnesējs piegādes temperatūrā tiek pievadīts no galvenā barošanas cauruļvada (1) uz siltummaiņa ierīču (6) komplektu ar plūsmas ātrumu, kurš tiek regulēts atkarībā no recirkulācijas kontrol-

- (51) **C07K 14/47**^(2006.01) (11) **2406279**
A61K 38/17^(2006.01)
G01N 33/68^(2006.01)
- (21) 10714094.9 (22) 09.03.2010
(43) 18.01.2012
(45) 27.01.2016
(31) 202523 P (32) 09.03.2009 (33) US
(86) PCT/IL2010/000193 09.03.2010
(87) WO2010/103515 16.09.2010
(73) Ramot at Tel-Aviv University Ltd., P.O. Box 39296, 61392 Tel Aviv, IL
(72) SHALTIEL-KARYO, Ronit, IL
GAZIT, Ehud, IL
(74) V.O., P.O. Box 87930, 2508 DH Den Haag, NL
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **KOMPOZĪCIJAS NEIRODEGENERĀTĪVU SLIMĪBU PROFILAKSEI UN ĀRSTĒŠANAI**
COMPOSITIONS FOR PREVENTION AND TREATMENT OF NEURODEGENERATIVE DISEASES

(57) 1. Izolēts 10 aminoskābes garš peptīds ar aminoskābju sekvenci, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no sekvencēm ar SEQ ID NO: 1 – 4 un 55, peptīds ir spējīgs inhibēt alfa-sinukleīna agregāciju.

2. Peptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kuram ir gala "cepures" (end cap) modifikācija.

3. Farmaceitiska kompozīcija, kas kā aktīvo sastāvdaļu satur peptīdu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

4. *In vitro* paņēmieni alfa-sinukleīna agregācijas inhibēšanai, paņēmieni ietver alfa-sinukleīna kontaktēšanu ar peptīdu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, tādējādi inhibējot alfa-sinukleīna agregāciju.

5. Peptīds saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai medicīniska stāvokļa, kas saistīts ar alfa-sinukleīna agregāciju, ārstēšanā vai profilaksē.

6. Peptīds saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētais medicīniskais stāvoklis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no Pārkinsona slimības (PS), Alcheimera slimības (AS), difūzās Levi ķermenīšu slimības, jauktās AS-PS, multiplās sistēmas atrofijas un Halevordena-Špatsa slimības.

7. Paņēmieni alfa-sinukleīna monomēru noteikšanai, paņēmieni ietver:

(a) bioloģiskā parauga, pieņemot, ka tas satur minētos alfa-sinukleīna monomērus, kontaktēšanu ar peptīdu saskaņā ar 1. pretenziju apstākļos, kas ļauj veidoties kompleksam starp minētajiem monomēriem un minēto peptīdu; un

(b) minētā kompleksa klātbūtnes vai daudzuma noteikšanu, tādējādi nosakot alfa-sinukleīna monomērus.

(51) **C07K 16/00**^(2006.01) (11) **2411408**
C07K 16/10^(2006.01)
C07K 16/12^(2006.01)
C07K 16/28^(2006.01)

(21) 10711069.4 (22) 19.03.2010
(43) 01.02.2012
(45) 25.11.2015
(31) 0905023 (32) 24.03.2009 (33) GB
(86) PCT/GB2010/000500 19.03.2010
(87) WO2010/109165 30.09.2010
(73) Erasmus University Medical Center Rotterdam, Department of Cell Biology and Genetics, P.O. Box 1738, 3000 DR Rotterdam, NL
Craig, Roger Kingdon, Jubilee House Farm, Spen Moss, Smallwood, Sandbach, Cheshire CW11 2XB, GB
(72) GROSVELD, Franklin, Gerardus, NL
JANSSENS, Richard, Wilhelm, NL
DRABEK, Dubravka, NL
CHEN, Tao, NL
DE BOER, Ernie, NL
CRAIG, Roger, Kingdon, GB
(74) Chapman, Desmond Mark, Carpmaels & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **ŠĶĪSTOŠAS, TIKAI SMAGO ĶĒDI SATUROŠAS ANTI-VIELAS**
SOLUBLE HEAVY-CHAIN ONLY ANTIBODIES

(57) 1. Metode tikai smago ķēdi saturošas antivielas, kas specifiski saistās ar antigēnu, ražošanai, kas ietver:

(a) transgēna zīdītāja, kas nav cilvēks, imunizēšanu ar antigēnu, turklāt zīdītājs ekspresē tikai smago ķēdi saturošas antivielas, kurām transkribētajā un procesētajā smagās ķēdes mRNS nav CH1 domēna, un turklāt tikai smago ķēdi saturošas antivielas tiek ekspresētas no zīdītāja transgēnā lokusa,

(b) ilgdzīvojošo plazmas šūnu vai atmiņas B šūnu izolēšanu no imunizētā zīdītāja,

(c) mRNS populācijas izolēšanu no solī (b) iegūtajām šūnām,

(d) kDNS populācijas, kas iegūta no solī (c) izolētās mRNS, klonēšanu par ekspresijas vektoru un ekspresijas vektora ekspresēšanu šūnu līnijā un

(e) vismaz vienas šūnu līnijas, kas producē tikai smago ķēdi saturošo antivielu, kas specifiski saistās ar antigēnu, atlasīšanu,

turklāt zīdītājs ir pele vai žurka.

2. Metode šķīstoša V_H domēna vai V_H sapludināta proteīna, kas specifiski saistās ar antigēnu, ražošanai, kas ietver:

(a) transgēna zīdītāja, kas nav cilvēks, imunizēšanu ar antigēnu, turklāt zīdītājs ekspresē tikai smago ķēdi saturošas antivielas, kurām transkribētajā un procesētajā smagās ķēdes mRNS nav CH1 domēna, un turklāt tikai smago ķēdi saturošas antivielas tiek ekspresētas no zīdītāja transgēnā lokusa,

(b) ilgdzīvojošo plazmas šūnu vai atmiņas B šūnu izolēšanu no imunizētā zīdītāja,

(c) mRNS populācijas izolēšanu no solī (b) iegūtajām šūnām,

(d) kDNS populācijas, kas satur kDNS, kuras kodē no soļā (c) mRNS iegūto V_H domēnu, klonēšanu par ekspresijas vektoru tā, lai V_H domēns vai V_H sapludinātais proteīns, kas var saturēt smagās ķēdes efektoru apgabalu, tiek ekspresēts šūnu līnijā, un

(e) vismaz vienas šūnu līnijas, kas producē V_H domēnu vai V_H sapludināto proteīnu, kas specifiski saistās ar antigēnu, atlasīšanu, turklāt zīdītājs ir pele vai žurka.

3. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt ar antigēnu sensibilizētais transgēnais zīdītājs, kas nav cilvēks, ir pele un ilgdzīvojošās plazmas šūnas vai atmiņas B šūnas tiek attīrītas no peles sekundārajiem limfmezgliem, kaula smadzenēm vai liesas.

4. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ilgdzīvojošās plazmas šūnas vai atmiņas B šūnas tiek attīrītas, pielietojot šūnu šūnu virsmas marķierus.

5. Metode saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt ar antigēnu sensibilizētais transgēnais zīdītājs, kas nav cilvēks, ir pele un šūnu virsmas marķieris ir CD138 marķieris.

6. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt šūnu līnija ir mikroorganismu šūnu līnija vai zīdītāja šūnu līnija.

7. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt solis (d) ietver minētā ekspresijas vektora transfektēšanu baktērijās augstas caurlaidspējas automatizējamā formātā, minēto baktēriju pavairošanu, ekspresijas vektora izolēšanu un ekspresijas vektora transfektēšanu ekspresijas šūnās.

8. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt ilgdzīvojošās plazmas šūnas vai atmiņas B šūnas pirms mRNS izolēšanas tiek padarītas nemirstīgas.

9. Metode saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt šūnas tiek padarītas nemirstīgas, sapludinot ar mielomas šūnu vai transformējot ar vīrusu, piemēram EBV.

10. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt katrs tikai smago ķēdi saturošās antivielas lokuss ietver vismaz vienu dominantu selektīvu marķiergēnu.

11. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas papildus ietver vai nu šķīstošā V_H domēna, vai šķīstošo V_H domēnu kodējošās nukleīnskābes izolēšanas soli no B šūnas vai nemirstīgās šūnu līnijas, kas producē tikai smago ķēdi saturošo antivielu vai V_H sapludināto proteīnu ar vēlamo specifiskumu pret antigēnu.

12. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas papildus ietver vai nu šķīstošā V_H domēna, vai šķīstošo V_H domēnu kodējošās nukleīnskābes izolēšanas soli no tikai smago ķēdi saturošu antivielu producējošās šūnas, ko producējis zīdītājs, vai no nemirstīgas, tikai smago ķēdi saturošo antivielu vai V_H sapludināto proteīnu producējošās šūnas, ko producējis zīdītājs, displeja tehnoloģijas ceļā.

(51) **C07D 213/83**^(2006.01) (11) **2415763**

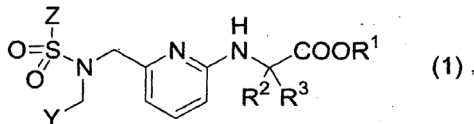
A61K 31/44^(2006.01)
A61K 31/443^(2006.01)
A61K 31/4439^(2006.01)
A61K 31/444^(2006.01)
A61K 31/501^(2006.01)
A61K 31/506^(2006.01)
A61P 27/06^(2006.01)
C07D 401/12^(2006.01)
C07D 405/14^(2006.01)
C07D 409/14^(2006.01)
C07D 417/12^(2006.01)
C07D 417/14^(2006.01)
C07D 401/14^(2006.01)

(21) 10758728.9 (22) 30.03.2010

- (43) 08.02.2012
 (45) 27.01.2016
 (31) 2009082725 (32) 30.03.2009 (33) JP
 (86) PCT/JP2010/055719 30.03.2010
 (87) WO2010/113957 07.10.2010
 (73) Ube Industries, Ltd., 1978-96, Oaza Kogushi, Ube-shi, Yamaguchi 755-8633, JP
 (72) HAGIHARA, Masahiko, JP
 YONEDA, Kenji, JP
 OKANARI, Eiji, JP
 SHIGETOMI, Manabu, JP
 (74) HOFFMANN EITL, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE
 Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
 (54) **FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA GLAUKOMAS ĀRSTĒŠANAI VAI PROFILAKSEI**
PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR TREATING OR PREVENTING GLAUCOMA

(57) 1. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai glaukomas ārstēšanā vai profilaksē, kas satur pirdilaminoetiķskābes savienojumu, kas atbilst formulai (1):

[Formula 1]



kur R¹, R² un R³ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₆ alkilgrupa, Y ir bicikliska heteroaromātiska gredzena grupa vai -Q¹-Q², katrs no kuriem var tikt aizvietots ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₆ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₆ alkoksilgrupas un C₁₋₆ alkiltiogrupas, Q² ir arilēngrupa vai 5- līdz 6-locekļu heteroarilēngrupa, Q¹ ir aromātiska grupa vai 5- līdz 6-locekļu gredzena heterocikliska grupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, C₁₋₆ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₆ alkilgrupas, C₁₋₆ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₆ alkoksilgrupas, Z ir aromātiska grupa vai 5- līdz 6-locekļu heteroaromātiska gredzena grupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₆ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₆ alkilgrupas, C₁₋₆ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₆ alkoksilgrupas, vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli kā efektīvu ingredientu, un kur šķīdums tiek pilināts acī.

2. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R² un R³ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₄ alkilgrupa.

3. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur Y ir bicikliska heteroaromātiska gredzena grupa, vai -Q¹-Q² grupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₄ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkoksilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkoksilgrupas un C₁₋₄ alkiltiogrupas, kur Q¹ ir arilēngrupa vai 5- līdz 6-locekļu heteroarilēngrupa, Q² ir aromātiska grupa vai 5- līdz 6-locekļu heterocikliska grupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, C₁₋₄ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₄ alkoksilgrupas.

4. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur Z ir aromātiska grupa vai pilnīgi nepiesātināta 5- līdz 6-locekļu heteroaromātiska gredzena grupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₄ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₄ alkoksilgrupas.

5. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur Y ir benzofurilgrupa, benzotienilgrupa, benzoksazolilgrupa vai benzotiazolilgrupa, vai grupa -Q¹-Q², no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām),

kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₄ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₄ alkoksilgrupas un C₁₋₄ alkiltiogrupas, kur Q¹ ir fenilēngrupa, tienilēngrupa, piridazinilēngrupa vai pirimidinilēngrupa, Q² ir fenilgrupa, tienilgrupa, pirazolilgrupa, oksazolilgrupa, tiazolilgrupa, 1,2,4-triazolilgrupa, piridilgrupa, piridazinilgrupa, pirimidinilgrupa, 4,5-dihidrotiazolilgrupa, pirolidinilgrupa vai piperidinilgrupa, kas var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₄ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₄ alkoksilgrupas.

6. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, kur Y ir benzofurilgrupa, benzotienilgrupa, benzoksazolilgrupa vai benzotiazolilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, broma atoma, metilgrupas, etilgrupas, propilgrupas, izopropilgrupas, *tert*-butilgrupas, trifluorometilgrupas, difluorometilgrupas, trihlormetilgrupas, dihlormetilgrupas, 2,2,2-trifluoretilgrupas, 2,2,2-trihloretilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, propoksigrupas, izopropoksigrupas, *tert*-butoksigrupas, trifluorometoksigrupas, difluorometoksigrupas, trihlormetoksigrupas, dihlormetoksigrupas, metiltiogrupas, etiltiogrupas, propiltiogrupas, izopropiltiogrupas un *tert*-butiltiogrupas.

7. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, kur Y ir grupa -Q¹-Q², kur Q¹ ir fenilēngrupa, tienilēngrupa, piridazinilēngrupa vai pirimidinilēngrupa, Q² ir fenilgrupa, tienilgrupa, pirazolilgrupa, oksazolilgrupa, tiazolilgrupa, 1,2,4-triazolilgrupa, piridilgrupa, piridazinilgrupa, pirimidinilgrupa, 4,5-dihidrotiazolilgrupa, pirolidinilgrupa vai piperidinilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, broma atoma, metilgrupas, etilgrupas, propilgrupas, izopropilgrupas, *tert*-butilgrupas, trifluorometilgrupas, difluorometilgrupas, trihlormetilgrupas, dihlormetilgrupas, 2,2,2-trifluoretilgrupas, 2,2,2-trihloretilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, propoksigrupas, izopropoksigrupas, *tert*-butoksigrupas, trifluorometoksigrupas, difluorometoksigrupas, trihlormetoksigrupas, dihlormetoksigrupas.

8. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur Z ir fenilgrupa, tienilgrupa, imidazolilgrupa, tiazolilgrupa, piridilgrupa vai pirimidinilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₄ alkilgrupas, halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkoksilgrupas un halogēn-C₁₋₄ alkoksilgrupas.

9. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kur Z ir fenilgrupa, tienilgrupa, imidazolilgrupa, tiazolilgrupa, piridilgrupa vai pirimidinilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, broma atoma, metilgrupas, etilgrupas, propilgrupas, izopropilgrupas, *tert*-butilgrupas, trifluorometilgrupas, difluorometilgrupas, trihlormetilgrupas, dihlormetilgrupas, 2,2,2-trifluoretilgrupas, 2,2,2-trihloretilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, propoksigrupas, izopropoksigrupas, *tert*-butoksigrupas, trifluorometoksigrupas, difluorometoksigrupas, trihlormetoksigrupas, dihlormetoksigrupas.

10. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kur R² un R³ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa.

11. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. un 8. līdz 10. pretenzijai, kur Y ir benzofurilgrupa vai benzotienilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma un C₁₋₄ alkoksilgrupas.

12. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. un 8. līdz 10. pretenzijai, kur Y ir grupa -Q¹-Q², kur Q¹ ir fenilēngrupa vai piridazinilēngrupa, Q² ir fenilgrupa, pirazolilgrupa, tiazolilgrupa, 1,2,4-triazolilgrupa, piridilgrupa, piridazinilgrupa, pirimidinilgrupa vai 4,5-dihidrotiazolilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₄ alkilgrupas un halogēn-C₁₋₄ alkilgrupas.

13. Medicīniskis oftalmoloģisks šķīdums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. un 8. līdz 10. pretenzijai, kur Z ir fenilgrupa vai piridilgrupa, no kurām katra var tikt aizvietota ar grupu(-ām), kas tiek izvēlēta(-as) no rindas, kas sastāv no halogēna atoma un C₁₋₄ alkoksilgrupas.

14. Medicīniskais oftalmoloģiskais šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir ūdeņraža atoms, metilgrupa, etilgrupa, propilgrupa, izopropilgrupa, butilgrupa, izobutilgrupa, sek-butilgrupa, terc-butilgrupa, pentilgrupa vai heksilgrupa, R² un R³ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa, Y ir benzofuran-2-ilgrupa, 6-fluorbenzofuran-2-ilgrupa, 6-hlorbenzofuran-2-ilgrupa, 6-metoksi-benzofuran-2-ilgrupa, benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-fluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 5,6-difluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-hlorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-hlor-5-fluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-metil-benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 5-fluor-6-metilbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-etil-benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-etil-5-fluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-trifluormetilbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 5-fluor-6-trifluormetilbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-metoksi-benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 5-fluor-6-metoksibenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-difluormetoksibenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-difluormetoksi-5-fluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-metiltiobenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 5-fluor-6-metiltiobenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, bifeniil-4-ilgrupa, 2'-fluor-bifeniil-4-ilgrupa, 3'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 2',4'-difluorbifeniil-4-ilgrupa, 3',4'-difluorbifeniil-4-ilgrupa, 2'-hlor-bifeniil-4-ilgrupa, 3'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hlor-2'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hlor-3'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hidroksibifeniil-4-ilgrupa, 3'-metilbifeniil-4-ilgrupa, 3'-etilbifeniil-4-ilgrupa, 3'-trifluormetilbifeniil-4-ilgrupa, 3'-metoksibifeniil-4-ilgrupa, 3'-difluormetoksibifeniil-4-ilgrupa, 4-(tiofen-2-il)fenilgrupa, 4-(tiofen-3-il)fenilgrupa, 4-(pirazol-1-il)fenilgrupa, 4-(oksazol-2-il)fenilgrupa, 4-(oksazol-4-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-fluortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-metil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dimetiltiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-trifluormetil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(2-fluortiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(2-hlortiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-5-il)fenilgrupa, 4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilgrupa, 4-(piridin-2-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-3-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-2-il)fenilgrupa, 4-(5-hidroksipirimidin-2-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-5-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dihidrotiazol-2-il)fenilgrupa, 6-fenilpiridazin-3-ilgrupa, 6-(tiazol-2-il)piridazin-3-ilgrupa vai 6-(tiazol-4-il)piridazin-3-ilgrupa, un Z ir fenilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 3,4-difluorfenilgrupa, 3,5-difluorfenilgrupa, 3,4,5-trifluorfenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3-hlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 2,6-dihlorfenilgrupa, 4-hlor-3-fluorfenilgrupa, 4-hlor-3,5-difluorfenilgrupa, 4-bromfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 3-fluor-4-metilfenilgrupa, 4-etilfenilgrupa, 4-etil-3-fluorfenilgrupa, 4-propilfenilgrupa, 4-izopropilfenilgrupa, 4-terc-butilfenilgrupa, 4-trifluormetilfenilgrupa, 3-fluor-4-trifluormetilfenilgrupa, 4-difluormetilfenilgrupa, 4-trihlormetilfenilgrupa, 4-dihlormetilfenilgrupa, 4-(2,2,2-trifluoretil)fenilgrupa, 4-(2,2,2-trihloretil)fenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 3-fluor-4-metoksifenilgrupa, 4-etoksifenilgrupa, 4-propoksifenilgrupa, 4-izopropoksifenilgrupa, 4-terc-butoksifenilgrupa, 4-trifluormetoksifenilgrupa, 4-difluormetoksifenilgrupa, 4-difluormetoksi-3-fluorfenilgrupa, 4-trihlormetoksifenilgrupa, 4-dihlormetoksifenilgrupa, tiofen-2-ilgrupa, tiofen-3-ilgrupa, 5-hlortiofen-2-ilgrupa, 1-metil-1H-imidazol-4-ilgrupa, tiazol-2-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 5-fluorpiridin-2-ilgrupa, 5-hlorpiridin-2-ilgrupa, 5-metilpiridin-2-ilgrupa, 5-etilpiridin-2-ilgrupa, 5-trifluormetilpiridin-2-ilgrupa, 5-metoksipiridin-2-ilgrupa, 5-difluormetoksipiridin-2-ilgrupa, piridin-3-ilgrupa, 6-fluorpiridin-3-ilgrupa, 6-hlorpiridin-3-ilgrupa, 6-metilpiridin-3-ilgrupa, 6-etilpiridin-3-ilgrupa, 6-trifluormetilpiridin-3-ilgrupa, 6-metoksipiridin-3-ilgrupa, 6-difluormetoksipiridin-3-ilgrupa, piridin-4-ilgrupa vai pirimidin-2-ilgrupa,

15. Medicīniskais oftalmoloģiskais šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir ūdeņraža atoms, metilgrupa, etilgrupa, propilgrupa, izopropilgrupa, terc-butilgrupa vai heksilgrupa, R² un R³ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa, Y ir benzofuran-2-ilgrupa, 6-fluorbenzofuran-2-ilgrupa, 6-hlorbenzofuran-2-ilgrupa, 6-metoksi-benzofuran-2-ilgrupa, benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-fluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-hlorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-metoksi-benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, bifeniil-4-ilgrupa, 2'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 3'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 2'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 3'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 3'-metilbifeniil-4-ilgrupa, 3'-trifluormetilbifeniil-4-ilgrupa, 4-(tiofen-2-il)fenilgrupa, 4-(tiofen-3-il)fenilgrupa, 4-(pirazol-1-il)fenilgrupa, 4-(oksazol-2-il)fenilgrupa, 4-(oksazol-4-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-fluortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-metil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dimetiltiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-trifluormetil-tiazol-

2-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(2-fluortiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(2-hlortiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-5-il)fenilgrupa, 4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilgrupa, 4-(piridin-2-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-3-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-2-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-5-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dihidrotiazol-2-il)fenilgrupa vai 6-fenilpiridazin-3-ilgrupa, un Z ir fenilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 3,4-difluorfenilgrupa, 3,5-difluorfenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3-hlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 2,6-dihlorfenilgrupa, 4-hlor-3-fluorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 3-fluor-4-metilfenilgrupa, 4-etilfenilgrupa, 4-etil-3-fluorfenilgrupa, 4-trifluormetilfenilgrupa, 3-fluor-4-trifluormetilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 3-fluor-4-metoksifenilgrupa, 4-difluormetoksifenilgrupa, 4-difluormetoksi-3-fluorfenilgrupa, tiofen-2-ilgrupa, tiofen-3-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 5-fluorpiridin-2-ilgrupa, 5-hlorpiridin-2-ilgrupa, 5-metoksipiridin-2-ilgrupa, piridin-3-ilgrupa, 6-fluorpiridin-3-ilgrupa, 6-hlorpiridin-3-ilgrupa, 6-metoksipiridin-3-ilgrupa vai piridin-4-ilgrupa.

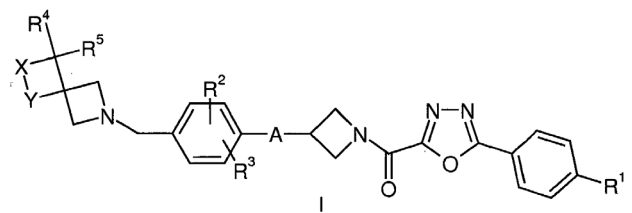
16. Medicīniskais oftalmoloģiskais šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir ūdeņraža atoms, metilgrupa, etilgrupa, izopropilgrupa vai heksilgrupa, R² un R³ katrs ir ūdeņraža atoms, Y ir benzofuran-2-ilgrupa, 6-fluorbenzofuran-2-ilgrupa, 6-hlorbenzofuran-2-ilgrupa, 6-metoksibenzofuran-2-ilgrupa, benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-fluorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-hlorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-metoksi-benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, bifeniil-4-ilgrupa, 2'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 3'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 2'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 3'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 3'-metilbifeniil-4-ilgrupa, 3'-trifluormetilbifeniil-4-ilgrupa, 4-(tiofen-2-il)fenilgrupa, 4-(tiofen-3-il)fenilgrupa, 4-(pirazol-1-il)fenilgrupa, 4-(oksazol-2-il)fenilgrupa, 4-(oksazol-4-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-fluortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-metil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dimetiltiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-trifluormetil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(2-fluortiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(2-hlortiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-5-il)fenilgrupa, 4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilgrupa, 4-(piridin-2-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-3-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-2-il)fenilgrupa, 4-(5-hidroksipirimidin-2-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-5-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dihidrotiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-2-il)piridazin-3-ilgrupa vai 4-(tiazol-4-il)piridazin-3-ilgrupa, un Z ir fenilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 3,4-difluorfenilgrupa, 3,5-difluorfenilgrupa, 3,4,5-trifluorfenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3-hlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 2,6-dihlorfenilgrupa, 4-hlor-3-fluorfenilgrupa, 4-hlor-3,5-difluorfenilgrupa, 4-bromfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 3-fluor-4-metilfenilgrupa, 4-etilfenilgrupa, 4-etil-3-fluorfenilgrupa, 4-propilfenilgrupa, 4-izopropilfenilgrupa, 4-terc-butilfenilgrupa, 4-trifluormetilfenilgrupa, 3-fluor-4-trifluormetilfenilgrupa, 4-difluormetilfenilgrupa, 4-trihlormetilfenilgrupa, 4-dihlormetilfenilgrupa, 4-(2,2,2-trifluoretil)fenilgrupa, 4-(2,2,2-trihloretil)fenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 3-fluor-4-metoksifenilgrupa, 4-etoksifenilgrupa, 4-propoksifenilgrupa, 4-izopropoksifenilgrupa, 4-terc-butoksifenilgrupa, 4-trifluormetoksifenilgrupa, 4-difluormetoksifenilgrupa, 4-difluormetoksi-3-fluorfenilgrupa, 4-trihlormetoksifenilgrupa, 4-dihlormetoksifenilgrupa, tiofen-2-ilgrupa, tiofen-3-ilgrupa, 5-hlortiofen-2-ilgrupa, 1-metil-1H-imidazol-4-ilgrupa, tiazol-2-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 5-fluorpiridin-2-ilgrupa, 5-hlorpiridin-2-ilgrupa, 5-metilpiridin-2-ilgrupa, 5-etilpiridin-2-ilgrupa, 5-trifluormetilpiridin-2-ilgrupa, 5-metoksipiridin-2-ilgrupa, 5-difluormetoksipiridin-2-ilgrupa, piridin-3-ilgrupa, 6-fluorpiridin-3-ilgrupa, 6-hlorpiridin-3-ilgrupa, 6-metilpiridin-3-ilgrupa, 6-etilpiridin-3-ilgrupa, 6-trifluormetilpiridin-3-ilgrupa, 6-metoksipiridin-3-ilgrupa, 6-difluormetoksipiridin-3-ilgrupa, piridin-4-ilgrupa vai pirimidin-2-ilgrupa,

17. Medicīniskais oftalmoloģiskais šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir ūdeņraža atoms, metilgrupa, etilgrupa, izopropilgrupa vai heksilgrupa, R² un R³ katrs ir ūdeņraža atoms, Y ir benzofuran-2-ilgrupa, benzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-hlorbenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, 6-metoksibenzo[b]tiofen-2-ilgrupa, bifeniil-4-ilgrupa, 4'-fluorbifeniil-4-ilgrupa, 4'-hlorbifeniil-4-ilgrupa, 4-(pirazol-1-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-hlortiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(5-metil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dimetiltiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(4-trifluormetil-tiazol-2-il)fenilgrupa, 4-(tiazol-4-il)fenilgrupa, 4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilgrupa, 4-(piridin-2-il)fenilgrupa, 4-(piridazin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-2-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-4-il)fenilgrupa, 4-(pirimidin-5-il)fenilgrupa, 4-(4,5-dihidrotiazol-2-il)fenilgrupa vai 6-fenilpiridazin-3-ilgrupa, un Z ir fenilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3-hlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 2,6-dihlorfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, piridin-2-ilgrupa vai piridin-3-ilgrupa.

18. Medicīniskais oftalmoloģiskais šķīdums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur piridilaminoetiķskābes savienojums ir {6-[(benzofuran-2-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(benzo[b]tiofen-2-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(6-hlorbenzo[b]tiofen-2-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(6-hlorbenzo[b]tiofen-2-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(6-metoksibenzo[b]tiofen-2-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(bifeniil-4-ilmetil)(piridin-2-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(bifeniil-4-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe, {6-[(4'-fluorbifeniil-4-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino}etiķskābe,

{6-[(4'-hlorbifenil-4-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-fluorbenzolsulfonil)[4-(pirazol-1-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(pirazol-1-il)benzil)(piridin-2-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(pirazol-1-il)benzil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 izopropil(6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(tiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)acetāts,
 etil(6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(tiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)acetāts,
 (6-[(4-fluorbenzolsulfonil)[4-(tiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(tiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(piridin-3-ilsulfonil)[4-(tiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(4-trifluorometiltiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(tiazol-4-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(piridin-2-il)benzil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(piridazin-4-il)benzil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(pirimidin-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(4,5-dihidrotiazol-2-il)benzil)(4-fluorbenzolsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 {6-[(6-fenilpiridazin-3-ilmetil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 heksil(6-[(piridin-2-ilsulfonil)[4-(tiazol-2-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)acetāts,
 (6-[(4-(5-hlortiazol-2-il)benzil)(piridin-2-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(5-metiltiazol-2-il)benzil)(piridin-2-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(4-(4,5-dimetiltiazol-2-il)benzil)(piridin-2-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 (6-[(piridin-3-ilsulfonil)[4-(1,2,4-triazol-1-il)benzil]aminometil]piridin-2-il-amino)etiķskābe,
 etil(6-[(4-(pirazol-1-il)benzil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)acetāts, vai izopropil(6-[(4-(pirazol-1-il)benzil)(piridin-3-ilsulfonil)aminometil]piridin-2-il-amino)acetāts.

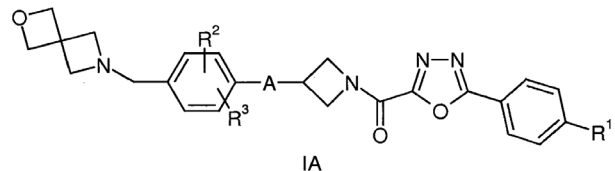
- (51) **C07D 491/10**^(2006.01) (11) **2424870**
A61K 31/4245^(2006.01)
A61P 3/04^(2006.01)
A61P 25/22^(2006.01)
A61P 25/24^(2006.01)
A61P 25/18^(2006.01)
A61P 25/28^(2006.01)
- (21) 10718670.2 (22) 29.04.2010
 (43) 07.03.2012
 (45) 16.12.2015
 (31) 174630 P (32) 01.05.2009 (33) US
 (86) PCT/GB2010/050698 29.04.2010
 (87) WO2010/125390 04.11.2010
 (73) AstraZeneca AB, 151 85 Södertälje, SE
 (72) JOHANSSON, Lars, Anders, Mikael, SE
 JUDKINS, Robert, Andrew, SE
 LI, Lanna, SE
 LOFBERG, Bjorn, Christian, Ingvar, SE
 PERSSON, Joachim, SE
- (74) Storm, Jan Peter, AstraZeneca, Intellectual Property, Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, GB
 Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **TERAPEITISKIE LĪDZEKĻI 713**
THERAPEUTIC AGENTS 713
- (57) 1. Savienojums ar formulu I:



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kurā:

R¹ apzīmē H, fluora atomu, hlora atomu, broma atomu, cianogrupu, C₁₋₃alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem, vai C₁₋₂alkoksigrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem; A apzīmē O vai S;
 R² un R³ neatkarīgi apzīmē H, fluora atomu, hlora atomu, broma atomu, C₁₋₄alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem, vai C₁₋₄alkoksigrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem; ar nosacījumu, ka R² un R³ neatrodas *meta*-pozīcijā viens pret otru;
 R⁴ un R⁵ neatkarīgi apzīmē H vai C₁₋₄alkilgrupu; un
 X un Y neatkarīgi apzīmē O vai CH₂ ar nosacījumu, ka X un Y nav vienādi.

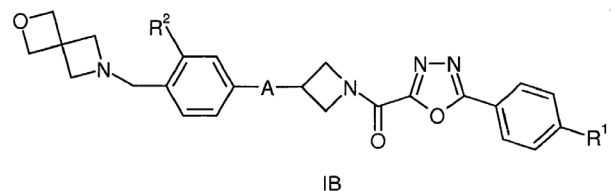
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu IA:



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kurā

R¹ apzīmē H, fluora atomu, hlora atomu, broma atomu, cianogrupu, C₁₋₃alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem, vai C₁₋₂alkoksigrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem;
 A apzīmē O vai S; un
 R² un R³ neatkarīgi apzīmē H, fluora atomu, hlora atomu, broma atomu, C₁₋₄alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem, vai C₁₋₄alkoksigrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem; ar nosacījumu, ka R² un R³ neatrodas *meta*-pozīcijā viens pret otru.

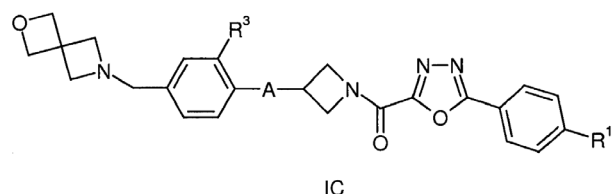
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu IB:



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kurā

R¹ apzīmē H, hlora atomu vai C₁₋₂alkoksigrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem;
 A apzīmē O vai S; un
 R² apzīmē H vai hlora atomu.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu IC:



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kurā

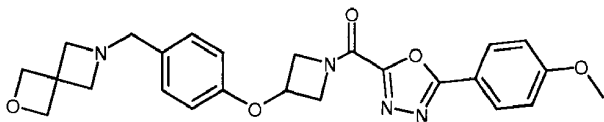
R¹ apzīmē H, hlora atomu vai C₁₋₂alkoksigrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem fluora atomiem;
 A apzīmē O vai S; un
 R³ apzīmē H vai hlora atomu.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur A apzīmē O.

6. Viens vai vairāki no sekojošiem savienojumiem:

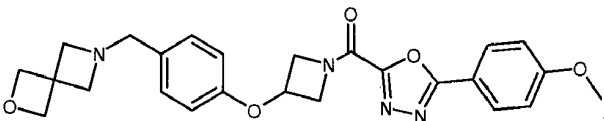
(3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)-3-hlorfenoksi)azetidīn-1-il)(5-fenil-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-hlorfenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-fenil-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-metoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenilītio)azetidīn-1-il)(5-fenil-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-fluorfenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-(difluormetoksi)fenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)-2-hlorfenoksi)azetidīn-1-il)(5-fenil-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 (3-(4-((3,3-dimetil-1-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-il)metil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-metoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 un
 (3-(2-hlor-4-((3,3-dimetil-1-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-il)metil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-fenil-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons;
 vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kas ir (3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-metoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, kas ir 3-(4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenoksi)azetidīn-1-il)(5-(4-metoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanons:



9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu nesēju un/vai atšķaidītāju.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai par medikamentu.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai slimības vai traucējuma, kurā MCH1 receptora modulēšana ir noderīga, ārstēšanā vai novēršanā.

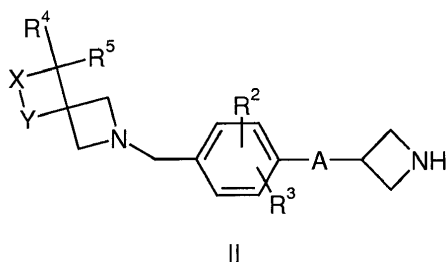
12. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, turklāt minētā slimība vai minētais traucējums ir izvēlēts no trauksmes, aptaukošanās un depresijas.

13. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 12. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, turklāt minētā slimība vai minētais traucējums ir aptaukošanās.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai slimības vai traucējuma, kas ir izvēlēts no šizofrēnijas ar kognitīvo deficītu, narkolepsijas, aptaukošanās, uzmanības deficīta un hiperaktivitātes, sāpēm un Alcheimera slimības, ārstēšanā.

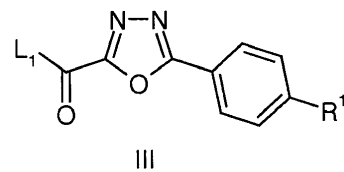
15. Paņēmiens savienojuma ar formulu I saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

a) savienojuma ar formulu II:



II

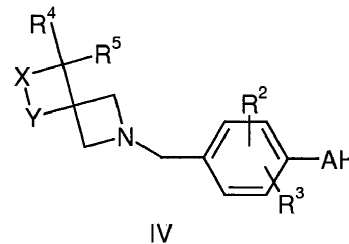
kurā A, X, Y, R², R³, R⁴ un R⁵ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā reakciju ar savienojumu ar formulu III:



III

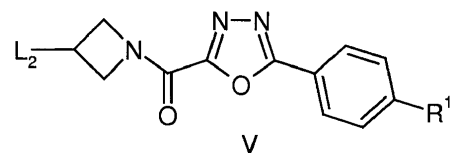
kurā R¹ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, un L₁, apzīmē aizejošo grupu, neobligāti šķīdinātāja klātbūtnē pie temperatūras diapazonā no 0 līdz 150 °C; vai

b) savienojuma ar formulu IV:



IV

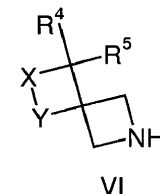
kurā A, X, Y, R², R³, R⁴ un R⁵ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, reakciju ar savienojumu ar formulu V:



V

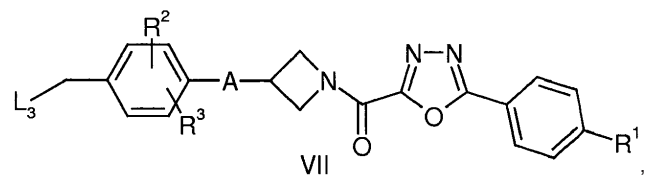
kurā R¹ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, un L₂, apzīmē aizejošo grupu, bāzes klātbūtnē, neobligāti šķīdinātāja klātbūtnē pie temperatūras diapazonā no 0 līdz 150 °C; vai

c) savienojuma ar formulu VI:



VI

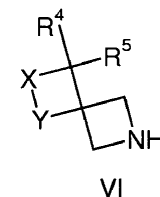
kurā X, Y, R⁴ un R⁵ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, reakciju ar savienojumu ar formulu VII:



VII

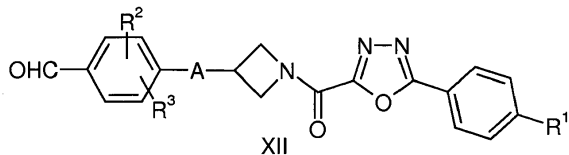
kurā R¹, R², R³ un A ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, un L₃, apzīmē aizejošo grupu, neobligāti šķīdinātāja klātbūtnē un neobligāti bāzes klātbūtnē pie temperatūras diapazonā no 0 līdz 150 °C; vai

d) savienojuma ar formulu VI:



VI

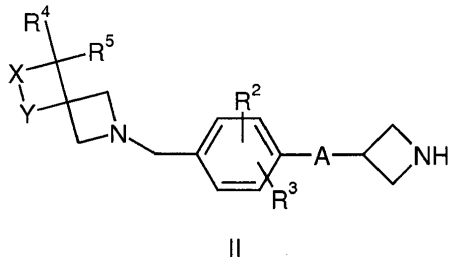
kurā X, Y, R⁴ un R⁵ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, reakciju ar savienojumu ar formulu XII:



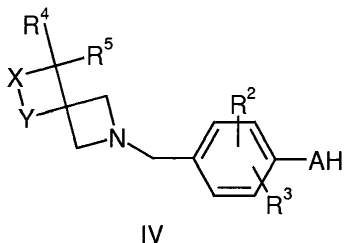
kurā R¹, R², R³ un A ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, reducējoša aģenta klātbūtnē piemērotā šķīdinātājā.

16. Savienojuma starpprodukts

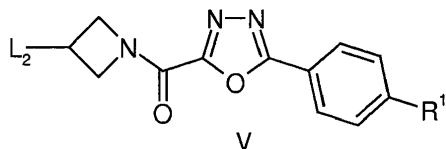
a) ar formulu II:



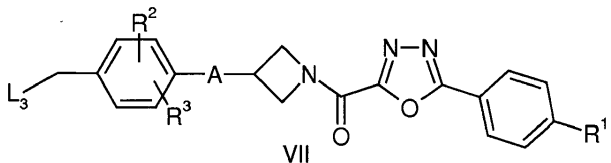
kurā A, X, Y, R², R³, R⁴ un R⁵ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, vai b) ar formulu IV:



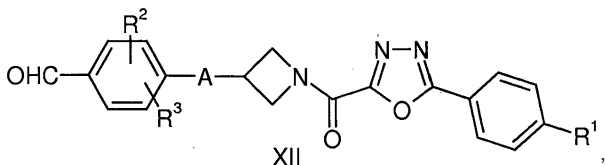
kurā A, X, Y, R², R³, R⁴ un R⁵ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, vai c) ar formulu V:



kurā R¹ ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, un L₂ apzīmē aizejošo grupu, kas izvēlēta no meziloksigrupas vai toziloksigrupas, vai d) ar formulu VII:

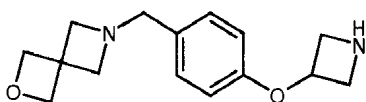


kurā R¹, R², R³ un A ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā, un L₃ apzīmē halogēna atomu, vai e) ar formulu XII:

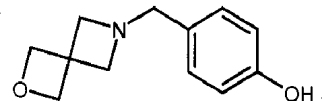


kurā R¹, R², R³ un A ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā.

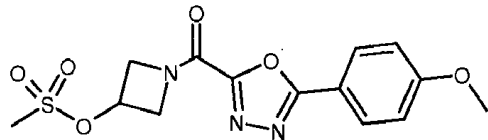
17. Starpprodukts ar formulu II saskaņā ar 16. pretenziju, kas ir 6-(4-(azetidīn-3-iloksi)benzil)-2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptāns



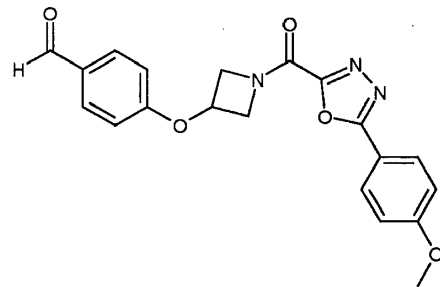
18. Starpprodukts ar formulu IV saskaņā ar 16. pretenziju, kas ir 4-(2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptan-6-ilmetil)fenols



19. Starpprodukts ar formulu V saskaņā ar 16. pretenziju, kas ir 1-(5-(4-metoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-karbonil)azetidīn-3-il-metān-sulfonāts



20. Starpprodukts ar formulu XII saskaņā ar 16. pretenziju, kas ir 4-(1-(5-(4-metoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-karbonil)azetidīn-3-iloksi)benzaldehīds



- | | |
|---|-------------------------|
| (51) A61K 9/00 ^(2006.01) | (11) 2440177 |
| A61K 31/5377 ^(2006.01) | |
| A61K 9/14 ^(2006.01) | |
| (21) 10742875.7 | (22) 08.06.2010 |
| (43) 18.04.2012 | |
| (45) 16.09.2015 | |
| (31) 185130 P | (32) 08.06.2009 (33) US |
| (86) PCT/IB2010/001659 | 08.06.2010 |
| (87) WO2010/143074 | 16.12.2010 |
| (73) Abbott GmbH & Co. KG, Max-Planck-Ring 2, 65205 Wiesbaden, DE | |
| (72) PACKHAEUSER, Claudia, DE | |
| STEIGER, Norbert, DE | |
| LIEPOLD, Bernd, DE | |
| KOSTELAC, Drazen, DE | |
| KNOBLOCH, Martin, DE | |
| (74) Modiano, Micaela Nadia, Modiano & Partners (DE), Thierschstrasse 11, 80538 München, DE | |
| Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV | |
| (54) BCL-2 SAIMES INHIBITORA FARMACEITISKA DOZĒJAMA FORMA PERORĀLAI IEVADĪŠANAI | |
| PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM FOR ORAL ADMINISTRATION OF A BCL-2 FAMILY INHIBITOR | |

(57) 1. Farmaceutiska dozējama forma, kura ietver cietu disperģijas produktu, kas ietver farmaceutiski aktīvu ingredientu, vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu polimēru un vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu šķīdinātāju (*solubilizer*), un minētais farmaceutiski aktīvais ingredients ir N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoi)-4-(((1R)-3-(morfolīn-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīds, tā sāls, hidrāts vai solvāts.

2. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt farmaceutiski pieņemamais šķīdinātājs ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst nejonu šķīdinātāji, anjonu šķīdinātāji un to maisījumi.

3. Dozējamā forma saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt farmaceutiski pieņemamais nejonu šķīdinātājs ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst polioliu taukskābju esteri, polialkoksilētu polioliu taukskābju esteri, polialkoksilēti augstāko spirtu ēteri, tokoferilsavienojumi un

divu vai vairāku tādu vielu maisījumi, un turklāt farmaceitiski pieņemami anjonu šķīdinātāji ir izvēlēti no grupas, kurā ietilpst alkilsulfāti, alkilkarboksilāti, alkilbenzolsulfāti un otrējie alkānsulfonāti.

4. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt farmaceitiski pieņemamais šķīdinātājs ir izvēlēts no tokoferilsavienojumiem, kuri ietver polialkilēnglikola fragmentu, sorbitāna taukskābju esteriem un polioksietilēnsorbitāna taukskābju esteriem.

5. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt farmaceitiski pieņemamais šķīdinātājs ietver vismaz vienu alfa-tokoferilpolietilēnglikola sukcinātu, sorbitāna monolaureātu un polioksietilēnsorbitāna monolaureātu.

6. Dozējamā forma saskaņā ar 2. pretenziju, kas ietver vismaz vienu farmaceitiski pieņemamu nejonu šķīdinātāju un vismaz vienu anjonu šķīdinātāju.

7. Dozējamā forma saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt farmaceitiski pieņemamais nejonu šķīdinātājs ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst sorbitāna taukskābju esteri, polioksietilēnsorbitāna taukskābju esteri un alfa-tokoferilpolietilēnglikola sukcināts, un farmaceitiski pieņemamais anjonu šķīdinātājs ir nātrija laurilsulfāts.

8. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur negaisotšu farmaceitiski aktīvā ingredienta solventu, minētajam solventam istabas temperatūrā jābūt šķīdri stāvoklī.

9. Dozējamā forma saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt minētais negaisotšais solvents ir propilēnglikols.

10. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais farmaceitiski pieņemamais polimērs ir N-vinilpirolidona homopolimērs vai kopolimērs.

11. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais farmaceitiski pieņemamais kopolimērs ir N-vinilpirolidona un vinilacetāta kopolimērs.

12. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais farmaceitiski aktīvais ingredients ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoi)-4-(((1R)-3-(morfolin-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluorometil)sulfonil)benzolsulfonamīds kā brīva bāze, nātrija sāls un dihidrohlordā sāls un to kombinācijas.

13. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur vismaz vienu piedevu, izvēlētu no plūsmas regulatoriem, dezintegrantiem, apjomu palielinošām vielām un smērvielām.

14. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt cietais dispersijas produkts ietver aptuveni no 0,5 līdz 40 masas % farmaceitiski aktīvā ingredients, 40 līdz 97,5 masas % minētā vismaz viena farmaceitiski pieņemamā polimēra, 2 līdz 20 masas % minētā vismaz viena šķīdinātāja un 0 līdz 15 masas % piedevu.

15. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver mazāk nekā 1,5 masas % aktīvā ingredients sulfoksīda sadalīšanās produktu attiecībā pret aktīvā ingredients masu.

16. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver mazāk nekā 1,2 masas % aktīvā ingredients sulfoksīda sadalīšanās produktu attiecībā pret aktīvā ingredients masu.

17. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver mazāk nekā 0,9 masas % aktīvā ingredients sulfoksīda sadalīšanās produktu attiecībā pret aktīvā ingredients masu.

18. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt cietais dispersijas produkts ir pārkausēts sacietējis maisījums.

19. Dozējamā forma saskaņā ar 1. pretenziju pielietošanai proliferatīvu traucējumu ārstēšanā, ievadot to pacientam, kuram ir tāda nepieciešamība.

20. Dozējamā forma saskaņā ar 19. pretenziju, turklāt proliferatīvais traucējums ir izvēlēts no audzējiem un vēžiem.

21. Dozējamā forma saskaņā ar 20. pretenziju, turklāt proliferatīvais traucējums ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst mezotelioma, urīnpūšļa vēzis, aizkuņģa dziedzera vēzis, ādas vēzis, galvas un kakla vēzis, ādas vai intraokulāra melanoma, olnīcu vēzis, krūts vēzis, dzemdes vēzis, olvadū karcinoma, endometrija karcinoma, dzemdes kakla karcinoma, maksts karcinoma, vulvas karcinoma, kaulu vēzis, dzemdes kakla vēzis, resnās zarnas vēzis, taisnās zarnas vēzis, anālā apvidus vēzis, kuņģa vēzis, kuņģa-zarnu trakta (kuņģa, resnās un taisnās zarnas, divpadsmitpirkstu zarnas) vēzis, hroniska limfocītiska leukēmija, akūta limfocītiska leukēmija, barības vada vēzis, tievo zarnu vēzis, endokrīnās sistēmas vēzis, vairogdziedzera vēzis, epitēlijķermenīšu vēzis, virsnieru dziedzera vēzis, mīksto audu sarkoma, urīnizvadkanāla vēzis, dzimumlocekļa vēzis, aknu šūnu vēzis (aknās un žultsceļā), primārs vai sekundārs

centrālās nervu sistēmas audzējs, primārs vai sekundārs smadzeņu audzējs, Hodžkina slimība, hroniska vai akūta leukēmija, hroniska mieloīda leukēmija, limfocītiska limfoma, limfoblastiskā leukēmija, folikulārā limfoma, T-šūnu vai B-šūnu izcelsmes limfoīdas ļaundabīgas slimības, melanoma, multiplā mieloma, mutes dobuma vēzis, olnīcu vēzis, ne-sīkšūnu plaušu vēzis, prostatas vēzis, sīkšūnu plaušu vēzis, nieru un urīnceļu vēzis, nieru šūnu karcinoma, nieru iegurņa karcinoma, centrālās nervu sistēmas neoplazmas, primāra centrālās nervu sistēmas limfoma, ne-Hodžkina limfoma, mugurkaula audzēji, smadzeņu stumbra glioma, hipofīzes adenoma, virsnieru dziedzera vēzis, žultspūšļa vēzis, liesas vēzis, holangiokarcinoma, fibrosarkoma, neiroblastoma, retinoblastoma, un to kombinācijas.

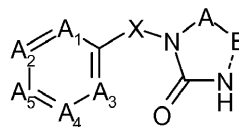
22. Cietas dozējamas formas saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanas process, kas ietver:

(a) farmaceitiski aktīvā ingredients vai tā sāls, hidrāta vai solvāta, vismaz viena farmaceitiski pieņemama polimēra un vismaz viena šķīdinātāja homogēna sakausējuma iegūšanu, un
(b) iespēju sakausējumam sacietēt, lai iegūtu cietu dispersijas produktu.

23. Process saskaņā ar 22. pretenziju, kas papildus ietver minētā cietā dispersijas produkta sasmalcināšanu un minētā cietā dispersijas produkta saspiešanu tabletē.

24. Process saskaņā ar 22. pretenziju, kas papildus ietver minētā cietā dispersijas produkta sasmalcināšanu un minētā cietā dispersijas produkta iepildīšanu kapsulas apvalkā.

- (51) **C07D 285/08**^(2006.01) (11) **2451794**
C07D 417/10^(2006.01)
C07D 417/12^(2006.01)
A61K 31/433^(2006.01)
- (21) 10759940.9 (22) 08.07.2010
(43) 16.05.2012
(45) 27.01.2016
(31) 213735 P (32) 08.07.2009 (33) US
(86) PCT/GB2010/001315 08.07.2010
(87) WO2011/004162 13.01.2011
(73) BALTIC BIO AB, Sufflörgränd 14, Box 489, 90109 Umeå, SE
(72) WESTMAN, Jacob, SE
HALLETT, Allan, GB
VAGBERG, Jan, SE
(74) Potter Clarkson LLP, The Belgrave Centre, Talbot Street, Nottingham NG1 5GG, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **1,2,4-TIAZOLIDIN-3-ONA ATVASINĀJUMI UN TO IZMANTOŠANA VĒŽA ĀRSTĒŠANĀ**
1,2,4-THIAZOLIDIN-3-ONE DERIVATIVES AND THEIR USE IN THE TREATMENT OF CANCER
- (57) 1. Savienojums ar formulu I:



kurā:

A ir C(=N-W-D) vai S;

B ir S vai C(-NH-W-D);

ja:

A ir C(=N-W-D) un B ir S, tad pārtrauktā līnija starp B un N atomu ir vienkāršā saite; vai

A ir S un B ir C(-NH-W-D), tad pārtrauktā līnija starp B un N atomu ir dubultsaite;

X ir -Q-[CR^xR^y]_n;

W ir -[CR^xR^y]_m- vai -C(O)-[CR^xR^y]_p;

Q ir saite, -N(R^a)-, -S- vai -O-;

no A₁ līdz A₅ attiecīgi ir C(R¹), C(R²), C(R³), C(R⁴) un C(R⁵) vai alternatīvi līdz diviem no A₁ līdz A₅ neatkarīgi ir N;

D ir fenilgrupa, piridilgrupa vai pirimidinilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākām R⁶ grupām;

R^x un R^y, katrā gadījumā, ja tāda ir, neatkarīgi ir izvēlētas no H, halogēna atoma, C₁₋₆alkilgrupas (kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem), arilgrupas (kas neobligāti

ir aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem) vai R^x un R^y ir saistītas, lai kopā ar oglekļa atomu, pie kura tās ir piesaistītas, veidotu nearomātisku 3- līdz 8-locekļu gredzenu, kas neobligāti satur 1 līdz 3 heteroatomus, kas izvēlēti no O, S un N, kur gredzens neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma vai C_{1-6} alkilgrupas (kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem);

no R^1 līdz R^5 neatkarīgi ir H, halogēna atoms, $-R^7$, $-CF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)R^7$, $-C(O)OR^7$, $-C(O)-N(R^{7a})R^{7b}$, $-N(R^{7a})R^{7b}$, $-N(R^7)_3^+$, $-SR^7$, $-OR^7$, $-NH(O)R^7$, $-SO_3R^7$, arilgrupa vai heteroarilgrupa (kur arilgrupa un heteroarilgrupa neobligāti un neatkarīgi ir aizvietotas ar vienu vai vairākiem grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un R^{16}) vai jebkuras divas no R^1 līdz R^5 , kuras atrodas blakus viena otrai, neobligāti ir saistītas, lai kopā ar pamata benzola gredzena diviem atomiem savienojumā ar formulu I veidotu aromātisku vai nearomātisku 3- līdz 8-locekļu gredzenu, kas neobligāti satur 1 līdz 3 heteroatomus, kuri izvēlēti no O, S un N, kur pats gredzens neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, $-R^7$, $-OR^7$ un $=O$;

R^6 neatkarīgi katrā gadījumā, ja tāda ir, ir ciāngrupa, $-NO_2$, halogēna atoms, $-R^{16}$, $-OR^8$, $-N(R^8)C(O)R^8$, $-NR^9R^{10}$, $-SR^{11}$, $-Si(R^{12})_3$, $-OC(O)R^{13}$, $-C(O)OR^{13}$, $-C(O)R^{14}$, $-C(O)NR^{15a}R^{15b}$, $-S(O)_2NR^{15c}R^{15d}$, arilgrupa vai heteroarilgrupa (kur arilgrupa un heteroarilgrupa neobligāti un neatkarīgi ir aizvietotas ar vienu vai vairākiem grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un R^{16}) vai jebkuras divas R^6 grupas, kas atrodas blakus viena otrai, neobligāti ir saistītas, lai kopā ar pamata benzola gredzena diviem atomiem savienojumā ar formulu I veidotu aromātisku vai nearomātisku 3- līdz 8-locekļu gredzenu, kas neobligāti satur 1 līdz 3 heteroatomus, kuri izvēlēti no O, S un N, kur gredzens pats neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, $-R^7$, $-OR^7$ un $=O$;

R^7 , katrā gadījumā, ja tāda ir, ir izvēlēta no H vai C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas (kurā pēdējās četras grupas neobligāti ir aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem);

R^{7a} un R^{7b} neatkarīgi ir izvēlētas no H vai C_{1-6} alkilgrupas, C_{1-6} cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, vai R^{7a} un R^{7b} neobligāti ir saistītas, lai kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tās ir piesaistītas, veidotu aromātisku vai nearomātisku 3- līdz 8-locekļu gredzenu, kas neobligāti satur 1 līdz 3 heteroatomus, kas izvēlēti no O, S un N, kur gredzens pats neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, $-R^7$, $-OR^7$ un $=O$; R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15a} , R^{15b} , R^{15c} un R^{15d} katrā gadījumā, ja šeit tiek izmantota, neatkarīgi ir H vai R^{16} ;

R^{16} katrā gadījumā, ja tāda ir, ir C_{1-6} alkilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;

n ir 1 vai 2;

m ir 0, 1 vai 2;

p ir 0, 1 vai 2;

vai farmaceitiski pieņemams sāls vai solvāts, ar nosacījumu, ka:

(A) ja D ir fenilgrupa, vismaz viens no A_1 līdz A_5 nav (C-H) un/vai D ir aizvietots ar vienu vai vairākām $-R^6$ grupām, un turklāt ar nosacījumu, ka:

(B) savienojums ar formulu I vai tā farmaceitiski pieņemams sāls vai solvāts nav 4-benzil-5-pikrilimino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

vismaz viens no A_1 līdz A_5 nav (C-H) un/vai D ir aizvietots ar vienu vai vairākām $-R^6$ grupām;

B ir S;

R^x un R^y neatkarīgi ir izvēlētas no H, C_{1-6} alkilgrupas (kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem fluora atomiem), arilgrupas (kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, piemēram, hlora atomiem) vai R^x un R^y ir saistītas, lai kopā ar oglekļa atomu, pie kura tās ir piesaistītas, veidotu nearomātisku 3- līdz 6-locekļu neaizvietotu gredzenu;

X ir $-CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-O-CH_2CH_2-$, $-N(CH_3)-CH_2CH_2-$, $-S-CH_2CH_2-$, 1,1-ciklopropilgrupa vai $-C(H)(4\text{-hlorfenil})$ grupa;

vismaz viena no R^1 līdz R^5 , ja tāda ir, ir halogēna atoms, $-R^7$, $-CF_3$, $-CN$, $-C(O)R^7$, $-C(O)OR^7$, $-C(O)-N(R^{7a})R^{7b}$, $-N(R^7)_3^+$, $-SR^7$, $-OR^7$ vai $-NH(O)R^7$, vai jebkuras divas no R^1 līdz R^5 , kas atrodas blakus viena otrai, neobligāti ir saistītas, lai kopā ar pamata benzola gredzena diviem atomiem savienojumā ar formulu I veidotu aromātisku

vai nearomātisku 3- līdz 8-locekļu gredzenu, kas neobligāti satur 1 līdz 3 heteroatomus, kuri izvēlēti no O, S un N, kur gredzens pats neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atomiem, $-R^7$, $-OR^7$ un $=O$; R^6 neatkarīgi ir $-R^{16}$, $-CN$, $-OCF_3$, $-NO_2$, $-Br$, $-Cl$, $-F$, $-OR^8$, $-NR^9R^{10}$ vai $-SR^{11}$;

n ir 1 vai 2; m ir 0 vai 1; p ir 0 vai 1; un/vai

W ir tiešā saite, $-CH_2-$, $-C(O)-$ vai $-C(O)CH_2-$.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

vismaz viena no R^1 līdz R^5 , ja tāda ir, ir 4H-[1,2,4]-triazolilgrupa, $-OR^7$, $-Cl$, $-F$, $-CF_3$, $-CN$ vai $-C(O)-N(R^{7a})R^{7b}$;

katra R^6 neatkarīgi ir $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-F$ vai $-Cl$; un/vai

W ir $-C(O)-$ vai $-C(O)CH_2-$.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no grupas:

i) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-[[3-(trifluormetil)fenil]metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

ii) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-[(4-metoksifenil)metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

iii) 4-[(4-hlorfenil)metil]-5-(3,4-dihlorfenil)imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

iv) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-[(3,4-difluorfenil)metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

v) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-[(3-fluorfenil)metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

vi) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-[fenil]metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

vii) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-fenetil-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

viii) 4-[2-[(4-hlorfenil)-metilamino]etil]-5-(3,4-dihlorfenil)imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

ix) 4-[2-(4-hlorfenil)sulfaniletil]-5-(3,4-dihlorfenil)imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

x) 3-[[5-(3,4-dihlorfenil)imino-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-4-il]metil]-N-metilbenzamīds;

xi) 5-[(6-hlor-3-piridil)imino]-4-[(3,4-difluorfenil)metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

xii) 4-[[4-[(3,4-difluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]amino]benzonitrils;

xiii) 4-[(3,4-difluorfenil)metil]-5-[4-(trifluormetil)fenil]imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

xiv) 4-[(3,4-difluorfenil)metil]-5-[4-(trifluormetoksi)fenil]imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

xv) 3-[5-(3,4-dihlorfenil)imino-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-4-il]metil]benzonitrils;

xvi) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-[[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

xvii) 4-[1-(4-hlorfenil)ciklopropil]-5-(4-hlorfenil)imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

xviii) 5-[(4-hlorfenil)metilimino]-4-[(3,4-difluorfenil)metil]-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;

N-[3-okso-2-[[3-(trifluormetil)fenil]metil]-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xix) 4-fluor-N-[3-okso-2-[[3-(trifluormetil)fenil]metil]-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xx) 2-(4-fluorfenil)-N-[3-okso-2-[[3-(trifluormetil)fenil]metil]-1,2,4-tiadiazol-5-il]acetamīds;

xxi) 4-hlor-N-[2-[(3,4-difluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxii) 4-hlor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxiii) 4-hlor-N-[2-[(4-hlorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxiv) 4-hlor-N-[2-[2-(fenoksi)etil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxv) 4-hlor-N-[2-[2-[(4-hlorfenil)metilamino]etil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxvi) 4-hlor-N-[2-[2-(4-hlorfenil)sulfaniletil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxvii) 3,4-dihlor-N-[2-[1-(4-fluorfenil)ciklopropil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxviii) 3,4-dihlor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;

xxix) N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]-4-metoksibenzamīds;

xxx) 2,6-dihlor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;
 xxxi) 2,4-dihlor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;
 xxxii) N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]-4-(trifluorometoksi)-benzamīds;
 xxxiii) N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]-3,5-bis(trifluorometil)-benzamīds;
 xxxiv) 3,4-difluor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;
 xxxv) 2-hlor-6-fluor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;
 xxxvi) 3,5-difluor-N-[2-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]benzamīds;
 xxxvii) 5-(3,4-dihlorfenil)imino-4-(2-fenoksietil)-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;
 xxxviii) 5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-(2-fenoksietil)-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 xxxix) 4-benzhidril-5-(3,4-dihlorfenil)imino-1,2,4-tiadiazolidin-3-ons;
 xl) 4-hlor-N-[4-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]benzamīds;
 xli) 4-hlor-N-[4-[(4-hlorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]benzamīds;
 xlii) 4-hlor-N-[3-okso-4-[[3-(trifluorometil)fenil]metil]-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]-benzamīds;
 xliii) N-[4-[(3-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]-4-(trifluorometil)-benzamīds;
 xliv) N-[4-[(3-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]-3,5-bis(trifluorometil)benzamīds;
 xlv) N-[4-[(3,4-dihlorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]-3,4-difluorbenzamīds;
 xlvi) 1,5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-(4-metoksibenzil)-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 xlvii) 1,5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-(4-hlorbenzil)-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 xlviii) 1,5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-(3,4-difluorbenzil)-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 xlix) 1, 5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-(3-fluorbenzil)-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 l) 1, 5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-(benzil)-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 li) 5-(3,4-dihlorfenilamino)-2-fenetil-[1,2,4]tiadiazol-3-ons;
 lii) 2-[2-[(4-hlorfenil)-metilamino]etil]-5-[(3,4-dihlorfenil)amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 liii) 2-[2-(4-hlorfenil)sulfaniletil]-5-[(3,4-dihlorfenil)amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 liv) 3-[[5-[(4-hlorfenil)amino]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-2-il]metil]-N-metilbenzamīds;
 lv) 5-[(6-hlor-3-piridil)amino]-2-[(3,4-difluorfenil)metil]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lvi) 2-[(3,4-difluorfenil)metil]-5-[[4-(trifluorometil)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lvii) 2-[(3,4-difluorfenil)metil]-5-[[4-(trifluorometoksi)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lviii) 5-[[4-hlorfenil]amino]-2-[1-(4-hlorfenil)ciklopropil]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lix) 5-[(3,4-dihlorfenil)metilamino]-2-[(3,4-difluorfenil)metil]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lx) 3,4-dihlor-N-[4-[(4-fluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazolidin-5-ilidēn]benzamīds;
 lxi) 2-[(4-metoksifenil)metil]-5-[[4-(trifluorometil)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxii) 2-[(4-hlorfenil)metil]-5-[[4-(trifluorometil)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxiii) 2-[(3-fluorfenil)metil]-5-[[4-(trifluorometil)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxiv) 2-[feniletil]-5-[[4-(trifluorometil)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxv) 2-[(4-metoksifenil)metil]-5-[[4-(trifluorometoksi)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxvi) 2-[(4-hlorfenil)metil]-5-[[4-(trifluorometoksi)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxvii) 2-[(3-fluorfenil)metil]-5-[[4-(trifluorometoksi)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-3-ons;
 lxviii) 2-[feniletil]-5-[[4-(trifluorometoksi)fenil]amino]-1,2,4-tiadiazol-

3-ons; un

lxix) 4-[[2-[(3,4-difluorfenil)metil]-3-okso-1,2,4-tiadiazol-5-il]amino]benzonitrils.

5. Savienojums, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemams sāls vai solvāts, taču bez nosacījuma (B), izmantošanai par farmaceitisku preparātu.

6. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemams sāls vai solvāts, taču bez nosacījuma (B), maisījumā ar farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, šķīdinātāju vai nesēju.

7. Kombinēts līdzeklis, kas satur:

(A) savienojumu ar formulu I, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemamu sāli vai solvātu, taču bez nosacījuma (B); un

(B) citu terapeitisku līdzekli, kas ir piemērots vēža ārstēšanai, kurā katra no sastāvdaļām (A) un (B) ir izgatavota maisījumā ar farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, šķīdinātāju vai nesēju.

8. Kombinēts līdzeklis saskaņā ar 7. pretenziju, kas satur: farmaceitisku kompozīciju, kas satur savienojumu ar formulu I, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemamu sāli vai solvātu, taču bez nosacījuma (B), citu terapeitisku līdzekli, kas ir piemērots vēža ārstēšanai, un farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, šķīdinātāju vai nesēju; vai daļas komplektu, kas ietver šādas sastāvdaļas:

(a) farmaceitiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formulu I, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemamu sāli vai solvātu, taču bez nosacījuma (B), maisījumā ar farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, šķīdinātāju vai nesēju; un

(b) farmaceitiska kompozīcija, kas satur citu terapeitisku līdzekli, kas ir piemērots vēža ārstēšanai maisījumā ar farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, šķīdinātāju vai nesēju, kur katra no sastāvdaļām (a) un (b) ir izgatavotas formā, kas ir piemērota ievadīšanai kopā ar otru sastāvdaļu.

9. Kombinēts līdzeklis, kas satur daļas komplektu saskaņā ar 8. pretenziju, kurā sastāvdaļas (a) un (b) ir piemērotas secīgai, atsevišķai un/vai vienlaicīgai izmantošanai vēža ārstēšanai.

10. Kombinēts līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 9. pretenzijai, kurā cits terapeitiskais līdzeklis ir izvēlēts no šādiem līdzekļiem:

- (i) citostatisks līdzeklis vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (ii) angioģenēzes inhibitors vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (iii) tamoksifēns vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (iv) aromatāzes inhibitors vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (v) trastuzumabs (Herceptīns) vai cita antiiviela, kas ir piemērota vēža ārstēšanai;
- (vi) tirozīnkināzes inhibitors vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (vii) glitazons vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (viii) biguanīdi vai to farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (ix) statīns vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (x) mTOR (rapamicīna mērķa receptors zīdītājiem) aktivitātes inhibitors vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (xi) oligomīcīns vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (xii) AICAR (aminoimidazolkarboksamīda ribonukleotīds) vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (xiii) peroksisomu proliferāciju aktivēta receptora (PPAR) agonists vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (xiv) A-769662 (6,7-dihidro-4-hidroksi-3-(2'-hidroksi[1,1'-bifenil]-4-il)-6-okso-tiēn-[2,3-b]piridīn-5-karbonitrils) vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;
- (xv) D942 (5-(3-(4-(2-(4-fluorfenil)etoksi)-fenil)propil)furān-2-karbonskābe) vai tās farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;

(xvi) AM251 (1-(2,4-dihlorfenil)-5-(4-jodfenil)-4-metil-N-(1-piperidil)pirazol-3-karboksamīds) vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums;

(xvii) SIRT1 aktivators vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums; un/vai

(xviii) salidroziāds vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, solvāts vai farmaceitiski funkcionāls atvasinājums.

11. Savienojuma ar formulu I, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemama sāls vai solvāta, taču bez nosacījuma (B), vai kombinēta līdzekļa, kā noteikts jebkurā no 7. līdz 10. pretenzijai, izmantošana medikamenta ražošanā vēža ārstēšanai.

12. Savienojums, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemams sāls vai solvāts, taču bez nosacījuma (B), vai kombinēts līdzeklis, kā noteikts jebkurā no 7. līdz 10. pretenzijai, izmantošanai vēža ārstēšanā.

13. Kombinēts līdzeklis saskaņā ar 9. pretenziju, izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju vai savienojums, vai kombinēts preparāts saskaņā ar 12. pretenziju, kurā:

vēzis ir viendabīgs audzējs vai asinsrades sistēmas audzējs;

vēzis ir resnās zarnas, krūts vai prostatas viendabīgs audzējs;

vēzis ir krūts vēzis; vai

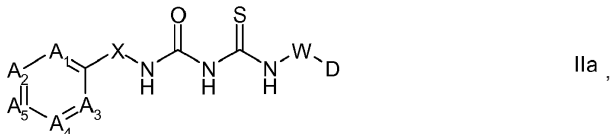
vēzis ir asinsrades sistēmas audzējs, kas ir leukēmija.

14. Savienojuma ar formulu I, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemama sāls vai solvāta, taču bez nosacījuma (B), izmantošana medikamenta ražošanā diabēta ārstēšanai.

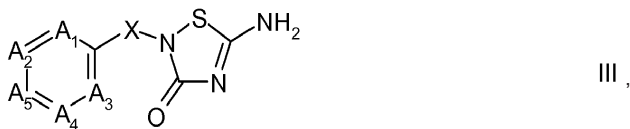
15. Savienojums, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai farmaceitiski pieņemams sāls vai solvāts, taču bez nosacījuma (B), izmantošanai diabēta ārstēšanā.

16. Savienojuma ar formulu I, kā noteikts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, iegūšanas paņēmieni,

(i) savienojumiem ar formulu I, kur A ir S, savienojuma ar formulu IIa:



kurā A₁ līdz A₅, X, W un D ir, kā noteikts 1. pretenzijā, ciklizēšana; (ii) savienojumiem ar formulu I, kur A ir S, W ir -[CR^xR^y]_m- un m ir 1 vai 2, savienojuma ar formulu III:



kur A₁ līdz A₅ un X ir, kā noteikts 1. pretenzijā, reakcija ar savienojumu ar formulu IV:



kurā L₂ ir piemērota aizejošā grupa, W¹ ir -[CR^xR^y]_m-, kurā m ir 1, bet D ir, kā noteikts 1. pretenzijā;

(iii) savienojumiem ar formulu I, kur A ir S, W ir -[CR^xR^y]_m- un m ir 0, savienojuma ar formulu III, kā noteikts iepriekš, reakcija ar savienojumu ar formulu V:



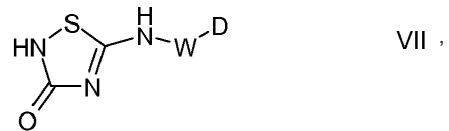
kurā L₃ ir piemērota aizejošā grupa, bet D ir, kā noteikts 1. pretenzijā;

(iv) savienojumiem ar formulu I, kur A ir S, W ir -C(O)-[CR^xR^y]_p-, savienojuma ar formulu III, kā noteikts iepriekš, reakcija ar savienojumu ar formulu VI:

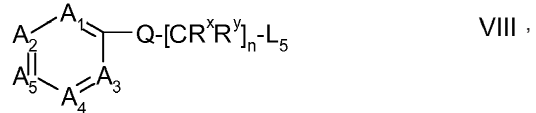


kurā L₄ ir piemērota aizejošā grupa vai -OH, W² ir -C(O)-[CR^xR^y]_p-, bet D ir, kā noteikts 1. pretenzijā;

(v) savienojumiem ar formulu I, kur A ir S un Q ir saite, -O- vai -S-, savienojuma ar formulu VII:

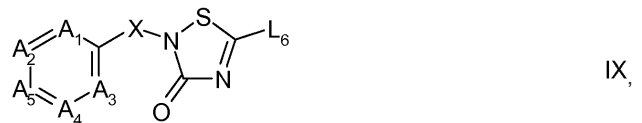


kurā W un D ir, kā noteikts 1. pretenzijā, reakcija ar savienojumu ar formulu VIII:



kur A₁ līdz A₅, n, R^x un R^y ir, kā noteikts 1. pretenzijā, L₅ ir piemērota aizejošā grupa un Q ir saite, -O- vai -S-;

(vi) savienojumiem ar formulu I, kur W ir -[CR^xR^y]_m-, savienojuma ar formulu IX:

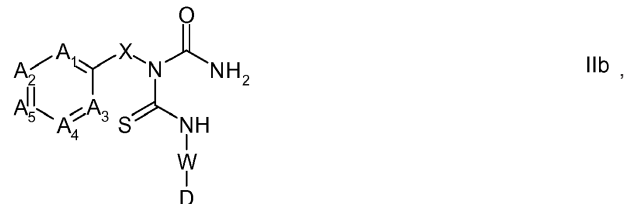


kurā L₆ ir piemērota aizejošā grupa, bet A₁ līdz A₅ un X ir, kā noteikts 1. pretenzijā, reakcija ar savienojumu ar formulu X:



kurā W un D ir, kā noteikts 1. pretenzijā; un

(vii) savienojumiem ar formulu I, kur B ir S, savienojuma ar formulu IIb:



kurā A₁ līdz A₅, X, W un D ir, kā noteikts 1. pretenzijā, ciklizēšana.

- | | |
|--|-------------------------|
| (51) B65D 83/00 ^(2006.01) | (11) 2488425 |
| A47F 1/035 ^(2006.01) | |
| A47F 1/08 ^(2006.01) | |
| G07F 11/50 ^(2006.01) | |
| (21) 10823695.1 | (22) 13.10.2010 |
| (43) 22.08.2012 | |
| (45) 23.12.2015 | |
| (31) 0950757 | (32) 13.10.2009 (33) SE |
| 1050482 | 17.05.2010 SE |
| (86) PCT/SE2010/051104 | 13.10.2010 |
| (87) WO2011/046501 | 21.04.2011 |
| (73) Click Candy AB, Bror Sahlströms väg 1, 671 41 Arvika, SE | |
| Candymix AB, Bråne 69, 686 98 Gråsmark, SE | |
| (72) GUNSTAD, Frida, SE | |
| GUNSTAD, Mikael, SE | |
| JUNKELL, Fredrik, SE | |
| (74) Johansson, Lars E., Hynell Patenttjänst AB, P.O. Box 138, 683 23 Hagfors, SE | |
| Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV | |
| (54) IERĪCE GRANULĒTU PĀRTIKAS PRODUKTU IZVADĪŠANAI UN IELIKTNIS IEVIETOŠANAI IERĪCĒ GRANULĒTO PĀRTIKAS PRODUKTU IZVADĪŠANAI | |
| A DEVICE FOR DISPENSING GRANULAR FOOD PRODUCTS AND AN INSERT TO BE INSERTED IN A DEVICE FOR DISPENSING GRANULAR FOOD PRODUCTS | |
| (57) 1. Ierīce (1) granulētu pārtikas produktu (2), tādu kā, piemēram, saldumu, izvadīšanai, turklāt ierīce (1) satur: konteineru (3), kura galā (5) ir izvadīšanas atvere (14), caur kuru granulēto pārtikas produktu var izlaist no konteinerā (3); turētāju vai pamatni (9), uz | |

kuras konteiners (3) ir novietots tā, ka konteiners longitūdinālā ass (L) ir slīpa attiecībā pret horizontālo plakni, un slīpuma leņķis ir diapazonā no 3° līdz 80°, vēlams diapazonā no 5° līdz 60°, vēl labāk diapazonā no 10° līdz 25°, pie kam: konteiners (3) turētājā vai pamatnē (9) ir ierīkots tā, ka ir rotējams ap savu longitūdinālo asi (L); konteineram (3) ir iekšpusē, kas aprīkota ar vismaz vienu granulētā pārtikas produkta (2) vadotni (17, 18, 19), kura ir fiksēta attiecībā pret konteineru (3) un satur daudzus pacēlumus (27) konteiners (3) sienas iekšējā virsmā (16); pacēlumi (27) būtībā stiepjas konteiners (3) longitūdinālās ass (L) virzienā un konteinerā (3) ir ierīkoti tā, ka granulētais pārtikas produkts (2) tiek vadīts virzienā uz izvadīšanas atveri (14), kad konteiners (3) griežas ap savu longitūdinālo asi (L), bet paliek uz vietas, kad konteiners (3) ir miera stāvoklī; konteineram (3) ap izvadīšanas atveri (14) ir apmale (18), kas izstiepta radiāli uz iekšu virzienā uz konteiners (3) longitūdinālo asi,

kas raksturīga ar bremsējošu plāksni (19) konteiners (3) iekšpusē zināmā attālumā no izvadīšanas atveres (14) pretēji pārvietošanas virzienam, turklāt bremsējošā plāksne (19) daļēji bloķē ceļu uz izvadīšanas atveri (14) tā, ka zonā starp apmali (18) un bremsējošo plāksni (19) minētie pacēlumi (27) konteiners (3) iekšējās sienas virsmā (16) granulētajam pārtikas produktam veido atsevišķus nodalījumus, un ar to, ka bremsējošā plāksne (19) vai nu ir nekustīgi piestiprināta pie vismaz viena no minētajiem pacēlumiem (27), vai ir ierīkota tā, ka to ir iespējams pārvietot gar minētajiem pacēlumiem (27), pie tam minētā bremsējošā plāksne ir piestiprināta dažādos attālos no izvadīšanas atveres (14).

2. Ierīce (1) atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt vismaz viena minētā vadotne ir skrūve/gliemežpārvads (17), kas attiecībā pret konteineru (3) ir nekustīgs.

3. Ierīce (1) atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt minētos pacēlumus (27) veido longitūdinālajā virzienā stiepjošās sliedes.

4. Ierīce (1) atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt konteiners (3) ir izgatavots ar krokām, kuras veido minētos pacēlumus (27) konteiners (3) iekšējās sienas virsmā (16).

5. Ierīce (1) atbilstoši 4. pretenzijai, turklāt: bremsējošajai plāksnei (19) ir puse, kas vērsta prom no izvadīšanas atveres; pusē, kas vērsta prom no izvadīšanas atveres (14), bremsējošā plāksne (19) ir aprīkota ar radiālu vadotni (23), kurai ir pagarinājums konteiners (3) longitūdinālajai asij perpendikulārā virzienā, pie tam minētais pagarinājums šķēļ konteiners longitūdinālo asi un vislabāk ir, ka radiālā vadotne (23) visā garumā stiepjas vismaz līdz vienam no minētajiem pacēlumiem.

6. Ierīce (1) atbilstoši jebkurai no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt minētie pacēlumi (27) ir izveidoti tā, ka radiāli iekšup, virzienā uz konteiners (3) longitūdinālo asi, attālums starp diviem blakusesošiem pacēlumiem ir konstants vai pieaugošs.

7. Ierīce (1) atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt longitūdinālie pacēlumi (27) stiepjas līdz apmalei (18) tā, ka tie veido atdalošās sienas atsevišķos nodalījumus (21).

8. Ierīce (1) atbilstoši jebkurai no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt tā ir aprīkota ar svēršanas ierīci (100), lai noteiktu granulētā pārtikas produkta (2) svaru konteinerā (3), pie tam svēršanas ierīce (100), vēlams, ir savienota ar vadības un/vai monitoringa ierīci (200), tādu kā dators.

9. Ierīce (1) atbilstoši jebkurai no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt ierīce (1) satur motoru (6), kas ir ierīkots, lai izraisītu konteiners (3) griešanos, un slēdzi (12), kas ir savienots ar motoru (6) tādā veidā, ka motoru (6) ar slēdzi (12) var palaist, turklāt ierīce papildus satur sensoru (400), kas ir ierīkots, lai noteiktu, vai ir apmierināts specifisks nosacījums, turklāt sensors (400) ir savienots ar motoru (6) tā, ka motoru (6) ar slēdzi nevar palaist, kamēr sensors nav izdevis signālu, kas norāda, ka minētais specifiskais nosacījums ir izpildīts.

10. Ierīce (1) atbilstoši 9. pretenzijai, turklāt sensors (400) ir ierīkots, lai noteiktu, vai tvertne (350) granulētajam pārtikas produktam ir novietota pozīcijā zem izvadīšanas atveres (14) tā, ka motoru (6) nevar palaist, kamēr sensors (400) vispirms nav izdevis signālu, kas rāda, ka tvertne (350) ir novietota pozīcijā zem izvadīšanas atveres (14).

11. Ieliktnis, kas ir izveidots kā konteiners (3) ievietošanai ierīces (1) granulēta pārtikas produkta (2) izvadīšanai saskaņā ar 1. pretenziju turētājā vai pamatnē (9), turklāt ieliktnis satur garenu konteineru (3), kas vismaz daļēji ir piepildīts ar granulētu pārtikas

produktu (2) un stiepjas no pirmā gala līdz otrajam galam gar longitūdinālo asi, turklāt: konteineram ir iekšējās sienas virsma (16), kurā ir ierīkoti garenski pacēlumi (27), kuri veido vadotnes; zināmā attālumā no konteiners otrā gala ir ierīkota bremsējošā plāksne (19), kas savienojas vismaz ar dažiem no minētajiem longitūdinālajiem pacēlumiem (27) tādā veidā, ka granulētais pārtikas produkts (2) var paiet garām bremsējošajai plāksnei (19) zonā starp bremsējošo plāksni (19) un konteiners (3) iekšējās sienas virsmu (16).

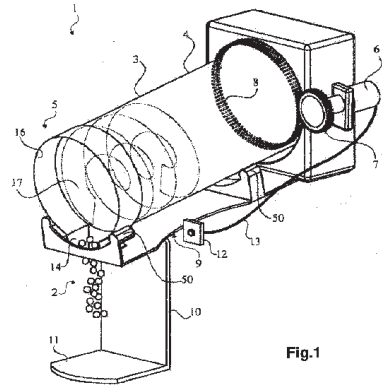


Fig.1

- (51) **B66B 11/02**^(2006.01) (11) **2496509**
 (21) 10771765.4 (22) 03.11.2010
 (43) 12.09.2012
 (45) 27.01.2016
 (31) 102009053249 (32) 06.11.2009 (33) DE
 (86) PCT/EP2010/066667 03.11.2010
 (87) WO2011/054833 12.05.2011
 (73) Wobben Properties GmbH, Borsigstrasse 26, 26607 Aurich, DE
 (72) MEYER, Hermann, DE
 NEUNDLINGER, Ulrich, DE
 (74) Eisenführ, Speiser & Partner, Postfach 10 60 78, 28060 Bremen, DE
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(54) **LIFTS ELEVATOR**

(57) 1. Lifts, kuram ir lifta kabīne un piedziņas modulis, kas ir raksturīgs ar skapi, kas tiek izmantots kā lifta kabīne, un ar noturēšanas elementiem (30), kas būtībā horizontāli ir ierīkoti lifta kabīnes (10) augšpusē pretējās pusēs, un ar piedziņas moduļa nesējiem (32), kas pie tā ir piemontēti tā, ka stiepjas būtībā vertikāli, turklāt nesēji (32) atbrīvojamā veidā var tikt pievienoti pie noturēšanas elementiem (30) un var tikt pārvietoti vertikāli, kā arī raksturīga ar pirmo pozīciju, kurā nesēji (32) var tikt pievienoti pie noturēšanas elementiem (30), un otru pozīciju, kura ir nobīdīta vertikāli par iepriekšnoteiktu lielumu un kurā nesēji (32) arī var tikt pievienoti pie noturēšanas elementiem (30).

2. Lifts atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīgs ar atbrīvojamu savienojumu starp lifta kabīni un piedziņas moduli.

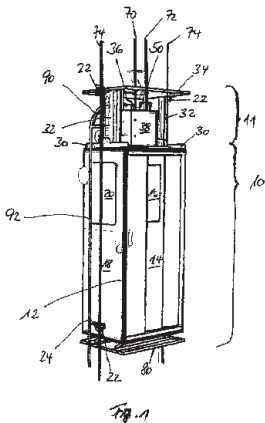
3. Lifts atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar piedziņas moduli, kam ir nepārtrauktas darbības vinča.

4. Lifts atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka ir aprīkots ar piedziņas moduļa pilnīgas vadības sistēmu.

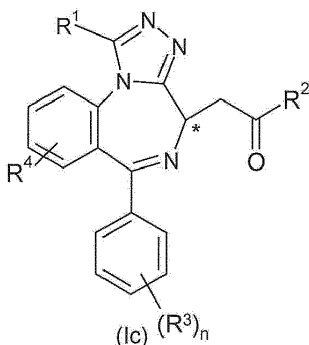
5. Lifts atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar apkalpošanas elementu, kas ir pievienots pie vadības sistēmas un kas iestiepjas lifta kabīnē.

6. Slēdžu skapja izmantošana par 1. pretenzijai atbilstoša lifta kabīni un/vai slēdžu skapja korpusa izmantošana par 1. pretenzijai atbilstoša lifta kabīnes korpusu.

7. Vējturbīna ar jebkurai no 1. līdz 5. pretenzijai atbilstošu liftu.



- (51) **C07D 487/04**^(2006.01) (11) **2496582**
A61K 31/55^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
A61P 43/00^(2006.01)
- (21) 10773325.5 (22) 03.11.2010
(43) 12.09.2012
(45) 27.01.2016
- (31) 0919433 (32) 05.11.2009 (33) GB
201010509 22.06.2010 GB
PCT/EP2010/061518 06.08.2010 WO
201014231 25.08.2010 GB
(86) PCT/EP2010/066697 03.11.2010
(87) WO2011/054845 12.05.2011
- (73) GlaxoSmithKline LLC, Corporation Service Company,
2711 Centreville Road, Suite 400, Wilmington, Delaware
19808, US
- (72) BAILEY, James, GB
GOSMINI, Romain, Luc, Marie, FR
MIRGUET, Olivier, FR
WITHERINGTON, Jason, GB
- (74) Shore, Andrew David, GlaxoSmithKline, Corporate Intellectual
Property (CN 925.1), 980 Great West Road, Brentford,
Middlesex TW8 9GS, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma
aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **BENZODIAZEPĪNA BROMODOMĒNA INHIBITORS**
BENZODIAZEPINE BROMODOMAIN INHIBITOR
- (57) 1. Savienojums ar formulu (1c) vai tā farmaceutiski pieņē-
mams sāls:

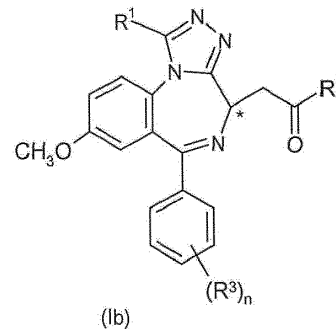


kurā:
R¹ ir C₁₋₃ alkilgrupa;
R² ir -NR^{2a}R^{2a'} vai -OR^{2b};
kurā viens no R^{2a} vai R^{2a'} ir H, bet R^{2b} vai otrs no R^{2a} vai R^{2a'} ir
izvēlēts no C₁₋₆ alkilgrupas, halogēnC₁₋₆ alkilgrupas, R^{2c}R^{2c'}N-C₁₋₆ alkil-
grupas, karbociklilgrupas, karbociklilC₁₋₄ alkilgrupas, heterociklil-
grupas un heterociklilC₁₋₄ alkilgrupas,
kurā katra karbociklilgrupa vai heterociklilgrupa neobligāti ir aiz-
vietota ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna
atoma, C₁₋₆ alkilgrupas, halogēnC₁₋₆ alkilgrupas, C₁₋₆ alkoksigrupas,
halogēnC₁₋₆ alkoksigrupas, karbonilgrupas, -CO-karbociklilgrupas,
azidogrupas, nitrogrupas un ciāngrupas,

kur -CO-karbociklilgrupa var būt papildus neobligāti aizvietota ar
vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma,
C₁₋₆ alkilgrupas, halogēnC₁₋₆ alkilgrupas, C₁₋₆ alkoksigrupas, halo-
gēnC₁₋₆ alkoksigrupas, azidogrupas, nitrogrupas un ciāngrupas;
vai divas blakus esošas grupas, kuras ir izvēlētas no karbociklil-
grupas vai heterociklilgrupas, kopā ar savienojošiem atomiem
veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, turklāt gredzens var saturēt 1 vai
2 heteroatomus, kuri neatkarīgi ir izvēlēti no O, S un N;
vai R^{2a} un R^{2a'} kopā ar N-atomu, pie kura tie ir pievienoti, veido 5-
6- vai 7-locekļu gredzenu, kas neobligāti satur 1 vai 2 heteroatomus,
kas neatkarīgi ir izvēlēti no O, S un N; kur 5-, 6- vai 7-locekļu
gredzens var būt neobligāti papildus aizvietots ar C₁₋₆ alkilgrupu;
R^{2c} un R^{2c'} neatkarīgi ir H un C₁₋₆ alkilgrupa;
katrs R³ neatkarīgi ir izvēlēts no H, hidroksilgrupas, halogēna
atoma, C₁₋₆ alkilgrupas, halogēnC₁₋₆ alkilgrupas, C₁₋₆ alkoksigrupas,
halogēnC₁₋₆ alkoksigrupas, nitrogrupas, ciāngrupas, CF₃, -OCF₃
un -COOR⁵;
R⁴ ir hidroksilgrupa, halogēna atoms, C₁₋₆ alkilgrupa, halogēnC₁₋₆ alkil-
grupa, C₁₋₆ alkoksigrupa, halogēnC₁₋₆ alkoksigrupa, nitrogrupa, ciān-
grupa, CF₃, -OCF₃, -COOR⁵ vai -OS(O)₂C₁₋₄ alkilgrupa;
R⁵ ir C₁₋₃ alkilgrupa; un
n ir vesels skaitlis no 1 līdz 5, izmantošanai vēža ārstēšanā.

2. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izman-
tošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R⁴ ir hidroksilgrupa vai
C₁₋₆ alkoksigrupa.

3. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmanto-
šanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ir ar formulu (1b):



kurā:
R¹, R², R³ un n ir saskaņā ar 1. pretenziju.

4. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izman-
tošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā R¹ ir
metilgrupa.

5. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izman-
tošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur n ir 1.

6. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izman-
tošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā R³ ir
3-fluorgrupa, 4-hlorgrupa, 4-fluorgrupa, 4-metoksigrupa vai 4-CF₃.

7. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kas ir
S-enantiomērs, izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pre-
tenzijai.

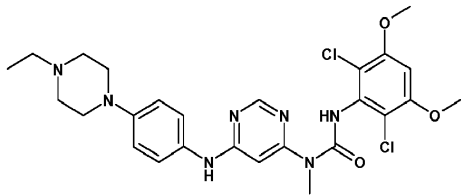
8. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmanto-
šanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt vēzis ir
izvēlēts no hematoloģiskajiem, epiteliālajiem audzējiem, tai skaitā
plaušu, krūts un resnās zarnas karcinomas, mezenhimāliem, aknu,
nieru un smadzeņu audzējiem.

9. Savienojuma vai tā farmaceutiski pieņemama sāls saska-
ņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošana medikamenta
ražošanā vēža ārstēšanai.

10. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formu-
lu (1c) vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no
1. līdz 7. pretenzijai un vienu vai vairākus farmaceutiski pieņemamus
nesējus, šķīdinātājus vai palīgvielas, izmantošanai vēža ārstēšanā.

- (51) **C07D 239/48**^(2006.01) (11) **2509963**
A61K 31/506^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
- (21) 10788479.3 (22) 06.12.2010
(43) 17.10.2012
(45) 25.11.2015

- (31) 267155 P (32) 07.12.2009 (33) US
 (86) PCT/US2010/059108 06.12.2010
 (87) WO2011/071821 16.06.2011
 (73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
 (72) BERGHAUSEN, Joerg, CH
 KAPA, Prasad, Koteswara, US
 MCKENNA, Joseph, US
 SLADE, Joel, US
 WU, Raeann, US
 DU, Zhengming, US
 STOWASSER, Frank, CH
 (74) Pfister-Fu, Yixin, et al, Novartis Pharma AG, Patent Department, 4002 Basel, CH
 Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
 (54) **3-(2,6-DIHLOR-3,5-DIMETOKSI-FENIL)-1-6-[4-(4-ETIL-PIPERAZIN-1-IL)-FENILAMINO]-PIRIMIDIN-4-IL-1-METIL-URĪNVIELAS UN TĀS SĀĻU KRISTĀLISKĀS FORMAS CRYSTALLINE FORMS OF 3-(2,6-DICHLORO-3,5-DIMETHOXY-PHENYL)-1-6-[4-(4-ETHYL-PIPERAZIN-1-YL)-PHENYLAMINO]-PYRIMIDIN-4-YL-1-METHYL-UREA AND SALTS THEREOF.**
 (57) 1. Savienojuma ar formulu I:



I

monofosforskābes sāls.

2. Monofosforskābes sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir bezūdens, kristālisks monofosforskābes sāls.

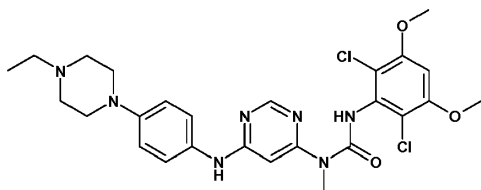
3. Bezūdens, kristālisks monofosforskābes sāls saskaņā ar 2. pretenziju ar formu A, kur formai A ir pulvera rentgendifrakcijas spektrs (XRPD), kas ietver raksturīgo maksimumu pie $15 \pm 0,4^\circ$, 2θ izteiksmēs, kur vai nu izmantojot *Bruker D8 Advance* instrumentu, iradiācijas parametri: Cu K α pie 30 kV, 40 mA, mainīgā sprauga V12 mm, skenēšanas diapazons $2-40^\circ$ (2 tēta vērtība), skenēšanas ātrums 0,3 sek. solī,

vai izmantojot *Scintag* instrumentu XDS2000, iradiācijas parametri: Cu K α pie 45 kV, 40 mA, novirzes segments 3 mm un 2 mm, mērīšanas segments: 0,3 mm un 0,2 mm, vibropārveidotājs 0,02 grd, skenēšanas laiks: 6 minūtes ar 3 minūtēm uz kadru, skenēšanas diapazons: $2-35^\circ$ vai 40° (2 tēta vērtība) un skenēšanas ātrums $0,5^\circ/\text{min}$. (2 tēta vērtība), XRPD var izmantot.

4. Bezūdens, kristālisks monofosforskābes sāls forma A saskaņā ar 3. pretenziju, kur pulvera rentgendifrakcijas spektrs papildus satur vienu vai vairākus raksturīgus maksimumus 2θ izteiksmēs, kas izvēlēti no maksimumiem pie $13,7 \pm 0,4^\circ$, $16,8 \pm 0,4^\circ$, $21,3 \pm 0,4^\circ$ un $22,4 \pm 0,4^\circ$.

5. Bezūdens, kristālisks monofosforskābes sāls forma A saskaņā ar 4. pretenziju, kur pulvera rentgendifrakcijas spektrs papildus satur vienu vai vairākus raksturīgus maksimumus 2θ izteiksmēs, kas izvēlēti no maksimumiem pie $9,2 \pm 0,4^\circ$, $9,6 \pm 0,4^\circ$, $18,7 \pm 0,4^\circ$, $20,0 \pm 0,4^\circ$, $22,9 \pm 0,4^\circ$ un $27,2 \pm 0,4^\circ$.

6. Bezūdens, kristālisks forma, kas nosaukta par formu A saskaņā ar 4. pretenziju, savienojuma monofosforskābes sālim ar formulu I:



I

kur bezūdens, kristālisks formai A ir pulvera rentgendifrakcijas spektrs (XRPD), kas ietver vismaz 3 raksturīgus maksimumus 2θ izteiksmēs, kas izvēlēti no maksimumiem pie $13,7^\circ$, 15° , $16,8^\circ$, $21,3^\circ$ un $22,4^\circ$; turklāt, neatkarīgi no 2θ vērtībām, tādās vērtības raksturīgiem maksimumiem var mainīties par $\pm 0,4^\circ$, kur vai nu izmantojot *Bruker D8 Advance* instrumentu, iradiācijas parametri: Cu K α pie 30 kV, 40 mA, mainīgā sprauga V12 mm, skenēšanas diapazons $2-40^\circ$ (2 tēta vērtība), skenēšanas ātrums 0,3 sek. solī,

vai izmantojot *Scintag* instrumentu XDS2000, iradiācijas parametri: Cu K α pie 45 kV, 40 mA, novirzes segments 3 mm un 2 mm, mērīšanas segments: 0,3 mm un 0,2 mm, vibropārveidotājs 0,02 grd, skenēšanas laiks: 6 minūtes ar 3 minūtēm uz kadru, skenēšanas diapazons: $2-35^\circ$ vai 40° (2 tēta vērtība) un skenēšanas ātrums $0,5^\circ/\text{min}$. (2 tēta vērtība) XRPD var izmantot.

7. Bezūdens, kristālisks forma saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 6. pretenzijai ar pulvera rentgendifrakcijas spektru, kā parādīts zīmējumā 1B.

8. Bezūdens, kristālisks forma saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 6. pretenzijai ar diferenciālās skenēšanas kalorimetrijas (DSK) termogrammu, kas parāda endoterma sākumu pie $184 \pm 2^\circ\text{C}$; turklāt var izmantot DSK TA instrumentam Q1000 temperatūras diapazons: istabas temperatūra līdz 210°C , skenēšanas ātrums: $10^\circ\text{C}/\text{min}$ un slāpekļa plūsma: 60 ml/min.

9. Bezūdens, kristālisks forma saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 6. pretenzijai ar diferenciālās skenēšanas kalorimetrijas (DSK) termogrammu, kā parādīts zīmējumā 2B; turklāt var izmantot DSK TA instrumentam Q1000, temperatūras diapazons: istabas temperatūra līdz 210°C , skenēšanas ātrums: $10^\circ\text{C}/\text{min}$ un slāpekļa plūsma: 60 ml/min.

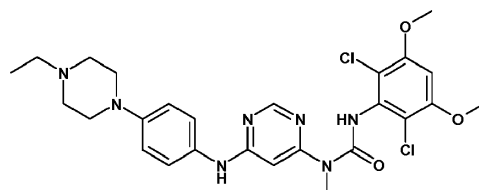
10. Bezūdens kristālisks monofosforskābes sāls saskaņā ar 2. pretenziju ar formu B, turklāt formai B ir pulvera rentgendifrakcijas spektrs, kas satur vienu vai vairākus raksturīgus maksimumus 2θ izteiksmēs, kas izvēlēti no maksimumiem pie $9,3 \pm 0,4^\circ$, $12,5 \pm 0,4^\circ$, $13,4 \pm 0,4^\circ$, $15,8 \pm 0,4^\circ$ un $17 \pm 0,4^\circ$;

turklāt vai nu izmantojot *Bruker D8 Advance* instrumentu, iradiācijas parametri: Cu K α pie 30 kV, 40 mA, mainīgā sprauga V12 mm, skenēšanas diapazons $2-40^\circ$ (2 tēta vērtība), skenēšanas ātrums 0,3 sek. solī,

vai izmantojot *Scintag* instrumentu XDS2000, iradiācijas parametri: Cu K α pie 45 kV, 40 mA, novirzes segments 3 mm un 2 mm, mērīšanas segments: 0,3 un 0,2 mm, vibropārveidotājs 0,02 grd, skenēšanas laiks: 6 minūtes ar 3 minūtēm uz kadru, skenēšanas diapazons: $2-35^\circ$ vai 40° (2 tēta vērtība) un skenēšanas ātrums $0,5^\circ/\text{min}$ (2 tēta vērtība) XRPD.

11. Bezūdens, kristālisks forma saskaņā ar 10. pretenziju ar pulvera rentgendifrakcijas spektru, kā parādīts zīmējumā 1C.

12. Paņēmiens, lai gatavotu bezūdens, kristālisks formu A saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai, kas ietver savienojuma ar formulu I suspensijas:



I

kontaktēšanu ar fosforskābi, lai iegūtu bezūdens, kristālisks formu A.

13. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kas papildus ietver bezūdens kristālisks formas A kristalizēšanu no suspensijas.

14. Paņēmiens saskaņā ar 13. pretenziju, kur savienojuma ar formulu I suspensija satur izopropanolu.

15. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kas papildus ietver kristalizētās bezūdens, kristālisks formas A izdalīšanu.

16. Kompozīcija, kas satur kristālisks formu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju, palīgvielu vai šķīdinātāju.

17. Kristālisks forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai kompozīcija saskaņā ar 16. pretenziju izmantošanai ārstēšanas paņēmienā, kas ietver kristālisks formas vai amorfs

formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai kompozīcijas saskaņā ar 16. pretenziju terapeitiski iedarbīga daudzuma ievadīšanu subjektam, kas cieš no slimības, patoloģijas un/vai simptomiem, no kuriem slimību var novērst, kavēt vai uzlabot ar kināzes aktivitātes inhibēšanu, turklāt kināze ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no FGFR1, FGFR2, FGFR3, FGFR4, KDR, HER1, HER2, Bcr-Ab1, Tie2 un Ret, kur slimība ir izvēlēta no nieru, aknu, virsnieru dziedera, urīnpūšļa, krūts dziedera, kuņģa, olnīcu, resnās zarnas, taisnās zarnas, prostatas, aizkuņģa dziedera, plaušu, maksts vai vairogdziedzera karcinomas; sarkomas; glioblastomas; leukēmijas; kakla vai galvas audzējiem; psoriāzes; prostatas hiperplāzijas; vai neoplāzijas.

- (51) **A61K 39/085**^(2006.01) (11) **2510947**
C07K 14/31^(2006.01)
A61K 39/00^(2006.01)
- (21) 12175868.4 (22) 14.04.2010
(43) 17.10.2012
(45) 10.02.2016
- (31) 212705 P (32) 14.04.2009 (33) US
234079 P 14.08.2009 US
- (62) EP10723299.3 / EP2419129
(73) GlaxoSmithKline Biologicals SA, Rue de l'Institut 89, 1330 Rixensart, BE
- (72) BAGNOLI, Fabio, IT
BIAGINI, Massimiliano, IT
FIASCHI, Luigi, IT
GRANDI, Guido, IT
MISHRA, Ravi, IT
NORAIS, Nathalie, IT
SCARSELLI, Maria, IT
- (74) Sampson, Catherine, et al, GlaxoSmithKline S.A., Global Patents CN925.1, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **KOMPOZĪCIJAS IMUNIZĀCIJAI PRET ZELTAINO STAFILOKOKU**
COMPOSITIONS FOR IMMUNISING AGAINST STAPHYLOCOCCUS AUREUS

(57) 1. Vācīna, kas satur sta006 antigēnu izmantošanai pāņemienā zīdītāja aizsardzībai pret *S.aureus* infekciju, kurā sta006 antigēns satur aminoskābes sekvenci: (i) (a) kas par 70 % vai vairāk ir identiska SEQ ID NO: 42; un/vai (b) satur SEQ ID NO: 42 vismaz 'n' secīgu aminoskābes fragmentu, kurā 'n' ir 7 vai vairāk; un (ii) kurā sta006 antigēns var noteikt antivielu, kas atpazīst SEQ ID NO: 42.

2. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur palīgvielu.

3. Vācīna, kas satur sta006 antigēnu un palīgvielu, kurā sta006 antigēns satur aminoskābes sekvenci: (i) (a) kas par 70 % vai vairāk ir identiska SEQ ID NO: 42; un/vai (b) satur SEQ ID NO: 42 vismaz 'n' secīgu aminoskābes fragmentu, kurā 'n' ir 7 vai vairāk; un (ii) kurā sta006 antigēns var noteikt antivielu, kas atpazīst SEQ ID NO: 42.

4. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām, kurā sta006 antigēns satur aminoskābju sekvenci, kas par 80 %, 90 % vai vairāk ir identiska SEQ ID NO: 42.

5. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām, kurā sta006 antigēns satur aminoskābju sekvenci, kas par 90 % vai vairāk ir identiska SEQ ID NO: 246.

6. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām, kurā sta006 antigēns satur aminoskābes sekvenci, kas par 99 % vai vairāk ir identiska SEQ ID NO: 248.

7. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām, kurā palīgviela ir alumīnija hidroksīds.

8. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās

atkarīgām pretenzijām, kur vācīna ietver histidīna buferi vai fosfāta šķīdumu.

9. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām, kas papildus satur vienu vai vairākus *S.aureus* eksopolisaharīda konjugātus un nesējproteīnu.

10. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1., 2., no 4. līdz 8. pretenzijai vai saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 8. pretenzijai, kas papildus satur vienu vai vairākus *S.aureus* kapsulāra polisaharīda konjugātus un nesējproteīnu.

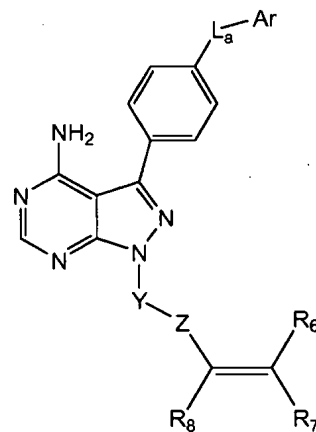
11. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām liofilizētā veidā.

12. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1., 2., no 4. līdz 10. pretenzijai vai saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 10. pretenzijai ūdeni saturošā veidā.

13. Paņēmiens vācīnas saskaņā ar 12. pretenziju iegūšanai, izšķīdinot vācīnu saskaņā ar 11. pretenziju ar ūdeni saturošā šķīdumā.

14. Vācīna izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām vai saskaņā ar 3. pretenziju un no tās atkarīgām pretenzijām, kas papildus satur farmaceitisku nesēju un/vai palīgvielu.

- (51) **A61K 31/00**^(2006.01) (11) **2526934**
A61K 31/519^(2006.01)
A61K 45/06^(2006.01)
C07D 487/04^(2006.01)
A61P 35/02^(2006.01)
- (21) 12166305.8 (22) 28.12.2006
(43) 28.11.2012
(45) 09.12.2015
- (31) 826720 P (32) 22.09.2006 (33) US
828590 P 06.10.2006 US
- (62) EP06850039.6 / EP2081435
(73) Pharmacyclics LLC, 995 East Arques Avenue, Sunnyvale, CA 94085, US
- (72) HONINGBERG, Lee, US
VERNER, Erik, US
PAN, Zhengying, US
MODY, Tarak, US
- (74) Wilkinson, Marc George, Avidity IP, Kestrel House, Falconry Court, Baker's Lane, Epping, Essex CM16 5DQ, GB
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **BRUTONA TIROZĪNKINĀZES INHIBITORI**
INHIBITORS OF BRUTON'S TYROSINE KINASE
- (57) 1. Neatgriezenisks Btk inhibitors izmantošanai hroniskas limfocītiskas leukēmijas ārstēšanā, kas atbilst formulai D:



Formula (D),

kur:

L_a ir CH_2 , O, NH vai S;

Ar ir aizvietota vai neaizvietota arilgrupa, aizvietota vai neaizvietota heteroarilgrupa;

Y ir neobligāti aizvietota grupa, kas izvēlēta no alkilgrupas, heteroalkilgrupas, cikloalkilgrupas, heterocikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas;

Z ir C(=O), OC(=O), NHC(=O), C(=S), S(=O)_x, OS(=O)_x vai NHS(=O)_x, kur x ir 1 vai 2;

R₇ un R₈ tiek neatkarīgi izvēlēti no H, neaizvietotām (C₁-C₄)alkilgrupas, aizvietotām (C₁-C₄)alkilgrupas, neaizvietotām (C₁-C₄)heteroalkilgrupas, aizvietotām (C₁-C₄)heteroalkilgrupas, neaizvietotām (C₃-C₆)cikloalkilgrupas, aizvietotām (C₃-C₆)cikloalkilgrupas, neaizvietotām (C₂-C₆)heterocikloalkilgrupas un aizvietotām (C₂-C₆)heterocikloalkilgrupas; vai

R₇ un R₈ kopā veido saiti;

R₆ ir H, aizvietota vai neaizvietota (C₁-C₄)alkilgrupa, aizvietota vai neaizvietota (C₁-C₄)heteroalkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksialkilgrupa, (C₁-C₆)alkilaminoalkilgrupa, aizvietota vai neaizvietota (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, aizvietota vai neaizvietota arilgrupa, aizvietota vai neaizvietota (C₂-C₆)heterocikloalkilgrupa, aizvietota vai neaizvietota heteroarilgrupa, (C₁-C₄)alkil(aril)grupa, (C₁-C₄)alkil(heteroaril)grupa, (C₁-C₄)alkil((C₃-C₆)cikloalkil)grupa vai (C₁-C₄)alkil((C₂-C₆)heterocikloalkil)grupa; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt L₃ ir O.

3. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt Ar ir fenilgrupa.

4. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt Z ir CO, NHC(O) vai SO₂.

5. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 1-((R)-3-(4-amino-3-(4-fenoksifenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidin-1-il)prop-2-ēn-1-ons vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

6. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir kombinēts ar otru terapeitisku līdzekli.

7. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām perorālai ievadīšanai.

8. Neatgriezenisks Btk inhibitors saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām kopā ar papildu pretvēža līdzekli.

9. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai hroniskas limfocītiskas leukēmijas ārstēšanā, kas satur neatgriezenisku Btk inhibitoru, kā noteikts iepriekš jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai.

- | | |
|--|-------------------------|
| (51) B08B 9/00 ^(2006.01) | (11) 2539086 |
| F02M 35/10 ^(2006.01) | |
| F02M 25/00 ^(2006.01) | |
| (21) 11747818.0 | (22) 25.02.2011 |
| (43) 02.01.2013 | |
| (45) 24.02.2016 | |
| (31) 660433 | (32) 26.02.2010 (33) US |
| (86) PCT/US2011/000346 | 25.02.2011 |
| (87) WO2011/106097 | 01.09.2011 |
| (73) Auto-Mark, Inc., 12987 Pioneer Trail, Eden Prairie, MN 55347, US | |
| (72) HANSON, Matthew, N., US | |
| FANDREI, Philip, F., US | |
| (74) Hallybone, Huw George, et al, Carpmals & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB | |
| Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV | |

(54) **VIRZĪTĀJKANĀLA VADOTNES BALSTS**
DIRECTIONAL CONDUIT GUIDE SUPPORT

(57) 1. Piegādes sistēma (50) pulverizēta apstrādes līdzekļa (52) padevei noslēgtās mehāniskās sistēmas iekšienē, kam ir pseidoviršanu izraisošās gāzes ieplūdes apcilnis (64), kas ir savienots ar to apņemošu gāzes padeves cauruli (28) caur ID/OD savienojumu, kur ID ir iekšējais diametrs (*Inside Diameter*), bet OD ir ārējais diametrs (*Outside Diameter*), lai uzņemtu gāzes plūsmu caur gāzes padeves cauruli (28) noslēgtajā mehāniskajā sistēmā longitudinālā virzienā, turklāt minētā sistēma satur:

(a) zem spiediena esošu konteineru (54), kas satur pulverizētu apstrādes līdzekli (52) iekšējās virsmas vai darba detaļu, kas

atrodas noslēgtajā mehāniskajā sistēmā, apstrādei;

(b) elastīgu cauruļvadu (70) pulverizētā apstrādes līdzekļa (52) piegādei no konteineru (54) uz noslēgto mehānisko sistēmu, turklāt:

(c) pulverizētais apstrādes līdzeklis (52) tiek padots caur cauruļvadu (70) no zem spiediena esošā konteineru (54) uz noslēgtās mehāniskās sistēmas iekšējo daļu;

turklāt piegādes sistēma ir raksturīga ar:

(d) elastīgajam cauruļvadam (70) paredzētu vadotnes balstu (82), kas satur:

(i) izliektu korpusu (84) tā vienā galā,

(ii) āķveida korpusu (88) tā otrajā galā,

(iii) kanālu (94), kas izvietots iekšējās virsmas iekšpusē visa vadotnes balsta (82) garumā tādā veidā, ka kanāla (94) izmēri ir konfigurēti, lai apņemtu elastīgā cauruļvada (70) ārējos izmērus, turklāt:

(iv) vadotnes balsta (82) izliektais korpusu (84) ir izvietots starp noslēgtās mehāniskās sistēmas pseidoviršanu izraisošās gāzes ieplūdes apcilni (64) un gāzes padeves cauruli (28) ar āķveida korpusu (88), izraisot elastīgā cauruļvada (70) izplešanos noslēgtajā mehāniskajā sistēmā, tā distālo galu vēršot tajā pašā virzienā, kurā ir vērsta pseidoviršanu izraisošās gāzes plūsma,

(e) elastīgais cauruļvads (70) ir izvietots vadotnes balsta (82) kanāla iekšpusē tā, ka vadotnes balsts (82) aizsargā cauruļvadu (70) no pārliekas izliekšanās.

2. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt noslēgtā mehāniskā sistēma ir iekšdedzes dzinējs.

3. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt noslēgtā mehāniskā sistēma ir mehānisma vai aprīkojuma daļa.

4. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt noslēgtā mehāniskā sistēma ir gaisa piespiedu apsildes, ventilācijas vai gaisa kondicionēšanas kanāls.

5. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis ir tīrīšanas līdzeklis.

6. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis ir smērviela.

7. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis ir pretpelējuma un pretsenīšu līdzeklis.

8. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis ir kondensāta vai mitruma novēršanas līdzeklis.

9. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis ir gaisa atsvaidzinātājs vai smarža.

10. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis tiek padots caur cauruļvadu kā aerosols.

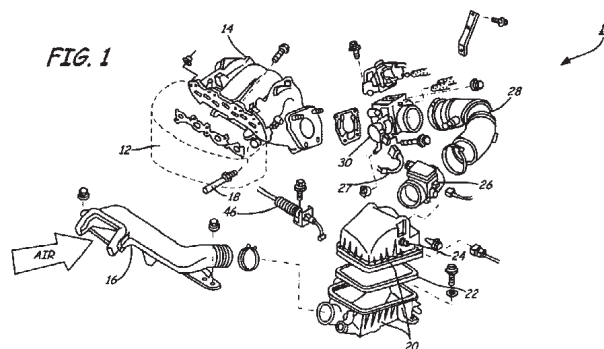
11. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pulverizētais apstrādes līdzeklis tiek padots caur cauruļvadu ar saspīestas gāzes palīdzību.

12. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pseidoviršanu izraisošā gāze ir gaiss.

13. Piegādes sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pseidoviršanu izraisošā gāze ir industriālā gāze.

14. Piegādes sistēma saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt tīrīšanas līdzeklis tiek padots iekšdedzes dzinēja akseleratora korpusā, lai šķīdinātu uz dzinēja iekšējās virsmas vai darba detaļas esošos nevēlamos nosēdumus.

15. Piegādes sistēma saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt smērviela tiek padota iekšdedzes dzinēja akseleratora korpusā, lai eļļotu dzinējā esošo darba detaļu.



- (51) **A61N 5/06**^(2006.01) (11) **2545962**
 (21) 12188421.7 (22) 16.12.2009
 (43) 16.01.2013
 (45) 14.10.2015
 (31) 0900461 (32) 12.01.2009 (33) GB
 0916666 22.09.2009 GB
 (62) EP09801405.3 / EP2382009
 (73) Photocure ASA, Hoffsvæien 4, 0275 Oslo, NO
 (72) KLEM, Bjørn, NO
 GROSETH, Morten, NO
 (74) Taylor, Adam David, Dehns, St Bride's House, 10 Salisbury Square, London EC4Y 8JD, GB
 Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
 (54) **APSTAROŠANAS IERĪCE
 IRRADIATION DEVICE**

(57) 1. Apstarošanas ierīce ievietošanai pacienta (cilvēka) ķermeņa atverē fotodinamiskās terapijas nodrošināšanai, turklāt šī atvere ir sievītes reproduktīvais trakts vai taisnā zarna, ierīce sastāv no: korpusa (1, 21, 31, 51, 61, 71), kas ir pielāgots pilnīgai ievietošanai un nostiprināšanai atverē, korpusam (1, 21, 31, 51, 61, 71) pievienotas LED lampu sistēmas (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72) un barošanas avots (41, 68, 78) enerģijas padevei LED lampu sistēmai (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72), un korpusa (1, 21, 31, 51, 61, 71), kas sastāv no apstrādes virsmas (2, 22, 32, 63, 73) ar LED sistēmu, kura ir piemērota, lai tad, kad ierīce darbojas, izstarotu gaismu no apstrādes virsmas (2, 22, 32, 63, 73), kurā apstrādes virsmai (2, 22, 32, 63, 73) vismaz daļēji spīd cauri minētā gaisma, un kur ierīce patstāvīgi darbojas, kamēr atrodas atverē; turklāt apstrādes virsmas izmēri un/vai forma ir pielāgota komplektārai uzstādīšanai apstrādes virsmas atverē tā, lai, kad ierīce darbojas, apstrādes virsma tiktu apgaismota ar minēto gaismu, kas raksturīga ar to, ka korpusam ir elastīga ārējā daļa, kuras formu var pielāgot, lai to droši uzstādītu uz atveres sienīņām, bet LED sistēma ir piemērota, lai izstarotu gaismu ar gaismas intensitāti diapazonā 1–50 mW/cm².

2. Ierīce, saskaņā ar 1. pretenziju, kurā caurspīdīgais materiāls tiek izmantots, lai veidotu gan korpusu (1, 21, 31, 51, 61, 71) ar pievienotu LED lampu sistēmu (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72), gan apstrādes virsmu (2, 22, 32, 63, 73) un materiāls darbojas kā izkliedētājs gaismai, kas izstarota no minētās LED lampu sistēmas (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72).

3. Ierīce, saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kurā LED lampu sistēma (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72) ir sakārtota tā, lai tad, kad ierīce darbojas, tā izstarotu gaismu ar gaismas intensitāti diapazonā no 1 līdz 10 mW/cm².

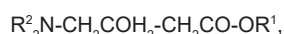
4. Ierīce, saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kurā LED lampu sistēma (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72) izstaro gaismu ar viļņu garumu diapazonā 300–800 nm, vēlams diapazonā 630–690 nm.

5. Ierīce, saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, papildus satur medikamentu nesējplātību, lai pārnestu kompozīciju, kas satur fotosensibilizatoru vai fotosensibilizatora prekursoru.

6. Ierīce, saskaņā ar 5. pretenziju, kurā minētā medikamentu nesējplātība ir apstrādes virsma (2, 22, 32, 63, 73).

7. Ierīce, saskaņā ar 5. un 6. pretenziju, pārnes kompozīciju medikamentu nesējplātībā, kurā kompozīcija satur 5-ALA vai 5-ALA derivātu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

8. Ierīce, saskaņā ar 7. pretenziju, kurā kompozīcija satur 5-ALA esteris vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, vēlams 5-ALA esteris, kas ir formulas (I) vai tā farmaceutiski pieņemama sāls savienojums:



kur

R¹ ir taisna ķēde C₁₋₆alkilgrupa un abi R² apzīmē ūdeņraža atomu.

9. Ierīce, saskaņā ar 8. pretenziju, kurā ALA-esteris ir 5-ALA heksilesteris vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

10. Ierīce, saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 9. pretenzijai, kurā minētā kompozīcija ir puscieta vai cieta kompozīcija.

11. Ierīce, saskaņā ar ikvienu no iepriekšminētajām pretenzijām, kurā ierīce ietver vienu vai vairākas iezīmes, kas veicina vienreizēju lietošanu un/vai novērš atkārtotu izmantošanu.

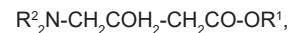
12. Ierīce, saskaņā ar ikvienu no iepriekšminētajām pretenzijām, kurā ierīces LED lampu sistēma (5, 25, 35, 45, 54, 62, 72)

ir sagatavota, lai nodrošinātu gaismas devu 10–200 J/cm².

13. Komplekts, kas ietver apstarošanas ierīci, kā apgalvots ikvienā no 1. līdz 6. pretenzijai un vismaz vienu kompozīciju, kas satur fotosensibilizatoru vai fotosensibilizatora prekursoru lietošanai ar ierīci.

14. Komplekts, saskaņā ar 13. pretenziju, kurā kompozīciju veido 5-ALA vai 5-ALA derivāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

15. Komplekts, saskaņā ar 14. pretenziju, kurā kompozīciju veido 5-ALA esteris vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, vēlams 5-ALA esteris, kas ir formulas (I) vai tā farmaceutiski pieņemama sāls savienojums:



kur

R¹ ir taisna ķēde C₁₋₆alkilgrupa un abi R² apzīmē ūdeņraža atomu.

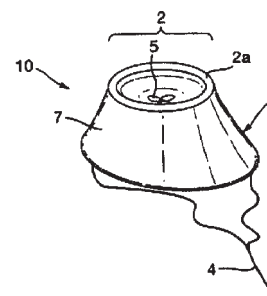
16. Komplekts, saskaņā ar 15. pretenziju, kurā kompozīciju veido ALA esteris, 5-ALA heksilesteris vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

17. Komplekts, saskaņā ar ikvienu no 13. līdz 16. pretenzijai, kurā minētā kompozīcija ir puscieta vai cieta kompozīcija.

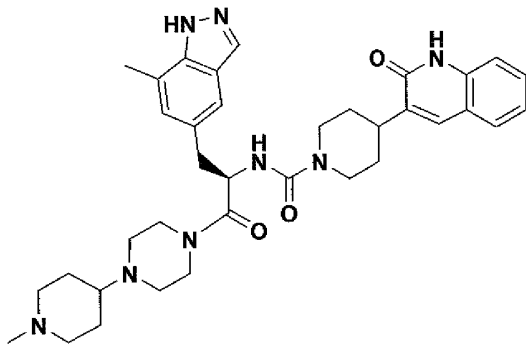
18. Komplekts, saskaņā ar ikvienu no 13. līdz 17. pretenzijai, izmantošanai maksts vai dzemdes kakla fotodinamiskajā terapijā.

19. Komplekts, saskaņā ar 18. pretenziju, izmantošanai dzemdes kakla fotodinamiskajā terapijā, vēlams izmantošanai dzemdes kakla vēža un dzemdes kakla slimību, bojājumu vai stāvokļa fotodinamiskajā terapijā.

Fig. 1A.



- (51) **C07D 401/14**^(2006.01) (11) **2552906**
A61K 31/496^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
 (21) 11710087.5 (22) 11.03.2011
 (43) 06.02.2013
 (45) 06.01.2016
 (31) 319015 P (32) 30.03.2010 (33) US
 (86) PCT/US2011/028168 11.03.2011
 (87) WO2011/123232 06.10.2011
 (73) Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US
 (72) CHATURVEDULA, Prasad V., US
 DUBOWCHIK, Gene M., US
 MACOR, John E., US
 (74) Reitstötter - Kinzebach, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **CGRP RECEPTORA ANTAGONISTS
 CGRP RECEPTOR ANTAGONIST**
 (57) 1. Savienojums (R)-N-(3-(7-metil-1H-indazol-5-il)-1-(4-(1-metilpiperidin-4-il)piperazin-1-il)-1-oksopropan-2-il)-4-(2-okso-1,2-dihidrohinolin-3-il)piperidin-1-karboksamīds vai tā farmaceutiski pieņemams sāls



2. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver (R)-N-(3-(7-metil-1H-indazol-5-il)-1-(4-(1-metilpiperidin-4-il)piperazin-1-il)-1-oksopropan-2-il)-4-(2-okso-1,2-dihidrohinalin-3-il)piperidin-1-karboksamīda terapeitiski efektīvu daudzumu kopā ar farmaceutiski pieņemamu palīgvielu, nesēju vai atšķaidītāju.
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai iekaisuma, sāpju, termiskas traumas, hipovolēmiskā šoka, diabēta, Reino sindroma, perifērās arteriālās nepietiekamības, subarahnoidālas/kraniālas asiņošanas, audzēja augšanas, ar menopauzi saistītu karstuma viļņu ārstēšanas metodē.
4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai migrēnas ārstēšanā.
5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai neiropātisku sāpju ārstēšanā.
6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai proliferatīvu slimību ārstēšanā.
7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kur proliferatīva slimība ir krūts vēzis vai glioma.

(51) F21K 99/00 ^(2016.01)	(11) 2553314
F21Y 111/00 ^(2016.01)	
(21) 11713180.5	(22) 25.03.2011
(43) 06.02.2013	
(45) 24.02.2016	
(31) 102010013286	(32) 29.03.2010 (33) DE
(86) PCT/EP2011/001510	25.03.2011
(87) WO2011/124331	13.10.2011
(73) Heraeus Noblelight GmbH, Heraeusstrasse 12-14, 63450 Hanau, DE	
(72) PEIL, Michael, DE OSWALD, Florin, DE MAIWEG, Harald, DE	
(74) Heraeus IP, Heraeus Holding GmbH, Schutzrechte, Heraeusstraße 12-14, 63450 Hanau, DE Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV	

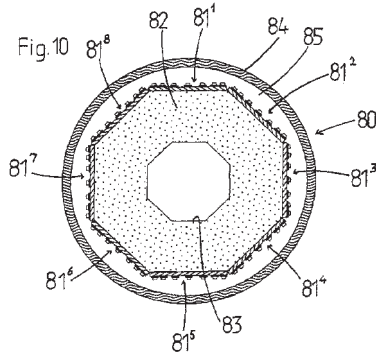
(54) **LED LAMPA HOMOĢĒNAI DOBU ĶĒRMĒŅU APĢAISMOŠANAI**
LED LAMP FOR HOMOGENEOUSLY ILLUMINATING HOLLOW BODIES

(57) 1. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") izliektu, neplakanu vai poligonālu virsmu homogēnai apgaismošanai, kas satur vairākus plakanus gaismu emitējošu diodu (LED) paneļa moduļus uz iespiestu mikroshēmu bāzes (*Chip-on-Board LED modules*, kas turpmāk visur tekstā saīsināti tiek saukti par *LED paneļa moduļiem*) (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸), kas ir izvietoti vismaz tā, ka to pāri atdodas cits citam blakus, pie kam katrā LED paneļa modulī (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ir daudzas gaismu emitējošas LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72), kas raksturīgs ar to, ka vismaz viens pāris katrā no blakus esošajiem LED paneļa moduļiem (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ir samontēts lielākā par 0° leņķī attiecībā pret tā virsmas normāli, pie kam LED paneļa moduļi (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) veido longitudināli izstieptu apgaismes aparātu (40-40", 45-45",

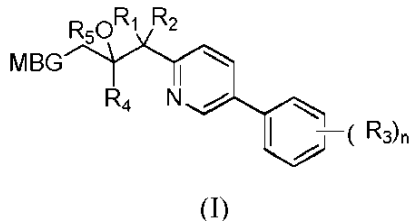
50-50", 60, 80, 93-93"), kuram ir neregulārs vai regulārs poligonāls šķērsriezums vismaz atsevišķās longitudinālā garuma daļās, kā arī raksturīgs ar to, ka LED paneļa moduļi (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ar LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) konfigurācija mainās atkarībā no vietas, jo īpaši samazinās vai palielinās LED paneļa moduļa (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) malas zonas virzienā.

2. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apgaismes aparāta (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") forma ir lokana.
3. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) LED paneļa moduļos (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ir izvietotas tā, ka to priekšpusē ir apgaismes aparāta (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") dobā telpā vai ārpus tās.
4. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka vismaz divi LED paneļa moduļi (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ir savienoti ar kopīgu siltuma satekni (65, 82), kura, vislabāk, var tikt iekļauta vai ir iekļauta dzesēšanas ciklā.
5. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) uz LED paneļa moduļa (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ir izvietotas tieši līdz LED paneļa moduļa (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) malai.
6. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka LED paneļa modulī (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) elektriskā jauda var tikt padota individuālām LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) vai LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) grupām atsevišķi vienai no otras.
7. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka LED grupas (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) LED paneļa modulī (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸), kurām elektriskā jauda var tikt padota katrai atsevišķi, ir samontētas LED paneļa moduļa (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) rindās, pusvirsmās (75, 75') vai kvadrantos (74-74").
8. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) LED paneļa modulī (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) ir pārklātas, vismaz tā atsevišķās daļās, ar optiski caurspīdīgu vai difūzu materiālu (25) vai ir pārklātas liešanas ceļā ar optiski caurspīdīgu vai difūzu materiālu (35).
9. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pārklājošā materiāla laterālās robežas (26, 26') vai uzlietais izolētājpavalks (36, 36') ir optiski caurspīdīgi un/vai tiem augstums virs LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) virsmas nepārsniedz attālumu starp blakus esošajām LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72).
10. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka LED paneļa modulis (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) satur vismaz vienu attēlu veidojošu un/vai attēlu neveidojošu primāro optisko un/vai sekundāro optisko elementu, jo īpaši vismaz vienu optisko elementu no rindas, kas sastāv no reflektoriem, lēcām un Freneļa lēcām.
11. Apgaismes aparāts (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka LED paneļa modulis (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81-81⁸) satur vismaz vienu sensoru, jo īpaši vismaz vienu sensoru no rindas, kas sastāv no fotosensoriem, temperatūras sensoriem, spiediena sensoriem, kustības sensoriem, strāvas sensoriem un magnētiskā lauka sensoriem, kas detektē apgaismes aparāta (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") darbības statusu.
12. Apgaismes iekārta (90), kas satur vadības ierīci (91), savienotājliniju (92) un vismaz vienu apgaismes aparātu (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.

13. Apgaismes aparāta (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93") saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai izmantošana tādu dobu telpu apgaismošanai, kuras vismaz daļēji ir izliektas, jo īpaši pret gaismu reaktīvu laku, adhezīvu un sveķu, jo īpaši šļūteru apvalku, žāvēšanai, cietināšanai un/vai apgaismošanai.



- (51) **C07D 401/06**^(2006.01) (11) **2563771**
A61K 31/4439^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
A61P 9/00^(2006.01)
- (21) 11772772.7 (22) 22.04.2011
(43) 06.03.2013
(45) 25.11.2015
(31) 327663 P (32) 24.04.2010 (33) US
(86) PCT/US2011/033597 22.04.2011
(87) WO2011/133875 27.10.2011
(73) Viamet Pharmaceuticals, Inc., 4505 Emperor Boulevard, Suite 300, Durham, NC 27703, US
(72) HOEKSTRA, William, J., US
SCHOTZINGER, Robert, J., US
RAFFERTY, Stephen, William, US
(74) Plougmann & Vingtoft A/S, Rued Langgaards Vej 8, 2300 Copenhagen S, DK
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **METĀLEŅZĪMS INHĪBĒJOŠI SAVIENOJUMI METALLOENZĪMS INHĪBĪTOR COMPOUNDS**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I) vai tā sāls



kurā:
MBG ir neobligāti aizvietota tetrazolilgrupa, neobligāti aizvietota triazolilgrupa vai neobligāti aizvietota pirazolilgrupa;

- R₁ ir halogēna atoms;
R₂ ir halogēna atoms;
katrs R₃ neatkarīgi ir alkilgrupa, cianogrupa, halogēnalkilgrupa, alkoksigrupa, halogēna atoms, halogēnalkoksigrupa;
R₄ ir arilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 neatkarīgiem R₃;
R₅ ir H vai -C(O)alkilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar aminogrupu; n ir 0, 1, 2 vai 3.
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₁ ir fluora atoms.
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₂ ir fluora atoms.
4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₁ un R₂ ir fluora atomi.
5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₄ ir fenilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 neatkarīgiem R₃.
6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₄ ir fenilgrupa,

kas neobligāti aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 neatkarīgiem halogēna atomiem.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₄ ir fenilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 neatkarīgiem fluora atomiem.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₄ ir 2,4-difluorfenilgrupa.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₅ ir H.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R₅ ir amino-aizvietota acilgrupa.

11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

- R₁ ir fluora atoms;
R₂ ir fluora atoms;
R₄ ir 2,4-difluorfenilgrupa; un
R₅ ir H.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā: katrs R₃ neatkarīgi ir cianogrupa, halogēnalkilgrupa, alkoksigrupa, halogēna atoms, halogēnalkoksigrupa; un n ir 1 vai 2.

13. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, kurā: katrs R₃ neatkarīgi ir cianogrupa, halogēnalkilgrupa, alkoksigrupa, halogēna atoms, halogēnalkoksigrupa; un n ir 1.

14. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir viens no rindas:

- 4-(6-(2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-2-hidroksi-3-(1H-tetrazol-1-il)propil)piridin-3-il)benzonitrils (1);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (2);
3-(6-(2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-2-hidroksi-3-(1H-tetrazol-1-il)propil)piridin-3-il)benzonitrils (3);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-1-(5-(4-izopropoksifenil)piridin-2-il)-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (4);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-1-(5-(4-fluorfenil)piridin-2-il)-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (5);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(3-(trifluorometoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (6);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(trifluorometoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (7);
1-(5-(3-hlorfenil)piridin-2-il)-2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (8);
1-(5-(4-hlorfenil)piridin-2-il)-2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (9);
2-(2,4-difluorfenil)-1-(5-(2,5-difluorfenil)piridin-2-il)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (10);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(2,2,2-trifluoretoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (11);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-1-(5-(4-(2,2,3,3-pentafluorpropoksi)fenil)piridin-2-il)-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (12);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(2,2,2-trifluoretoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-il-3-aminopropanoāts (13);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(2,2,2-trifluoretoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-il-2-aminoacetāta hidrohlorīds (14);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-pirazol-3-il)-1-(5-(4-(trifluorometoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (15);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-1-(5-(4-fluorfenil)piridin-2-il)-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ols (16);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-1-(5-(4-(2,2,2-trifluoretoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (17);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-1-(5-(4-(trifluorometoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (18);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-1,2,3-triazol-1-il)-1-(5-(4-(trifluorometoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (19);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(2H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(2,2,2-trifluoretoksi)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (20);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(2H-tetrazol-1-il)-1-(5-(3-fluorfenil)piridin-2-il)propan-2-ols (21);
2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(2H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (22);
2-(2, 4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-1,2,3-triazol-1-il)-1-(5-(4-(trifluorometilfenil)piridin-2-il)propan-2-ols (23);
4-(6-(2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-2-hidroksi-3-(1H-tetrazol-1-il)propil)piridin-3-il)fenols (24);

2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-1-(5-(3-izopropilfenil)piridin-2-il)-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (25);
 2-(2,4-difluorfenil)-1-(5-(3,4-difluorfenil)piridin-2-il)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (26);
 1-(5-(3-(difluorometoksi)fenil)piridin-2-il)-2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)propan-2-ols (27);
 2-(2,4-difluorfenil)-1,1-difluor-3-(1H-tetrazol-1-il)-1-(5-(4-((trifluorometil)tio)fenil)piridin-2-il)propan-2-ols (28).

15. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju un farmaceitiski pieņemams nesējs.

- (51) **A61K 31/365**^(2006.01) (11) **2568980**
A61K 31/425^(2006.01)
A61K 31/7048^(2006.01)
A61K 9/00^(2006.01)
A61P 33/00^(2006.01)
A61P 33/10^(2006.01)
A61K 45/06^(2006.01)
A61K 47/18^(2006.01)
A61K 47/26^(2006.01)
A61K 47/44^(2006.01)
- (21) 11731566.3 (22) 12.05.2011
 (43) 20.03.2013
 (45) 11.11.2015
 (31) 333882 P (32) 12.05.2010 (33) US
 (86) PCT/US2011/036321 12.05.2011
 (87) WO2011/143479 17.11.2011
 (73) Merial, Inc., 3239 Satellite Boulevard, Bldg. 500, Duluth, GA 30096, US
 (72) HOLMES, Robert, NZ
 RAZZAK, Majid, NZ
 JOHNSON, Alan, NZ
 GOSWAMI, Jitendra, NZ
 AWASTHI, Atul, NZ
 (74) D Young & Co LLP, 120 Holborn, London EC1N 2DY, GB
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **INJICĒJAMAS PARAZITĪDĪV LEVAMIZOLA UN MAKROCIKLISKO LAKTONU KOMPOZĪCIJAS INJECTABLE PARASITICIDAL FORMULATIONS OF LEVAMISOLE AND MACROCYCLIC LACTONES**

(57) 1. Farmaceutiski vai veterināri pieņemama kompozīcija, kas pielāgota injicēšanai dzīvniekam, šī kompozīcija ietver:

- levamizola efektīvu daudzumu;
- vismaz viena makrocikliska laktona efektīvu daudzumu;
- farmaceutiski pieņemamu šķīdinātāju un virsmaktīvu vielu sistēmu, turklāt sistēma nodrošina gan levamizola, gan makrocikliskā laktona pieņemamu uzglabāšanas stabilitāti, un turklāt sistēma nodrošina injekcijām piemērotu viskozitāti; turklāt sistēma satur vismaz vienu virsmaktīvu vielu, kur virsmaktīvā viela ir CREMOPHOR EL, un ar ūdeni sajaucamu organisko šķīdinātāju, kas ir dimetilacetamīds (DMA).

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt levamizols ir levamizola fosfāts un turklāt levamizols ir pietiekamā daudzumā, lai ievadītā deva būtu vismaz 4 mg/kg dzīvnieka ķermeņa masas.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt makrocikliskais laktons ir ivermektīns vai eprinomektīns un tas ir pietiekamā daudzumā, lai ievadītā deva būtu vismaz 150 µg/kg dzīvnieka ķermeņa masas.

4. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas papildus ietver antioksidantu, konservantu un ūdeni injekcijām, turklāt ūdens injekcijām tiek pievienots daudzumā, kas ir pietiekams, lai kompozīcija būtu sagatavota injekcijām piemērotā tilpumā.

5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt makrocikliskā laktona koncentrācija ir no aptuveni 0,1 % līdz aptuveni 2 % (w/v - masas tilpuma procenti), levamizola koncentrācija ir no aptuveni 15 % līdz aptuveni 30 % (w/v) un virsmaktīvās vielas koncentrācija ir no aptuveni 1 % līdz aptuveni 10 % (w/v).

6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt makrocikliskais laktons ir eprinomektīns, un tā koncentrācija ir aptuveni 0,5 % līdz aptuveni 0,9 % (w/v); levamizols ir levamizola fosfāts un tā

koncentrācija ir aptuveni 18 % līdz aptuveni 25 % (w/v), virsmaktīvā viela ir CREMOPHOR EL vai CREMOPHOR EL kombinācija ar POLYSORBATE 80, un tā koncentrācija ir aptuveni 3 % līdz aptuveni 7 % (w/v), antioksidants ir BHT, šķīdinātājs ir DMA un tā koncentrācija ir aptuveni 1 % līdz aptuveni 10 % (w/v), un konservants ir metilparabēns.

7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt makrocikliskais laktons ir eprinomektīns un turklāt eprinomektīnam ir tāda specifiskācija, ka tā B1a sastāvs ir lielāks par vai vienāds ar 85,0 % un B1a+B1b sastāvu summa ir lielāka par vai vienāda ar 90,0 %, un turklāt kompozīcijas blīvums ir starp 0,95 un 1,20, un pH ir robežās starp 3,0 un 5,0.

8. Farmaceutiski vai veterināri pieņemama kompozīcija, pielāgota injicēšanai dzīvniekam, šī kompozīcija ietver:

- levamizola efektīvu daudzumu;
- vismaz viena makrocikliska laktona efektīvu daudzumu;
- farmaceutiski pieņemamu šķīdinātāju un virsmaktīvu vielu sistēmu, turklāt sistēma nodrošina gan levamizola, gan makrocikliskā laktona pieņemamu uzglabāšanas stabilitāti, un turklāt sistēma nodrošina injekcijām piemērotu viskozitāti; turklāt sistēma satur vismaz vienu virsmaktīvu vielu, kur virsmaktīvā viela ir CREMOPHOR EL, un ar ūdeni sajaucamu organisko šķīdinātāju, kas ir dimetilacetamīds (DMA), turklāt makrocikliskais laktons ir eprinomektīns un tā koncentrācija ir aptuveni 0,5 % līdz aptuveni 0,9 % (w/v); levamizols ir levamizola fosfāts un tā koncentrācija ir aptuveni 18 % līdz aptuveni 25 % (w/v), virsmaktīvā viela ir POLYSORBATE 80, CREMOPHOR EL vai to kombinācija, un tā koncentrācija ir aptuveni 3 % līdz aptuveni 7 % (w/v), antioksidants ir BHT, šķīdinātājs ir DMA un tā koncentrācija ir aptuveni 1 % līdz aptuveni 10 % (w/v), un konservants ir metilparabēns.

9. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai lietošanai dzīvnieku iekšējo parazītu invāzijas novēršanai vai ārstēšanai.

10. Kompozīcija saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt kompozīcija tiek injicēta.

11. Kompozīcija lietošanai saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, turklāt makrocikliskā laktona koncentrācija ir no 0,5 % līdz 0,9 % (w/v) un levamizola koncentrācija ir no 15 % līdz 25 % (w/v).

12. Kompozīcija lietošanai saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, turklāt parazīti ir helminti.

13. Kompozīcija lietošanai saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt helminti ir nematodes, lenteņi, trematodes.

14. Metode kompozīcijas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju iegūšanai, metode ietver sekojošus soļus:

- injekcijām paredzētā ūdens pievienošana traukā,
- levamizola izšķīdināšana ūdenī,
- eprinomektīna un BHT izšķīdināšana DMA atsevišķā traukā,
- virsmaktīvās vielas pievienošana DMA/eprinomektīna maisījumam,
- DMA/eprinomektīna maisījuma pārvešana pie ūdens fāzes tilpuma maisot, un
- neobligāti, injekcijām paredzētā ūdens pievienošana nepieciešamā produkta tilpuma sasniegšanai, sajaukšana.

- (51) **C07K 16/00**^(2006.01) (11) **2573114**
A61K 39/395^(2006.01)
C07H 21/04^(2006.01)
C12N 15/00^(2006.01)
C12Q 1/68^(2006.01)
C07K 17/00^(2006.01)
C07K 16/28^(2006.01)
C07K 16/32^(2006.01)
C07K 16/44^(2006.01)
G01N 33/574^(2006.01)
A61K 39/00^(2006.01)
- (21) 12171813.4 (22) 10.08.2006
 (43) 27.03.2013
 (45) 30.03.2016
 (31) 707419 P (32) 10.08.2005 (33) US
 (62) EP06801146.9 / EP1919503
 (73) MacroGenics, Inc., 9640 Medical Center Drive, Rockville, MD 20850, US

- (72) STAVENHAGEN, Jeffery, DK
GORLATOV, Sergey, US
RANKIN, Christopher, US
TUAILLON, Nadine, US
- (74) Bizley, Richard Edward, et al, avidity IP, Merlin House, Falconry Court, Baker's Lane, Epping, Essex CM16 5DQ, GB
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **ANTIVIĒLU AR IZMAINĪTIEM Fc APGABALIEM IDENTIFIKĀCIJA UN KONSTRUĒŠANA UN TO IZMANTOŠANAS METODES**
IDENTIFICATION AND ENGINEERING OF ANTIBODIES WITH VARIANT Fc REGIONS AND METHODS OF USING SAME
- (57) 1. Polipeptīds, kas satur izmainītu IgG1 Fc apgabalu, turklāt minētais izmainītais Fc apgabals, salīdzinot ar savvaļas tipa IgG1 Fc apgabalu, satur vismaz vienu aminoskābes modifikāciju, tādu, ka:
- (I) minētā polipeptīda minētais izmainītais Fc apgabals saistās ar:
- (A) FcγRIIIA ar lielāku afinitāti un
(B) FcγRIIB ar mainītu saistīšanās afinitāti, turklāt minētās lielākā un mainītā saistīšanās afinitātes tiek salīdzinātas ar saistīšanās afinitātēm, ko šāds polipeptīds uzrādītu pret minētajiem FcγR, ja tas saturētu savvaļas tipa Fc apgabalu, un
- (II) turklāt minētā vismaz viena aminoskābes modifikācija satur substitūciju komplektu, izvēlētu no grupas, kas sastāv no:
- (1) substitūcijas 243. pozīcijā ar leicīnu un 292. pozīcijā ar prolīnu,
(2) substitūcijas 243. pozīcijā ar leicīnu, 292. pozīcijā ar prolīnu un 305. pozīcijā ar izoleicīnu,
(3) substitūcijas 243. pozīcijā ar leicīnu, 292. pozīcijā ar prolīnu un 396. pozīcijā ar leicīnu,
(4) substitūcijas 243. pozīcijā ar leicīnu, 292. pozīcijā ar prolīnu un 300. pozīcijā ar leicīnu un
(5) substitūcijas 243. pozīcijā ar leicīnu, 292. pozīcijā ar prolīnu, 300. pozīcijā ar leicīnu un 396. pozīcijā ar leicīnu, turklāt pozīcijas ir numurētas saskaņā ar EU indeksu pēc Kabata.
2. Polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais polipeptīds ir anti viela vai anti vielas fragments, kas satur minēto izmainīto Fc apgabalu.
3. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētā anti viela ir monoklonāla anti viela, humanizēta anti viela vai cilvēka anti viela.
4. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētā anti viela satur mainīgu domēnu, kas saistās ar CD16A vai CD32B.
5. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētā anti viela ir hibridomas ar ATCC piekļuves Nr. PTA-4591 producēta anti viela 2B6.
6. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt minētā anti viela ir hibridomas ar ATCC piekļuves Nr. PTA-4591 producētās anti vielas 2B6 humanizēta versija.
7. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētā anti viela konkurējoši inhibē hibridomas ar ATCC piekļuves Nr. PTA-4591 producētās anti vielas 2B6 saistīšanos ar CD32B.
8. Nukleīnskābe, kas satur nukleotīdu sekvenci, kas kodē polipeptīdu saskaņā ar 1. pretenziju.
9. Vektors, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 8. pretenziju.
10. Izolēta saimniekšūna, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 9. pretenziju.
11. Metode polipeptīda saskaņā ar 1. pretenziju rekombinantai producēšanai, turklāt minētā metode ietver: (i) saimniekšūnas, kas satur minēto polipeptīdu kodējošu nukleīnskābi, kultivēšanu vidē minētā polipeptīda ekspresijai piemērotos apstākļos un (ii) minētā polipeptīda izdalīšanu no minētās vides.
12. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētā anti viela vai minētais fragments papildus specifiski saistās ar vēža antigēnu vai infekcijas ierosinātāja antigēnu.
13. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētā anti viela, salīdzinājumā ar savvaļas tipa Fc apgabalu satur rošu salīdzināmu anti vielu, mediē pastiprinātu anti vielu atkarīgas šūnas mediētu citotoksicitāti.
14. Anti vielas vai tās fragmenta saskaņā ar 12. pretenziju iz-

mantošana medikamenta gatavošanā vēža ārstēšanai pacientam, kam ir vēzis, kuram ir raksturīgs minētais vēža antigēns.

15. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 12. pretenziju vai izmantošana saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt minētais vēža antigēns ir MAGE-1, MAGE-3, BAGE, GAGE-1, GAGE-2, N-acetilglikozamīnitransferāze, p15, bēta-katenīns, MUM-1, CDK4, HER-2/neu, cilvēka papilomas vīruss E6, cilvēka papilomas vīruss E7 vai MUC-1.

16. Anti viela vai tās fragments saskaņā ar 12. pretenziju vai izmantošana saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt minētais vēža antigēns ir krūts, olnīcu, prostatas, dzemdes kakla vai aizkuņģa dziedzera karcinomas antigēns.

17. Polipeptīda saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana medikamenta gatavošanā iekaisuma slimības ārstēšanai.

18. Kompozīcija, kas satur polipeptīda saskaņā ar 1. pretenziju vai anti vielas vai tās fragmenta saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai, 12., 13., 15. vai 16. pretenzijas terapeitiski efektīvu daudzumu un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

19. Nukleīnskābe, kas satur nukleotīdu sekvenci, kas kodē anti vielas saskaņā ar 2. pretenziju smago ķēdi.

20. Vektors, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 19. pretenziju.

21. Izolēta saimniekšūna, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 19. pretenziju.

22. Anti viela saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt minētā anti viela ir ar uzlabotu ADCC aktivitāti salīdzinājumā ar minētās anti vielas ADCC aktivitāti, ja tā satur savvaļas tipa Fc apgabalu.

23. Polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais izmainītais Fc apgabals papildus satur vienu vai vairākas aminoskābju modifikācijas, kas norādītas 5., 6., 7. vai 8. tabulā.

- (51) **A61K 38/16**^(2006.01) (11) **2586456**
(21) 12155003.2 (22) 31.10.2005
(43) 01.05.2013
(45) 20.01.2016
(31) 623342 P (32) 29.10.2004 (33) US
(62) EP05824723.0 / EP1814573
(73) ratiopharm GmbH, Graf-Arco-Strasse 3, 89079 Ulm, DE
(72) Defrees, Shawn, US
(74) Neuefeind, Regina, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstrasse 3, 80335 München, DE
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **FIBROBLASTU AUGŠANAS FAKTORA (FGF) PĀRVEIDOŠANA UN GLIKOPEGILĒŠANA**
REMODELING AND GLYCOPEGLYATION OF FIBROBLAST GROWTH FACTOR (FGF)

(57) 1. Fibroblastu augšanas faktora (FGF) konjugāts, kas satur:

- mutantu FGF-21 peptīdu, kas satur jaunievietu N-saistītu vai O-saistītu glikozilācijas vietu, kura neeksistē attiecīgā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktorā, turklāt attiecīgajam savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktoram ir aminoskābes sekvence, kas ir vismaz 95 % homologa ar SEQ ID NO: 146;

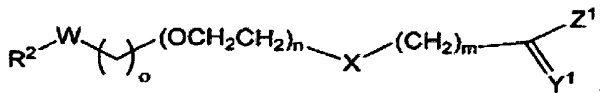
un turklāt jaunievietā N-saistītā vai O-saistītā glikozilācijas vieta ir mazāk nekā par 4 aminoskābēm pārvietota no prolīna atlikuma uz prolīna atlikuma C- vai N-gala pusi, piemēram, prolīna atlikums atrodas SEQ ID NO: 146 pozīcijā 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172 vai 178;

- un modificējošu grupu, turklāt minētā modificējošā grupa ir kovalenti piesaistīta minētajam peptīdam pie iepriekš izvēlēta minētā mutanta FGF peptīda-21 glikozilgrupas vai aminoskābes atlikuma ar intaktu glikozilgrupu saistošu grupu, proti, ar glikozilgrupu saistošu grupu, kurā saharīda monomērs, kas saista modificējošo grupu pie molekulas atlikuma, nav noārdīts.

2. FGF konjugāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais mutanta FGF-21 peptīds satur vismaz vienu aminoskābes sekvenci, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no SEQ ID NO: 161–214, 220–320 un 323–337.

3. FGF konjugāts saskaņā ar jebkuru no iepriekš minētajām pretenzijām, turklāt minētā modificējošā grupa ir kovalenti piesaistīta minētajam iepriekš izvēlētajam glikozilgrupas atlikumam, pēc izvēles minētā modificējošā grupa ir glikozīdgrupu nemodificējoša

grupa; pēc izvēles minētā glikozīdgrupu nemoificējošā grupa ir loceklis, kas izvēlēts no lineāra PEG un sazarota PEG; pēc izvēles minētais lineārais PEG ir ar struktūru, kas atbilst šādai formulai:



kurā:

R² ir loceklis, kas izvēlēts no H atoma, aizvietotas vai neaizvietotas alkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas arilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heteroarilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heterocikloalkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heteroalkilgrupas, piemēram, acetilgrupas, OHC-, H₂N-CH₂CH₂-, HS-CH₂CH₂- un -(CH₂)_qC(Y¹)Z²; -cukura-nukleotīda grupas vai proteīna;

n ir vesels skaitlis, izvēlēts no 1 līdz 2500;

m, o, un q ir veseli skaitļi, kas neatkarīgi izvēlēti no 0 līdz 20;

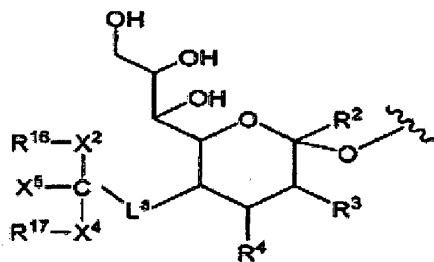
Z ir loceklis, kas izvēlēts no OH, NH₂ grupas, halogēna atoma, S-R³ grupas, aktivēto esteru spirtu daļas, -(CH₂)_pC(Y²)V, -(CH₂)_pU(CH₂)_sC(Y²)_v, cukura-nukleotīda grupas, proteīna un aizējošajām grupām, piemēram, imidazolgrupas, p-nitrofenilgrupas, HOBT, tetrazolgrupas, halogēnīda;

X, Y¹, Y², W un U ir neatkarīgi izvēlēti no O, S atoma, N-R⁴ grupas;

V ir loceklis, kas izvēlēts no OH, NH₂ grupas, halogēna atoma, S-R⁵ grupas, aktivēto esteru spirta daļas, aktivēto amīdu amīna daļas, cukura-nukleotīdiem un proteīniem;

p, s un v ir veseli skaitļi, kas neatkarīgi izvēlēti no 0 līdz 20; un R³, R⁴ un R⁵ ir neatkarīgi izvēlēti no H atoma, aizvietotas vai neaizvietotas alkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heteroalkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas arilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heterocikloalkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heteroarilgrupas.

4. FGF konjugāts saskaņā ar jebkuru no iepriekš minētajām pretenzijām, turklāt minētā glikozilgrupu saistošā grupa ir ar struktūru, kas atbilst šādai formulai:



kur:

R² ir H atoms, CH₂OR⁷, COOR⁷ vai OR⁷ grupa, kur R⁷ apzīmē H atomu, aizvietotu vai neaizvietotu alkilgrupu vai aizvietotu vai neaizvietotu heteroalkilgrupu;

R³ un R⁴ ir neatkarīgi izvēlēti no H atoma, aizvietotas vai neaizvietotas alkilgrupas, OR⁸, NHC(O)R⁹ grupas, kur R⁸ un R⁹ ir neatkarīgi izvēlēti no H atoma, aizvietotas vai neaizvietotas alkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heteroalkilgrupas vai siālskābes;

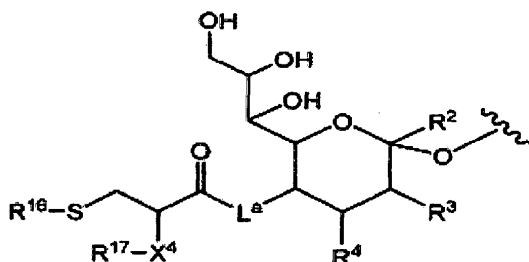
L³ ir linkeris, kas izvēlēts no saites, aizvietotas vai neaizvietotas alkilgrupas un aizvietotas vai neaizvietotas heteroalkilgrupas;

R¹⁶ un R¹⁷ ir neatkarīgi izvēlētas polimēru funkcionālās grupas;

X² un X⁴ ir neatkarīgi izvēlēti savienojuma fragmenti, kas savieno polimēru daļas R¹⁶ un R¹⁷ ar C, un

X⁵ ir nereaģējoša grupa;

pēc izvēles minētā glikozilgrupu saistošā grupa ir ar struktūru, kas atbilst šādai formulai:



5. Izolēta nukleīnskābe, kas satur polinukleotīdu sekvenci, kura kodē mutantu fibroblastu augšanas faktoru-21, turklāt mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur jaunievietu N-saistītu vai O-saistītu glikozilācijas vietu, kura neeksistē attiecīgā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktorā, turklāt attiecīgā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktora aminoskābes sekvence ir vismaz 95 % homologa ar SEQ ID NO: 146; un turklāt jaunievietā glikozilācijas vieta ir mazāk nekā par 4 aminoskābēm pārvietota no prolīna atlikuma uz prolīna atlikuma C- vai N-gala pusi, piemēram, prolīna atlikums atrodas SEQ ID NO: 146 pozīcijā 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172 vai 178.

6. Nukleīnskābe saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vismaz vienu aminoskābes sekvenci, kas izvēlēta no grupas, kura sastāv no SEQ ID NO: 161–214, 220–320 un 323–337, un/vai turklāt mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vairāk nekā vienu jaunievieto glikozilācijas vietu.

7. Ekspresijas kasete vai šūna, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju.

8. Mutants fibroblastu augšanas faktors-21, kas satur jaunievietu N-saistītu vai O-saistītu glikozilācijas vietu, kura neeksistē attiecīgā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktorā, turklāt attiecīgā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktora aminoskābes sekvence ir vismaz 95 % homologa ar SEQ ID NO: 146; un turklāt jaunievietā glikozilācijas vieta ir mazāk nekā par 4 aminoskābēm pārvietota no prolīna atlikuma uz prolīna atlikuma C- vai N-gala pusi, piemēram, prolīna atlikums atrodas SEQ ID NO: 146 pozīcijā 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172 vai 178.

9. Mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt minētais mutantais FGF-21 satur vismaz vienu aminoskābes sekvenci, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no SEQ ID NO: 161–214, 220–320 un 323–337, un/vai turklāt mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vairāk nekā vienu jaunievietu glikozilācijas vietu.

10. Mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kas satur ūdenī šķīstošu polimēru, kas piesaistīts glikozilācijas vietai, caur glikozilgrupas linkerī, pēc izvēles minētais glikozilgrupas linkeris ir intakts glikozilgrupas linkeris.

11. Metode mutanta fibroblastu augšanas faktora-21 iegūšanai, kurš satur jaunievietu N-saistītu vai O-saistītu glikozilācijas vietu, kura neeksistē attiecīgajā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktorā, ietver šādus soļus:

(a) mutantā fibroblastu augšanas faktora-21 rekombinantu producēšanu;

(b) mutantā fibroblastu augšanas faktora-21 glikozilēšanu jaunievietā glikozilācijas vietā,

turklāt minētā glikozilēšana ir bezšūnu, *in vitro* process, kurā attiecīgajam savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktoram ir aminoskābes sekvence, kas ir vismaz 95 % homologa ar SEQ ID NO: 146, un kurā jaunievietā glikozilācijas vieta ir mazāk nekā par 4 aminoskābēm pārvietota no prolīna atlikuma uz prolīna atlikuma C- vai N-gala pusi, piemēram, prolīna atlikums atrodas SEQ ID NO: 146 pozīcijā 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172, vai 178.

12. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vismaz vienu aminoskābes sekvenci, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no SEQ ID NO: 161–214, 220–320 un 323–337, un/vai turklāt mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vairāk nekā vienu jaunievietu glikozilācijas vietu.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kura satur efektīvu daudzumu produkta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. un no 8. līdz 10. pretenzijai.

14. Produkts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. un no 8. līdz 10. pretenzijai izmantošanai fibroblastu augšanas faktora trūkuma ārstēšanā.

15. Metode glikokonjugāta iegūšanai no mutanta fibroblastu augšanas faktora-21, kas satur jaunievietu N-saistītu vai O-saistītu glikozilācijas vietu, kura neeksistē attiecīgajā savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktorā, ietver šādus soļus:

(a) mutantā fibroblastu augšanas faktora-21 rekombinantu producēšanu; un

(b) mutantā fibroblastu augšanas faktora-21 enzimatisku glikozilāciju ar modificētu cukuru jaunievietā glikozilācijas vietā, turklāt minētā glikozilēšana ir bezšūnu, *in vitro* process, kurā attiecīgajam savvaļas tipa fibroblastu augšanas faktoram ir aminoskābes

sekvenca SEQ ID NO: 146 un kurā jaunievietā glikozilācijas vieta ir mazāk nekā par 4 aminoskābēm pārvietota no prolīna atlikuma uz prolīna atlikuma C- vai N-gala pusi, piemēram, prolīna atlikums atrodas SEQ ID NO: 146 pozīcijā 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172 vai 178, un/vai mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vismaz vienu aminoskābes sekvenci, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no SEQ ID NO: 161–214, 220–320 un 323–337, un/vai mutantais fibroblastu augšanas faktors-21 satur vairāk nekā vienu jaunievietu glikozilācijas vietu; pēc izvēles modificētais cukurs ir modificēts ar ūdenī šķīstošu polimēru, pēc izvēles ūdenī šķīstošais polimērs ir izvēlēts no grupas, kura sastāv no poli(etilēnglikola) un *m*-poli(etilēnglikola).

- (51) **B60P 7/16**^(2006.01) (11) **2595903**
B60P 7/08^(2006.01)
B65D 25/00^(2006.01)
- (21) 11736095.8 (22) 25.07.2011
- (43) 29.05.2013
- (45) 10.02.2016
- (31) 102010038311 (32) 23.07.2010 (33) DE
- (86) PCT/EP2011/062703 25.07.2011
- (87) WO2012/010710 26.01.2012
- (73) Wobben Properties GmbH, Borsigstrasse 26, 26607 Aurich, DE
- (72) ALBRECHTS, Harald, DE
- (74) Eisenführ, Speiser & Partner, Postfach 10 60 78, 28060 Bremen, DE
- Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

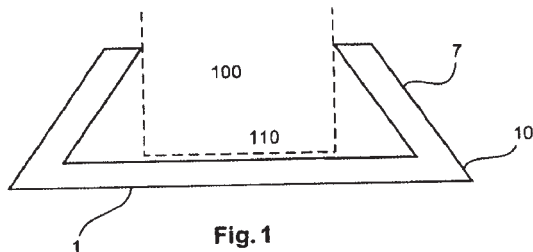
(54) **AIZSARGĀJOŠA PAMATNE VĒJTURBĪNAS TORŅA SEKCIJAS SEGMENTAM**
PROTECTIVE FOOT FOR A CONCRETE TOWER SEGMENT OF A WIND ENERGY PLANT

(57) 1. Aizsargājoša pamatne vējturbīnas torņa sekcijas segmentam vai betona torņa segmentam, kam ir pamata plātne (1) segmenta (100) viena gala uzņemšanai un piestiprināšanas elements atbrīvojamai piestiprināšanai pie segmenta pirmā gala, un vismaz viena sānu daļa (4, 8), kas piestiprināta pie pamata plātnes (1), raksturīga ar to, ka piestiprināšanas elements ir izveidots kā izplešams elements (2), kam ir skrūve (3), turklāt izplešamais elements (2) ir ievadāms segmenta caurumā, turklāt izplešamais elements (2) tiek izplests, ieskrūvējot skrūvi (3), un izplešamais elements (2) var tikt iestiprināts segmenta caurumā.

2. Aizsargājoša pamatne atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt pamata plātnes (1) un/vai sānu daļu (8) pamatmateriāls ir poliuretāns.

3. Aizsargājoša pamatne atbilstoši 1. vai 2. pretenzijai, kas papildus satur pretslīdēšanas elementu pamata plātnes (1) apakšpusē (1a) un/vai uz daļas no pamata plātnes (1) augšpusē (1b).

4. Vējturbīnas torņa sekcijas segments, kam ir vismaz viena jebkurai no 1. līdz 3. pretenzijai atbilstoša aizsargājoša pamatne.



- (51) **F04C 2/08**^(2006.01) (11) **2606234**
F04C 2/16^(2006.01)
F04C 11/00^(2006.01)
- (21) 11748632.4 (22) 18.08.2011
- (43) 26.06.2013
- (45) 20.01.2016
- (31) 202010011626 U (32) 20.08.2010 (33) DE
- (86) PCT/EP2011/064229 18.08.2011

- (87) WO2012/022784 23.02.2012
- (73) Hugo Vogelsang Maschinenbau GmbH, Holthöge 10-14, 49632 Essen, DE
- (72) KRAMPE, Paul, DE
- (74) Eisenführ, Speiser & Partner, Johannes-Brahms-Platz 1, 20355 Hamburg, DE
- Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **ROTĒJOŠU VIRZUĻU SŪKNIS**
ROTARY PISTON PUMP

(57) 1. Rotējošu virzuļu sūknis (100) cietas vielas saturoša šķidrums transportēšanai, kas satur:

- ievadīšanas atveri (111) un izvadīšanas atveri (112) transportējamam šķidrumam,

- divus vienā sūkņa korpusā (140) ierīkottus rotējošus virzuļus (121, 122) ar vienu otru iekabinātiem rotējošo virzuļu spārnēm, turklāt katrs no abiem rotējošajiem virzuļiem ir attiecīgi uzmontēts uz vārpstas (131) tā, lai grieztos kopā ar to un lai attiecīgā vārpsta varētu to piedzīt, un turklāt abas vārpstas ir viena ar otru saistītas ar pārnenumkārbā (152) ievietotu pārnenuma mehānismu, kas raksturīgs ar to, ka

- ievadīšanas atvere un izvadīšanas atvere ir ierīkotas pievienošanas korpusā (151),

- pārnenumkārbā (152) un pievienošanas korpusā (151) ir izveidoti kā pārnenuma mezgls (150).

2. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka sūkņa korpusā (140) un pārnenuma mezgls (150) ir viens ar otru savienoti atvienojamā veidā.

3. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīgs ar to, ka abi rotējošie virzuļi (121, 122) ir atvienojamā veidā piestiprināti pie attiecīgās vārpstas (131).

4. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka satur izturīgu plāksni (160), kas novietota starp sūkņa korpusu (140) un pārnenuma mezglu (150), turklāt izturīgā plāksne ir, vēlams, atvienojamā veidā piestiprināta pie pārnenuma mezgla.

5. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka rotējošo virzuļu sūknim ir tikai viena izturīgā plāksne (160).

6. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka sūkņa korpusam (140) abām vārpstām (131) nav gultņa.

7. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka sūkņa korpusā (140) ir izgatavots no viena gabala.

8. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka ievadīšanas atvere (111) ar pirmo plūsmas kanālu (113) un izvadīšanas atvere (112) ar otro plūsmas kanālu (114) ir savienota ar sūkņa kameru (141), kas izveidota sūkņa korpusa iekšpusē un vismaz daļa no pirmā un otrā plūsmas kanāla stiepijas būtībā aksiālā virzienā paralēli vārpstām (131).

9. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka ievadīšanas atvere (111) un izvadīšanas atvere (112) rotējošo virzuļu sūkņa darbības laikā atrodas pievienošanas korpusa (151) augšpusē.

10. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka ievadīšanas atvere (111) un izvadīšanas atvere (112) ir novietotas pievienošanas korpusā (151) tā, ka, rotējošo virzuļu sūknim darbojoties, pirmā ass, kas novietota taisnā leņķī pret ievadīšanas atveres plakni, un otrā ass, kas novietota taisnā leņķī pret izvadīšanas atveres plakni, attiecīgi slīpas 45° leņķī attiecībā pret vertikāli.

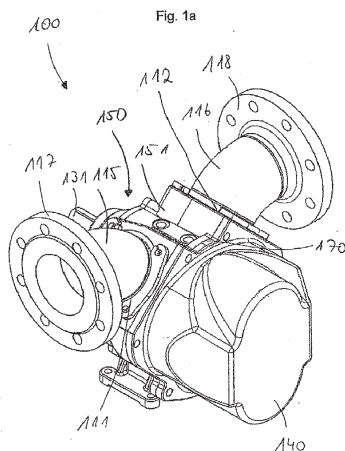
11. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka satur ievadīšanas īscauruli (115) ar ievadīšanas atloku (117), kas to pievieno pie ievadīšanas atveres (111), un izvadīšanas īscauruli (116) ar izvadīšanas atloku (118), kas to pievieno pie izvadīšanas atveres (112), turklāt ievadīšanas īscaurule un izvadīšanas īscaurule ir izveidotas un var tikt piestiprinātas pie pievienošanas korpusa (151) pirmajā piestiprināšanas pozīcijā tā, ka ievadīšanas un/vai izvadīšanas atloks, rotējošo virzuļu sūknim darbojoties, ir novietots/novietoti horizontāli, un/vai otrajā piestiprināšanas pozīcijā tā, ka ievadīšanas un/vai izvadīšanas atloks, rotējošo virzuļu sūknim darbojoties, ir

novietots/novietoti vertikāli.

12. Rotējošu virzuļu sūknis (100) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka pievienošanas korpusam (151) ir vismaz viens atverami noslēdzams drenāžas caurums, ar kura palīdzību transportējamais šķidrums var tikt iztecinašs.

13. Rotējošu virzuļu sūkņa komplekts nodrošināšanai ar dažāda lieluma un/vai ražīguma rotējošu virzuļu sūkņiem (100), kas satur jebkurai no iepriekšējām pretenzijām atbilstošu rotējošu virzuļu sūkni, un papildus ir raksturīgs ar to, ka satur vismaz divus citus atšķirīga lieluma rotējošus virzuļus, kam ir viens otrā iekabināti rotējošu virzuļu spāri, un divas vārpstas (131) un minētie vismaz divi citi atšķirīgā lieluma rotējošie virzuļi ir izveidoti tā, ka šie vismaz divi citi atšķirīgā lieluma rotējošie virzuļi var tikt noņemamā veidā uzmontēti uz attiecīgās vienas no abām vārpstām.

14. Rotējoša virzuļa sūkņa komplekts saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka satur vismaz vienu citu atšķirīga lieluma sūkņa korpusu, turklāt pārnesuma mezgls (150) un vismaz viens cits atšķirīgā lieluma sūkņa korpusi ir izveidoti tā, ka vismaz viens cits atšķirīgā lieluma sūkņa korpusi var tikt atvienojamā veidā pievienoti pie pārnesuma mezgla.



- (51) **D21F 11/00**^(2006.01) (11) **2607549**
- D21H 11/14**^(2006.01)
- B31F 1/12**^(2006.01)
- D21H 21/20**^(2006.01)
- D21H 25/00**^(2006.01)
- D21H 27/00**^(2006.01)
- D21H 27/02**^(2006.01)
- D21H 27/40**^(2006.01)
- A47K 10/02**^(2006.01)
- (21) 13001369.1 (22) 21.03.2006
- (43) 26.06.2013
- (45) 16.03.2016
- (31) 108375 (32) 18.04.2005 (33) US
- (62) EP06739068.2 / EP1879736
- (73) Georgia-Pacific Consumer Products LP, 133 Peachtree Street, N.E., Atlanta GA 30303, US
- (72) SUPER, Guy H., US
EDWARDS, Steven L., US
McCULLOUGH, Stephen J., US
MURRAY, Frank C., US
- (74) Grünecker Patent- und Rechtsanwälte PartG mbB, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **METODE AR AUDUMU KREPĒTAS ABSORBĒJOŠAS CELULOZES LOKSNES IZGATAVOŠANAI**
METHOD OF MAKING A FABRIC-CREPED ABSORBENT CELLULOSIC SHEET
- (57) 1. Metode ar audumu krepētas absorbējošas celulozes loksnes (74) izgatavošanai, pie kam metode satur:
 - (a) papīra izgatavošanas kompozīcijas strūklas uznesanu uz formējošā vada (52), pie kam strūklai ir strūklas ātrums, formējo-

šais vads (52) pārvietojas ar formējošā vada ātrumu, aprēķinātais strūklas ātruma lielums mīnus formējošā vada ātrums ir nosaukti par strūklas/vada ātruma delta koeficientu,

(b) papīra izgatavošanas kompozīcijas atūdeņošanu kompak-tēšanas ceļā, lai veidotu topošo klājumu (74),

(c) topošā klājuma (74) uznesanu uz pārneses virsmas (94), kas kustas ar pārneses virsmas ātrumu,

(d) topošā klājuma (74) krepēšanu ar audumu no pārneses virsmas (94) pie konsistences apmēram no 30 līdz aptuveni 60 procentiem, izmantojot krepēšanas audumu (48), kas pārvietojas ar krepēšanas ātrumu, pie kam: krepēšanas ātrums ir mazāks par minēto pārneses ātrumu; krepēšanas solis ar audumu notiek zem spiediena krepēšanas spraugā (106), kas ir izveidota starp pārneses virsmu (94) un krepēšanas audumu (48), kura struktūra, spraugas parametri, ātruma delta koeficients un klājuma konsistence tiek izvēlēti tā, ka topošais klājums (74) tiek krepēts no pārneses virsmas (94) ar reizklīdēts uz krepēšanas auduma (48), lai veidotu krepētu audumu (74) ar tīklojumu (retikulu), kuram ir daudzas savstarpēji saistītas zonas ar dažādiem lokāliem bāzes svāriem, ieskaitot vismaz: (i) lielu skaitu ar šķiedrām bagātinātu zonu (12) ar lielu lokālo bāzes svaru, kuras ir savstarpēji savienotas ar: (ii) daudzām mazāka lokālā bāzes svāri savienojošām zonām (14),

(e) krepētā klājuma (74) žāvēšanu, kas raksturīga ar to, ka metode papildus satur:

(f) strūklas/vada ātruma delta koeficienta un auduma krepēšanas soļa kontroliņu, tai skaitā tāda koeficienta izvēli, ka daudzajām ar šķiedrām bagātinātajām zonām (12) ir orientācijas nobīde mašīnas šķērsvirzienā CD (*Cross-Machine Direction*) un izžāvētā klājuma (74) stiepes koeficienta attiecība MD/CD mašīnas virzienā MD (*Machine Direction*) un CD virzienā ir ne lielāka aptuveni par 1,5 pie nosacījuma, ka strūklas/vada ātruma delta koeficients ir lielāks par 1,78 m/s (350 pēdām minūtē).

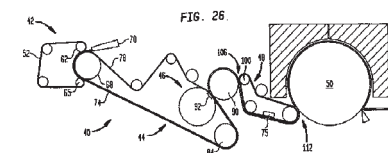
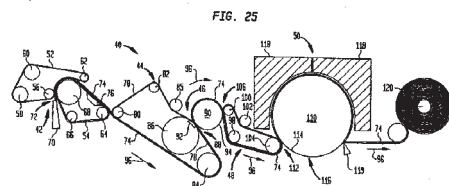
2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver strūklas/vada ātruma delta koeficienta un auduma krepēšanas soļa kontroliņu tā, ka izžāvētā klājuma stiepes koeficientu attiecība MD/CD apmēram ir ne lielāka par 1.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver strūklas/vada ātruma delta koeficienta un auduma krepēšanas soļa kontroliņu tā, ka izžāvētā klājuma stiepes koeficientu attiecība MD/CD aptuveni ir ne lielāka par 0,75.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver strūklas/vada ātruma delta koeficienta un auduma krepēšanas soļa kontroliņu tā, ka izžāvētā klājuma stiepes koeficientu attiecība MD/CD aptuveni ir ne lielāka par 0,5.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam strūklas/vada ātruma delta koeficients ir lielāks par 2,03 m/s (400 pēdām minūtē).

6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam strūklas/vada ātruma delta koeficients ir lielāks par 2,23 m/s (450 pēdām minūtē).



- (51) **D21F 11/00**^(2006.01) (11) **2610051**
- B31F 1/12**^(2006.01)
- (21) 13001373.3 (22) 21.03.2006
- (43) 03.07.2013
- (45) 16.03.2016
- (31) 108375 (32) 18.04.2005 (33) US
- (62) EP06739068.2 / EP1879736
- (73) Georgia-Pacific Consumer Products LP, 133 Peachtree Street, N.E., Atlanta GA 30303, US

- (72) SUPER, Guy H., US
EDWARDS, Steven L., US
McCULLOUGH, Stephen J., US
MURRAY, Frank C., US
- (74) Grünecker Patent- und Rechtsanwalte PartG mbB, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **AR AUDUMU KREPĒTA ABSORBĒJOŠA CELULOZES LOKSNE**
FABRIC-CREPED ABSORBENT CELLULOSIC SHEET

(57) 1. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne (10), kurā ir daudzas savstarpēji saistītas zonas ar atšķirīgu lokālo bāzes svaru, pie kam šī loksne ir izgatavota tehnoloģiskā procesā, kurš satur sekojošus soļus:

(a) papīra izgatavošanas kompozīcijas atūdeņošanu kompaktesānas ceļā, lai veidotu topošo klājumu (74), kam ir šķietami gadījuma rakstura papīra izgatavošanas šķiedru sadale;

(b) atūdeņotā klājuma (74), kuram ir šķietami gadījuma rakstura šķiedru sadalījums, uznešanu uz translācijas kustībā esošas pārvietošanas virsmas (94), kas kustas ar pārvietošanas virsmas ātrumu,

(c) klājuma (74) krepēšanu ar audumu no pārvietošanas virsmas (94) ar konsistenci aptuveni no 30 procentiem līdz aptuveni 60 procentiem, izmantojot strukturētu krepējošo audumu (48), pie kam: krepēšanas solis ar audumu notiek zem spiediena krepēšanas spraugā (106), kas ir izveidota starp pārvietošanas virsmu (94) un krepējošo audumu (48); krepējošais audums (48) pārvietojas ar krepējošā auduma ātrumu, kas ir mazāks par pārvietošanas virsmas ātrumu, izvēloties auduma struktūru, spraugas parametrus, ātruma delta koeficientu un tādu klājuma konsistenci, ka klājums (74) tiek krepēts no pārvietošanas virsmas (94) un reizklēdēts uz krepējošā auduma, lai izveidotu krepētu klājumu ar stiepjamu retikulu (tīklojumu), kurā ir daudzas savstarpēji saistītas zonas ar atšķirīgiem lokāliem bāzes svāriem, ietverot vismaz:

(i) daudzas ar šķiedrām bagātinātas zonas (12) ar augstu lokālo bāzes svaru, kas savstarpēji mijiedarbojas ar

(ii) daudzām mazāka lokālā bāzes svara saistošajām zonām (14);

(d) krepētā klājuma uznešanu uz žāvēšanas cilindra (110);

(e) krepētā klājuma žāvēšanu uz žāvēšanas cilindra (110), lai veidotu izžāvētu klājumu;

(f) izžāvēta klājuma noņemšanu no žāvēšanas cilindra, pie kam soļi (d), (e) un (f) tiek veikti tā, lai būtiski neizmainītu stiepjamo retikulu,

kas raksturīga ar to, ka loksnes izgatavošanas tehnoloģiskais process papildus satur:

(g) izžāvētā klājuma stiepšanu, lai veidotu absorbējošu celulozes loksni, pie kam žāvēšanas solī ar šķiedrām bagātinātās zonas (12) tiek stieptas mašīnas virzienā MD.

2. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne atbilstoši 1. pretenzijai, pie kam pirms loksnes (74) stiepšanas ar šķiedrām bagātināto zonu (12) orientācijai ir nobīde mašīnas šķērsvirzienā CD.

3. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam ar šķiedrām bagātinātajās zonās (12) ir daudzas plašas mikroieloces.

4. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam loksnes absorbēšanas spēja aptuveni ir no 6 g/g līdz aptuveni 9 g/g.

5. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam 8 lokšņu biezums aptuveni ir no 1,27 mm (50 milicollām) līdz 2,92 mm (115 milicollām).

6. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam loksnes stiepes koeficientu attiecība MD/CD mašīnas virzienā MD un mašīnas šķērsvirzienā CD ir mazāka par aptuveni vienu.

7. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam loksnes stiepes deformācija mašīnas šķērsvirzienā CD aptuveni ir no pieciem līdz aptuveni piecpadsmit procentiem.

8. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam loksnes absorbēšanas spēja aptuveni ir no 6 g/g līdz 9 g/g, 8 lokšņu biezums

aptuveni ir no 1,27 mm (50 milicollām) līdz 2,92 mm (115 milicollām), stiepes koeficientu attiecība MD/CD mašīnas virzienā MD un mašīnas šķērsvirzienā CD ir mazāka par aptuveni vienu, stiepes deformācija mašīnas šķērsvirzienā CD aptuveni ir no pieciem līdz aptuveni piecpadsmit procentiem.

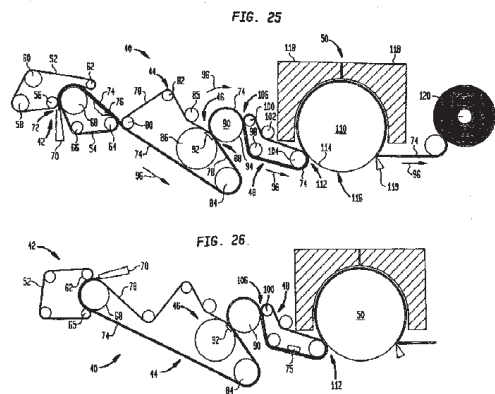
9. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam izžāvētā klājuma stiepšanas solis tajā būtiski palielina tukšumu tilpumu.

10. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam izžāvētā klājuma stiepšanas solis tajā palielina tukšumu tilpumu vismaz par divdesmit procentiem.

11. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, pie kam izžāvētā klājuma stiepšanas solis palielina tajā tukšumu tilpumu vismaz par trīsdesmit procentiem.

12. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, pie kam izžāvētā klājuma stiepšanas solis tajā palielina tukšumu tilpumu vismaz par četrdesmit procentiem

13. Ar audumu krepēta absorbējoša celulozes loksne saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam izžāvētā klājuma stiepšanas solis tajā samazina sānu virsmas tipu skaitu (angliski *sidedness*).



- (51) **A61K 31/4985^(2006.01)** (11) **2617420**
A61P 25/18^(2006.01)
- (21) 13150322.9 (22) 18.12.2009
- (43) 24.07.2013
- (45) 23.09.2015
- (31) 176413 P (32) 07.05.2009 (33) US
- (62) EP09796217.9 / EP2427454
- (73) Forum Pharmaceuticals Inc., 225 Second Avenue, Waltham, MA 02451, US
- (72) SHAPIRO, Gideon, US
RIPKA, Amy, US
CHESWORTH, Richard, US
- (74) Wells, Andrew, et al, Harrison Goddard Foote LLP, 4th Floor, Merchant Exchange, 17-19 Whitworth Street West, Manchester M1 5WG, GB
Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **HETEROCIKLISKI FENOKSIMETILSAVIEŅOJUMI**
PHENOXYMETHYL HETEROCYCLIC COMPOUNDS
- (57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur 4-(4-(imidazo[1,2-b]piridazin-2-ilmetoksi)fenil)-2,2-dimetil-5-(piridin-4-il)furan-3(2H)-ona vai tā farmaceutiski pieņemama sāls terapeitiski efektīvu daudzumu un farmaceutiski pieņemamu nesēju vai palīgvielu izmantošanai CNS traucējuma ārstēšanā, turklāt CNS traucējums ir viens vai vairāki traucējumi, kas izvēlēti no grupas, kura sastāv no Hantingtona slimības, šizofrēnijas un šizoafektīviem stāvokļiem, paranojāliem traucējumiem, zāļu izraisītām psihozēm, panikas un obsesīvi kompulsīviem traucējumiem, pēctraumatiskā stresa traucējumiem, ar vecumu saistītas kognitīvo spēju pasliktināšanās, uzmanības deficīta/hiperaktivitātes traucējuma, bipolāriem traucējumiem, paranojāliem personības traucējumiem, šizoīdā tipa personības

traucējumiem, alkohola, amfetamīnu, fenciklidīna, opioīdu halucinogēnu vai citu narkotiku izraisītas psihozes, diskinēzijas vai horejai līdzīgiem stāvokļiem, ieskaitot dopamīna agonistu, dopamīnerģiskas terapijas izraisītu diskinēziju, ar Pārkinsona slimību saistītu psihozi, psihotiskiem simptomiem, kas saistīti ar citiem neurodeģeneratīviem traucējumiem, ieskaitot Alcheimera slimību, distoniskiem stāvokļiem, tādiem kā idiopātiska distonija, zāļu izraisīta distonija, torsijas distonija un tardīvā diskinēzija, garastāvokļa traucējumiem, ieskaitot smagas depresijas epizodes, pēctriekas depresiju, vieglu depresijas traucējumu, premenstruālo disforisko traucējumu, demences, tostarp, bet ne tikai, multiinfarktu demences, ar AIDS saistītas demences un neurodeģeneratīvas demences.

2. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt CNS traucējums ir viens vai vairāki traucējumi, kas izvēlēti no grupas, kura sastāv no panikas, obsesīvi kompulsīva traucējuma, paranojāla traucējuma, zāļu izraisītas psihozes, pēctraumatiskā stresa traucējuma, ar vecumu saistītas kognitīvo spēju pasliktināšanās, uzmanības deficīta/hiperaktivitātes traucējuma, paranojāla personības traucējuma, šizoīdā tipa personības traucējuma, diskinēzijas, horejai līdzīga stāvokļa, ar Pārkinsona slimību saistītas psihozes, ar Alcheimera slimību saistītiem psihotiskiem simptomiem, garastāvokļa traucējuma un demences.

3. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt CNS traucējums ir obsesīvi kompulsīvs traucējums.

4. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt CNS traucējums ir panika.

5. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt CNS traucējums ir paranojāls personības traucējums.

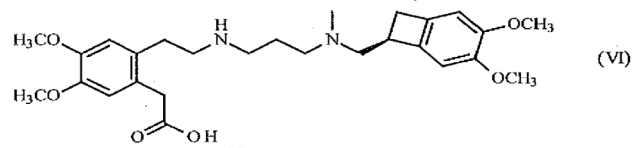
6. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt CNS traucējums ir šizoīdā tipa personības traucējums.

7. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt CNS traucējums ir uzmanības deficīta/hiperaktivitātes traucējums.

8. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt garastāvokļa traucējums ir smagas depresijas epizodes, pēctriekas depresija, viegls depresijas traucējums vai premenstruālais disforiskais traucējums.

9. Farmaceitiskā kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt demence ir multiinfarktu demence, ar AIDS saistīta demence vai neurodeģeneratīva demence.

sintēzes paņēmieni, kas raksturīgi ar to, ka savienojums ar formulu (VI):



tiek pakļauts laktamizācijai organiskajā šķīdinātājā savienojuma līdzekļa un bāzes klātbūtnē, lai iegūtu ivabradīnu ar formulu (I), ko var pārvērst par tā pievienotās skābes sāļiem ar farmaceitiski pieņemamu skābi, kas izvēlēta no sāļsskābes, bromūdeņražskābes, sērskābes, fosforskābes, etiķskābes, trifluoretiķskābes, pienskābes, pirovīnogskābes, malonskābes, dzintarskābes, glutārskābes, fumārskābes, vīnskābes, maleīnskābes, citronskābes, askorbīnskābes, skābeņskābes, metānsulfonskābes, benzolsulfonskābes un kamparskābes, un par tā hidrātiem.

2. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka savienojuma līdzeklis, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir izvēlēts no oksalilhlorīda, tionilhlorīda, N,N-dicikloheksilkarbodiimīda (DCC), 1-etil-3-(3-dimetilamīnopropi)karbodiimīda (EDCI), N,N-karbonildiimidazola (CDI), 1-propān-fosforskābes cikliskā anhidrīda (T3P) un 1-(metilsulfonyl)-1H-benzotriazola.

3. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 2. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka savienojuma līdzeklis, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir tionilhlorīds.

4. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka tionilhlorīda daudzums, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir no 1 līdz 5 ekvivalentiem, ieskaitot.

5. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgi ar to, ka bāze, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir izvēlēta no trietilamīna, diizopropil-etilamīna un pīridīna.

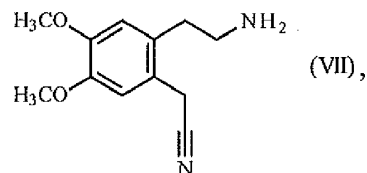
6. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka bāze, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir trietilamīns.

7. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgi ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir izvēlēts no dihlormetāna, tetrahidrofurāna, acetonitrila, acetona un toluola.

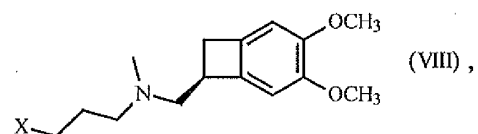
8. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VI) laktamizācijai, ir dihlormetāns.

9. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgi ar to, ka savienojuma ar formulu (VI) laktamizācija tiek veikta temperatūrā no 0 līdz 40 °C, ieskaitot.

10. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka savienojums ar formulu (VI) tiek iegūts, sākot no savienojuma ar formulu (VII):

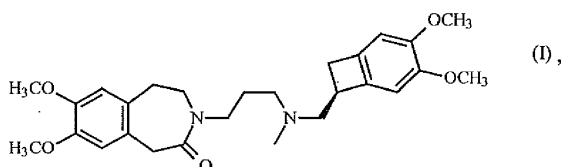


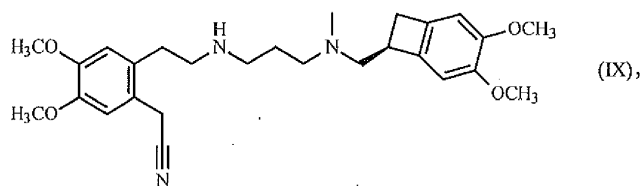
kas tiek pakļauts reakcijai ar savienojumu ar formulu (VIII):



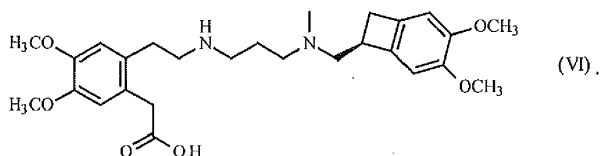
kur X ir halogēna atoms, mezilāta grupa vai tozilāta grupa, bāzes klātbūtnē organiskajā šķīdinātājā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IX):

- (51) **C07D 223/16**^(2006.01) (11) **2644597**
- C07C 215/08**^(2006.01)
- C07C 229/34**^(2006.01)
- C07C 255/43**^(2006.01)
- (21) 13161193.1 (22) 26.03.2013
- (43) 02.10.2013
- (45) 13.01.2016
- (31) 1252728 (32) 27.03.2012 (33) FR
- (73) Les Laboratoires Servier, 35, rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR
- (72) Le FLOHIC, Alexandre, FR
- GRANDJEAN, Mathieu, FR
- (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **JAUNS IVABRADĪNA UN TĀ FARMACEITISKI PIENĒMAMU PIEVIENOTĀS SKĀBES SĀĻU SINTĒZES PAŅĒMIENS**
- NOVEL METHOD FOR SYNTHESISING IVABRADINE AND ITS PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE ACID ADDITION SALTS**
- (57) 1. Ivabradīna ar formulu (I):

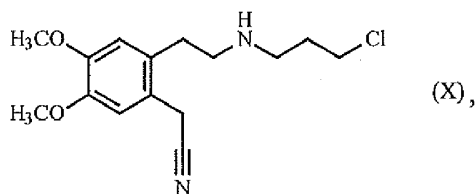




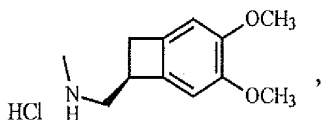
kas tiek hidrolizēts, bāzei iedarbojoties organiskā šķīdinātāja un ūdens maisījumā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI):



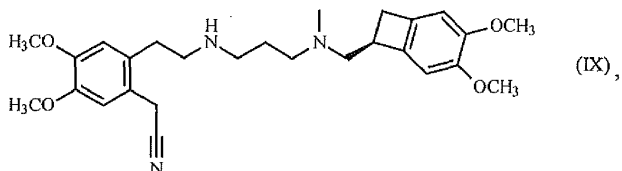
11. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (VI) tiek iegūts, sākot no savienojuma ar formulu (X):



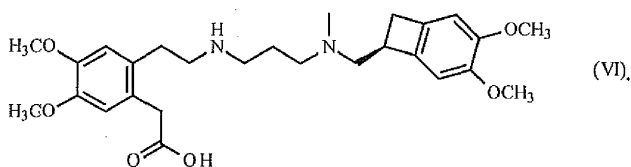
kas tiek pakļauts reakcijai ar savienojuma ar formulu (III) hidrochlorīdu:



bāzes klātbūtnē organiskajā šķīdinātājā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IX):



kas tiek hidrolizēts, bāzei iedarbojoties organiskā šķīdinātāja un ūdens maisījumā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI):



12. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka bāze, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VII) un savienojuma ar formulu (VIII) alkilēšanas reakcijai vai savienojuma ar formulu (X) un savienojuma ar formulu (III) hidrochlorīda alkilēšanas reakcijai, ir izvēlēta no kālija karbonāta, nātrija karbonāta, cēzija karbonāta, kālija hidrogēnkarbonāta, nātrija hidrogēnkarbonāta, trietilamīna, diizopropilētilamīna un piridīna.

13. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka bāze, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VII) un savienojuma ar formulu (VIII) alkilēšanas reakcijai vai savienojuma ar formulu (X) un savienojuma ar formulu (III) hidrochlorīda alkilēšanas reakcijai, ir trietilamīns.

14. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto

savienojuma ar formulu (VII) un savienojuma ar formulu (VIII) alkilēšanas reakcijai vai savienojuma ar formulu (X) un savienojuma ar formulu (III) hidrochlorīda alkilēšanas reakcijai, ir izvēlēts no acetnitrila, acetona, metiletilketona (MEK), dimetilformamīda (DMF), N-metilpirolidona (NMP) un dimetilsulfoksīda (DMSO).

15. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 14. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto savienojuma ar formulu (VII) un savienojuma ar formulu (VIII) alkilēšanas reakcijai vai savienojuma ar formulu (X) un savienojuma ar formulu (III) hidrochlorīda alkilēšanas reakcijai, ir acetnitrils.

16. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 15. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka savienojuma ar formulu (VII) un savienojuma ar formulu (VIII) alkilēšanas reakcija vai savienojuma ar formulu (X) un savienojuma ar formulu (III) hidrochlorīda alkilēšanas reakcija tiek veikta temperatūrā no 20 līdz 100 °C, ieskaitot.

17. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 16. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka bāze, kuru izmanto savienojuma ar formulu (IX) hidrolīzes veikšanai, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI), ir izvēlēta no kālija hidroksīda, nātrija hidroksīda, litija hidroksīda un bārija hidroksīda.

18. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka bāze, kuru izmanto savienojuma ar formulu (IX) hidrolīzes veikšanai, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI), ir nātrija hidroksīds.

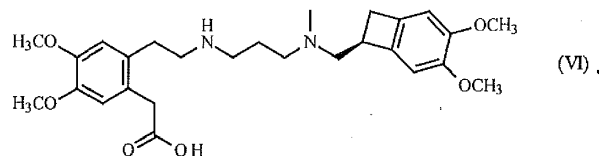
19. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 18. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto savienojuma ar formulu (IX) hidrolīzes veikšanai, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI), ir spirts.

20. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka spirts kā šķīdinātājs, kuru izmanto savienojuma ar formulu (IX) hidrolīzes veikšanai, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI), ir etanols.

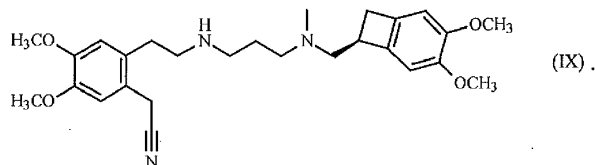
21. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 20. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka spirts kā šķīdinātājs, kuru izmanto savienojuma ar formulu (IX) hidrolīzes veikšanai, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI), ir etanols.

22. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 21. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka savienojuma ar formulu (IX) hidrolīze, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VI), tiek veikta temperatūrā no 0 līdz 110 °C, ieskaitot.

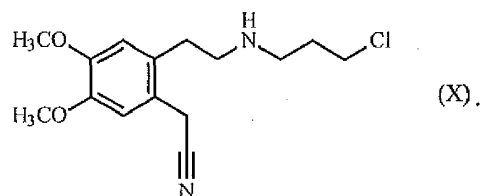
23. Savienojums ar formulu (VI):



24. Savienojums ar formulu (IX):



25. Savienojums ar formulu (X):



26. Etil N-{2-[2-(ciānmetil)-4,5-dimetoksifenil]etil}-β-alanīn-oksalāts.

27. (2-{2-[(3-hidroksipropil)amino]etil}-4,5-dimetoksifenil)acetnitrils.

- (51) **C03B 37/029**^(2006.01) (11) **2664593**
B65B 7/00^(2006.01)
 (21) 13167209.9 (22) 10.05.2013
 (43) 20.11.2013
 (45) 20.01.2016
 (31) 20125510 (32) 14.05.2012 (33) FI
 (73) Rosendahl Nextrom Oy, Ensimmäinen savu, 01510 Vantaa, FI
 (72) NUMMELA, Jukka, FI
 WIDERHOLM, Risto, FI
 KUTVONEN, Tatu, FI
 (74) Kolster Oy Ab, Iso Roobertinkatu 23, PO Box 148, 00121 Helsinki, FI
 Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **APARĀTS CAURUĻVEIDĪGA APSTRĀDES IERĪCES GALA BLĪVĒŠANAI**
APPARATUS FOR SEALING THE END OF A TUBULAR TREATMENT DEVICE

(57) 1. Aparāts, kas satur blīvējumu ar vairākiem blīvēšanas elementiem (2, 2', 2'', 2''', 2''''), kas izvietoti ap centra atveri gredzenveida konfigurācijā, turklāt katrs blīvēšanas elements satur blīvēšanas virsmu (15, 15'), kas vērsta pret centra atveri, un ar vismaz vienu kameru (13, 13''') blīvēšanas elementu (2, 2', 2'', 2''', 2''') sekciju (12) uzņēšanai, kas raksturīgs ar to, ka blīvējums satur ievadu (14, 14'') uz fluīda avotu, lai fluīdu ievadītu vismaz vienā kamerā (13, 13'') un ģenerētu pārspiedienu, kas iedarbojas uz blīvēšanas elementu sekcijām (12), kas uzņemtas vismaz vienā kamerā (13, 13'''), un pārvieto blīvēšanas elementu blīvēšanas virsmas virzienā uz centra atveri.

2. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka blīvēšanas elementam (2, 2', 2'', 2''', 2''') ir ieliekta līklīnijas formas blīvēšanas virsma (15, 15').

3. Aparāts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka blīvējums satur blakus esošus blīvēšanas elementus (2''''') ar malām (19'''''), kas izveidotas, lai daļēji pārklātu viena otru.

4. Aparāts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka blīvējums satur vismaz divus blīvēšanas elementu (2''') slāņus, kas izvietoti viens uz otra tā, ka augšējā slāņa blīvēšanas elementi (2''') ir izvietoti tā, lai pārklātu vismaz divus apakšējā slāņa blīvēšanas elementus.

5. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka blīvējums satur:

vismaz divus blīvēšanas elementu (2, 2') slāņus un dzesēšanas elementu (20'), kas uzmontēts starp vismaz diviem blīvēšanas elementu (2, 2') slāņiem, turklāt dzesēšanas elements (20') satur dzesēšanas kanālu (16) dzesēšanas fluīda caurplūdei caur dzesēšanas elementu.

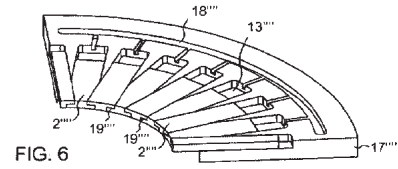
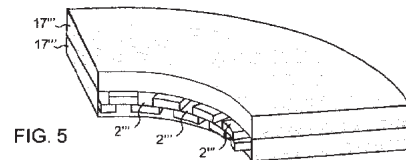
6. Aparāts saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pirmā slāņa blīvēšanas elementu (2') blīvēšanas virsmu (15') liekuma rādiuss ir atšķirīgs no blīvēšanas elementu (2) blīvēšanas virsmu (15) liekuma rādiusa otrajā slānī.

7. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka aparāts satur krāsni (6) stikla sagataves (3) uzkaršēšanai tādā veidā, ka stikla sagatave var tikt izstiepta optiskās šķiedras formā (7), turklāt krāsns satur vertikālu centrālo urbumu (5) ar tam apkārt esošiem sildelementiem (4), un blīvējums ir izvietots krāsns (6) augšpusē, lai noblīvētu krāsns iekštelpu (5) no apkārtējās vides.

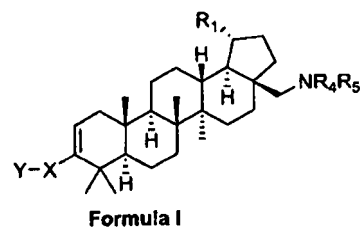
8. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka vismaz blīvēšanas elementu (2, 2') blīvēšanas virsmas (15, 15') ir izveidotas no grafitā vai stikla.

9. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka ieplūde (14) ir savienota ar inertās gāzes (11) avotu pārspiediena nodrošināšanai ar inertās gāzes palīdzību vismaz vienā kamerā (13), turklāt vismaz viena kamera (13) ir savstarpēji salāgota ar blīvēšanas elementa (2, 2') daļu, kas uzņemta vismaz vienā kamerā (13), ļaujot inertajai gāzei (11) vismaz no vienas kameras noplūst centra atverē gar blīvēšanas elementu.

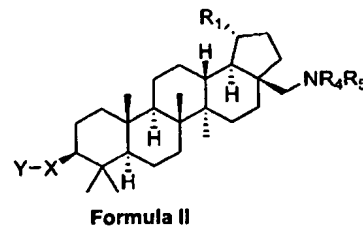
10. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka aparāts satur ierīci (22) blīvēšanas elementu spiešanai un pārvietošanai prom no centra atveres.



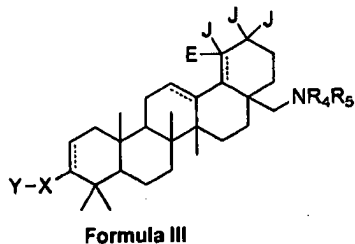
- (51) **C07J 63/00**^(2006.01) (11) **2670764**
A61K 31/56^(2006.01)
A61P 31/18^(2006.01)
 (21) 12702946.0 (22) 27.01.2012
 (43) 11.12.2013
 (45) 02.09.2015
 (31) 201161437870 P (32) 31.01.2011 (33) US
 (86) PCT/US2012/022847 27.01.2012
 (87) WO2012/106188 09.08.2012
 (73) Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US
 (72) REGUEIRO-REN, Alicia, US
 SWIDORSKI, Jacob, US
 SIT, Sing-Yuen, US
 CHEN, Yan, US
 CHEN, Jie, US
 MEANWELL, Nicholas A., US
 LIU, Zheng, US
 (74) Reitstötter - Kinzebach, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **C-3 MODIFICĒTAS BETULĪNSKĀBES ATVASINĀJUMU C-28 AMĪNI KĀ HIV NOBRIEŠANAS INHIBITORI**
C-28 AMINES OF C-3 MODIFIED BETULINIC ACID DERIVATIVES AS HIV MATURATION INHIBITORS
 (57) 1. Savienojums, ieskaitot tā farmaceutiski pieņemamus sāļus, kurš ir izvēlēts no grupas: savienojums ar formulu I:



savienojums ar formulu II:



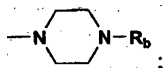
savienojums ar formulu III:



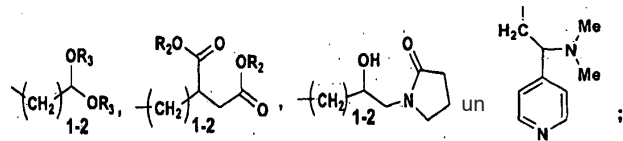
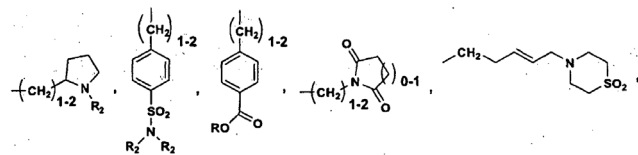
turklāt R_1 ir izopropenilgrupa vai izopropilgrupa, J un E ir neatkarīgi -H atoms vai $-CH_3$ grupa un E iztrūkst, ja tur ir divkāršā saite,

X ir fenilgrupa vai heteroarilgredzens, aizvietots ar A, turklāt A ir vismaz viens loceklis no grupas, kurā ietilpst -H un halogēna atoms, -hidroksilgrupa, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{1-6}$ alkoksigrupa un $-COOR_2$ grupa, R_2 ir -H atoms, -hidroksilgrupa, $-C_{1-6}$ alkilgrupa vai ar alkilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa vai ar arilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, Y ir izvēlēts no sekojošas grupas: $COOR_2$, $-C(O)NR_2SO_2R_3$, $-C(O)NHSO_2NR_2R_2$, $-NR_2SO_2R_2$, $-SO_2NR_2R_2$, $-C_{3-6}$ cikloalkil- $COOR_2$, $-C_{1-6}$ alkenil- $COOR_2$, $-C_{1-6}$ alkinil- $COOR_2$, $-C_{1-6}$ alkil- $COOR_2$, $-NHC(O)(CH_2)_n-COOR_2$, $-SO_2NR_2C(O)R_2$ grupa, -tetrazolgrupa un -CONHOH grupa, turklāt $n=1-6$;

R_3 ir $-C_{1-6}$ alkilgrupa vai ar alkilgrupu aizvietota C_{1-6} alkilgrupa, R_4 ir izvēlēts no sekojošas grupas: -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{3-6}$ cikloalkilgrupa, aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{1-6}$ alkilheteroarilgrupa, ar heteroarilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{1-6}$ alkil- NR_2R_7 , $-C_{1-6}$ alkil- $CONR_8R_9$, $-C_{3-6}$ cikloalkil- $CONR_8R_9$, $-C_{3-6}$ cikloalkil- $(CH_2)_{1-3}-NR_6R_7$, $-(CH_2)_{1-3}-C_{3-6}$ cikloalkil- NR_6R_7 , $-(CH_2)_{1-3}-C_{3-6}$ cikloalkil- $(CH_2)_{1-3}-NR_6R_7$, $-C_{1-6}$ alkil- Q_1 , C_{3-6} cikloalkil- Q_1 , $-COR_{10}$, $-SO_2R_3$ un $-SO_2NR_2R_2$ grupa; Q_1 ir -hidroksilgrupa, halogēna atoms, $-COOR_2$ vai $-SO_2R_a$ grupa, R_a ir C_{1-6} alkilgrupa, NR_2R_2 ,

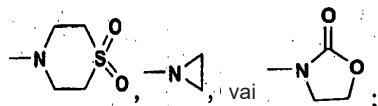


R_b ir -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-COR_3$, $-SO_2R_3$, $-SONR_3R_3$, R_4 arī var tikt izvēlēts no sekojošas grupas:



R_5 ir izvēlēts no sekojošas grupas: -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{3-6}$ cikloalkilgrupa, ar alkilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-COR_{10}$, $-SO_2R_3$ un $-SO_2NR_2R_2$,

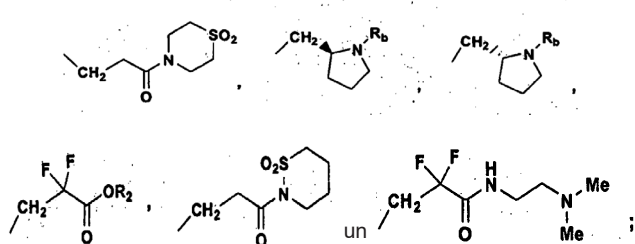
pie nosacījuma, ka tikai viens no R_4 un R_5 var būt izvēlēts no grupas, kurā ietilpst $-COR_{10}$, $-SO_2R_3$ un $-SO_2NR_2R_2$ grupas, vai R_4 un R_5 kopā ar blakusesošo N atomu veido ciklu, tādu kā:



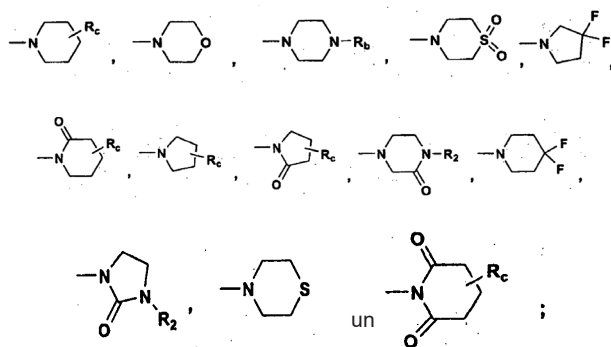
R_{10} ir izvēlēts no sekojošas grupas: -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{1-6}$ alkil- NR_6R_7 , $-NR_{11}R_{12}$, $-OR_{13}$, $-C_{1-6}$ alkil- Q_2 , $-C_{3-6}$ cikloalkil- Q_2 , aril- Q_2 , turklāt $n=1-6$,

turklāt Q_2 ir hidroksilgrupa, $-COOR_2$, halogēna atoms, $-SO_2R_a$, $-CONHSO_2R_3$, $-CONHSO_2NR_2R_2$,

R_{10} var tikt izvēlēts arī no sekojošas grupas:



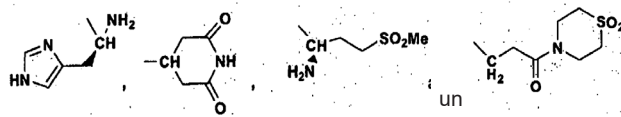
R_6 un R_7 ir neatkarīgi izvēlēti no sekojošas grupas: -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, aizvietota arilgrupa, aizvietota heteroarilgrupa un $-C_{1-6}$ alkil- Q_1 grupa, vai R_6 un R_7 kopā ar blakusesošo N atomu veido ciklu, kas izvēlēts no grupas:



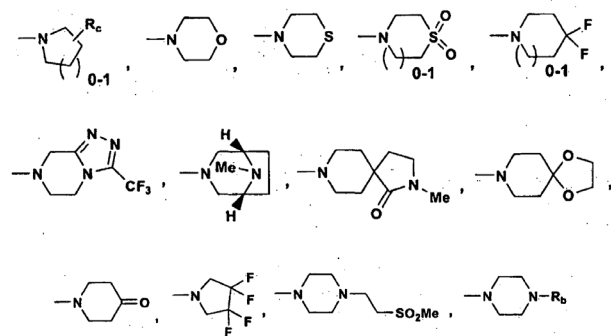
$R_c = C_{1-6}$ alkilgrupa, NR_2R_2 , $-COOR_3$ grupa,

R_8 un R_9 ir neatkarīgi izvēlēti no sekojošas grupas: -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{3-6}$ cikloalkilgrupa, aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{1-6}$ alkilheteroarilgrupa, ar heteroarilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{1-6}$ alkil- NR_2R_2 , C_{1-6} alkil- $CONR_2R_2$, $-C_{1-6}$ alkil- $CONR_2R_2$, $-C_{1-6}$ alkil- Q_1 , C_{3-6} cikloalkil- Q_1 grupa,

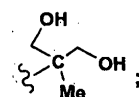
vai R_8 un R_9 arī var tikt neatkarīgi izvēlēti no sekojošas grupas:



vai R_8 un R_9 kopā ar blakusesošo N atomu veido ciklu, kas izvēlēts no grupas:

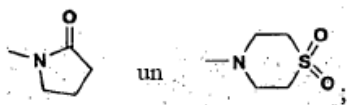


un



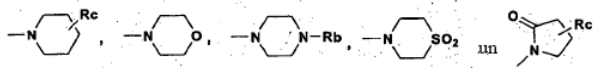
un R_{11} un R_{12} ir neatkarīgi izvēlēti no sekojošas grupas: -H atoms, $-C_{1-6}$ alkilgrupa, $-C_{3-6}$ cikloalkilgrupa un ar alkilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa,

vai R_{11} un R_{12} kopā ar blakusesošo N atomu veido ciklu, kas izvēlēts no sekojošas grupas



un R_{13} ir izvēlēts no sekojošas grupas: -H atoms, C_{1-6} alkilgrupa, ar alkilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa un $-C_{1-6}$ alkil- $NR_{14}R_{15}$, turklāt

R_{14} un R_{15} ir neatkarīgi izvēlēti no grupas: - C_{1-6} alkilgrupa un ar alkilgrupu aizvietota $-C_{1-6}$ alkilgrupa, vai R_{14} un R_{15} kopā ar blakusesošo N atomu veido ciklu, kas izvēlēts no sekojošas grupas:



2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais savienojums ir ar formulu I.

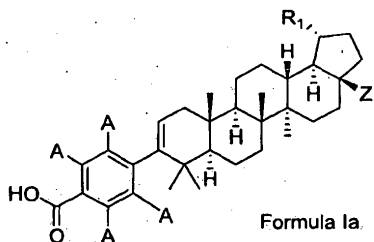
3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt X ir fenilgredzens un Y atrodas *para*-pozīcijā.

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt X ir aizvietots fenilgredzens.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt minētais fenilgredzens ir aizvietots ar A, un A ir vismaz viens loceklis, izvēlēts no -H atoma, -OH grupas un -F atoma.

6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt Y ir -COOH grupa.

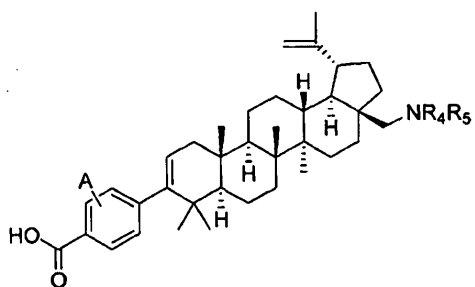
7. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt X ir fenilgredzens un Y ir -COOH grupa *para*-pozīcijā saskaņā ar formulu Ia:



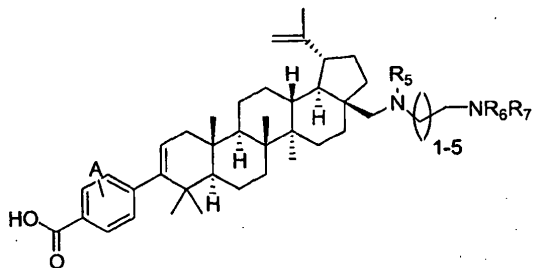
8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt A ir vismaz viens loceklis, izvēlēts no -H atoma, -OH grupas un -F atoma.

9. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt A ir -H vai -F atoms.

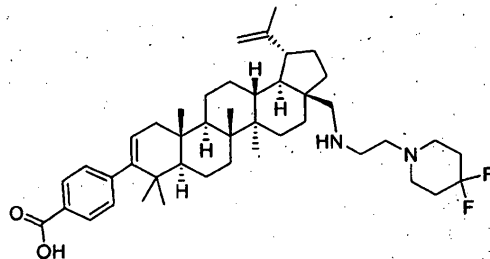
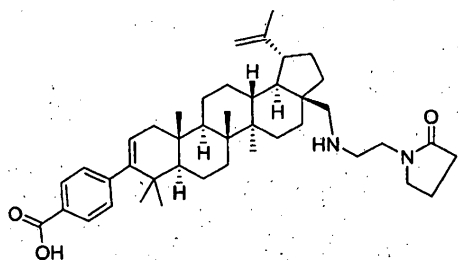
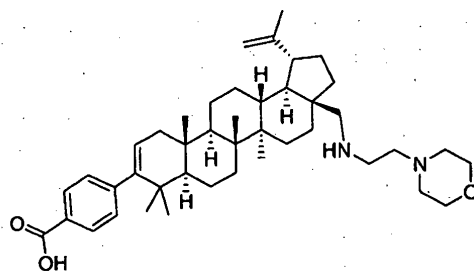
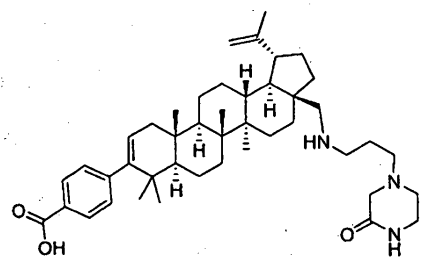
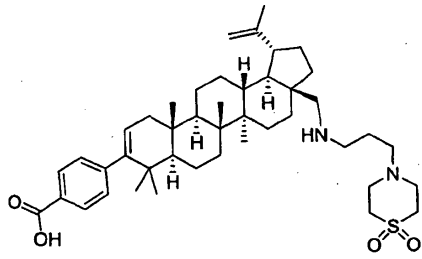
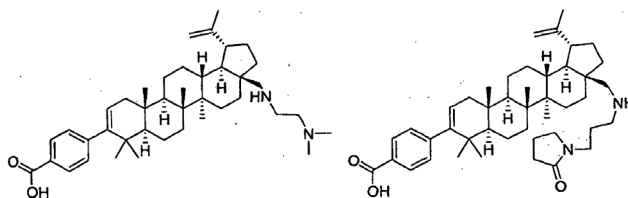
10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, ieskaitot tā farmaceutiski pieņemamus sāļus, kurš ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst:

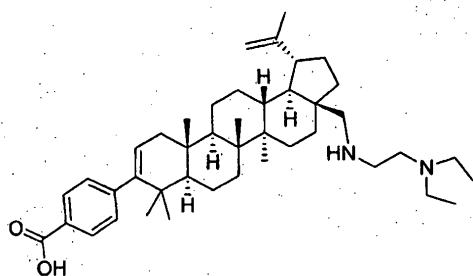
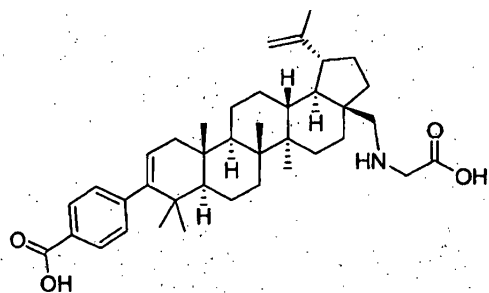
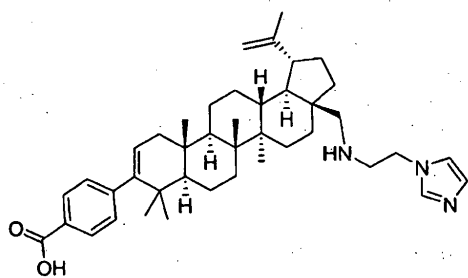
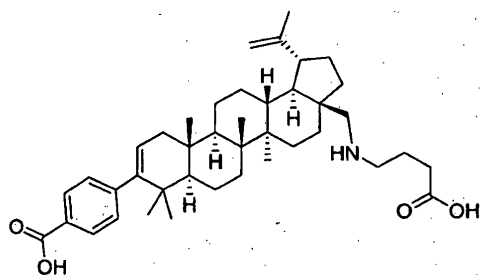
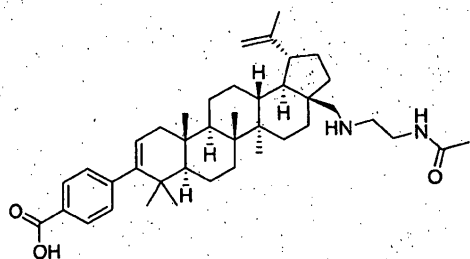
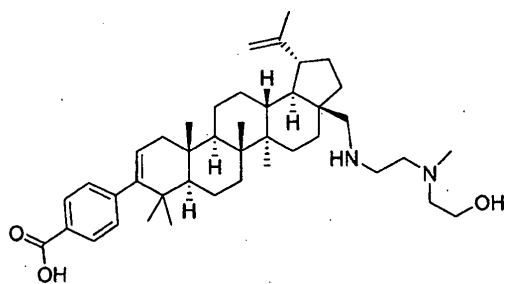
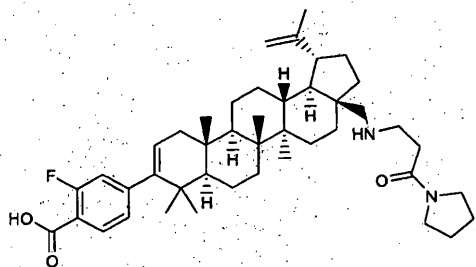
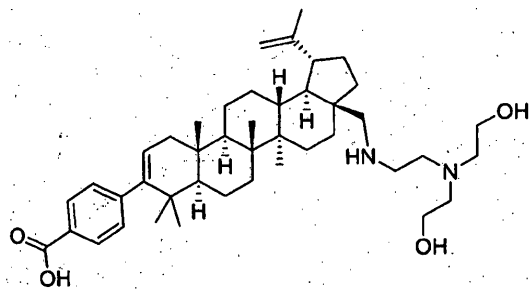
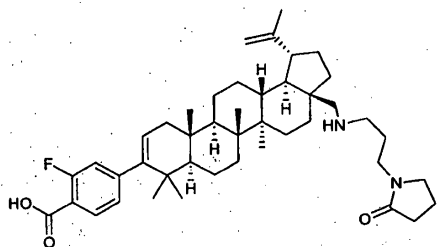
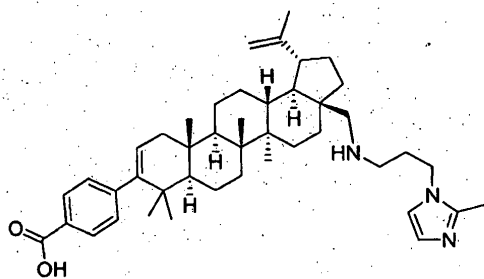
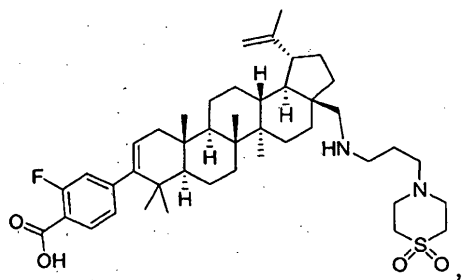


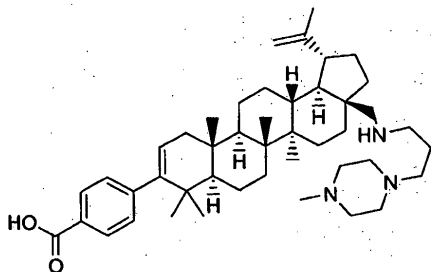
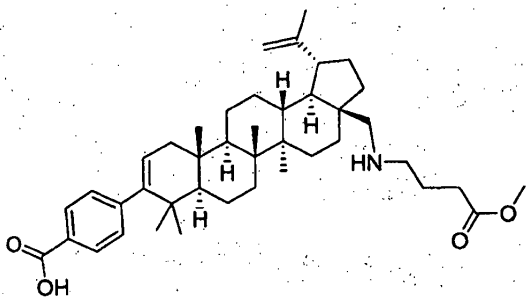
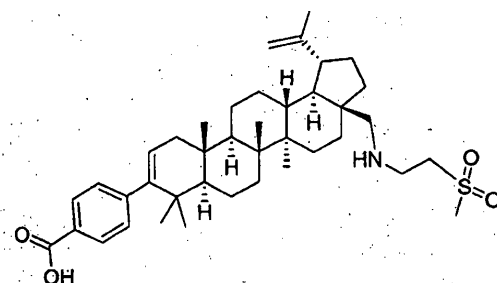
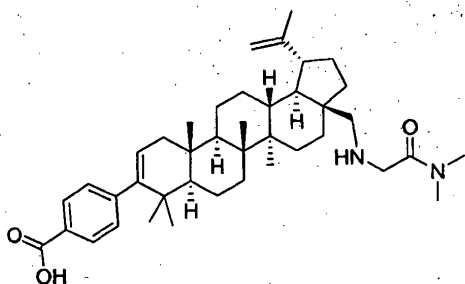
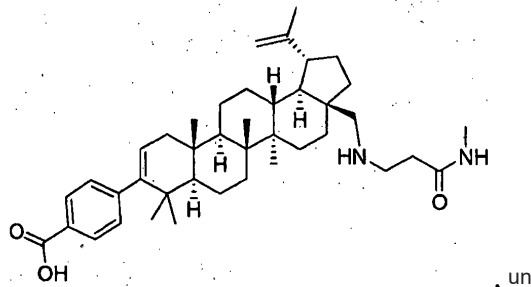
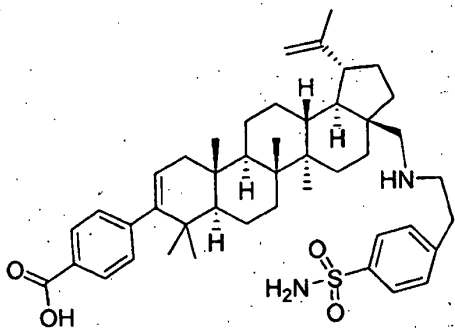
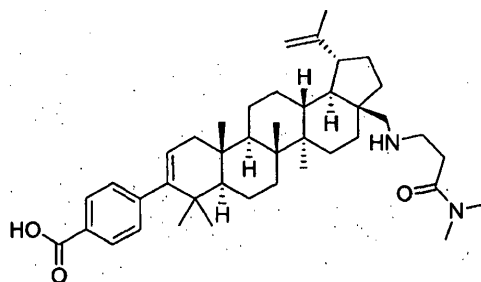
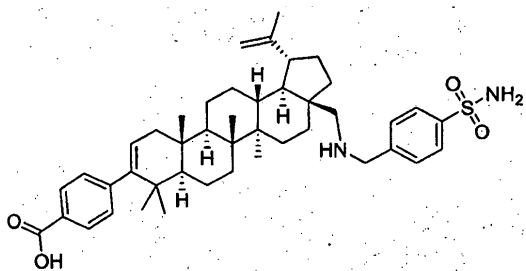
un



11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir izvēlēts no grupas, kurā ietilpst:







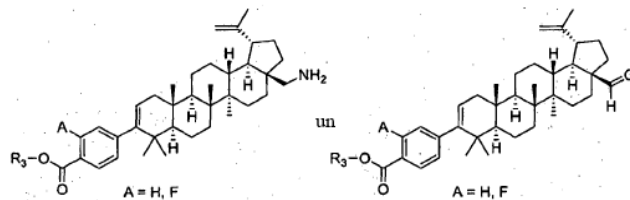
12. Farmaceutiska kompozīcija, kura ietver vienu vai vairāku savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai antivirāli efektīvu daudzumu kopā ar vienu vai vairākiem farmaceutiski pieņemamiem nesējiem, palīgvielām vai atšķaidītājiem.

13. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju, derīga HIV infekcijas ārstēšanai, kura ietver papildu AIDS ārstēšanas līdzekli, izvēlēta no sekojošas grupas, antivirāli efektīvu daudzumu:

- (a) AIDS pretvīrusu līdzeklis,
- (b) līdzeklis pret infekcijām,
- (c) imūnmodulators un
- (d) cits HIV iekļūšanas inhibitors.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai pielietošanai ar HIV vīrusu inficēta zīdītāja ārstēšanā.

15. Savienojums – starpprodukts, kurš ir izvēlēts no sekojošas grupas:



turklāt R₃ ir saskaņā ar 1. pretenziju.

(51) **A61K 9/00**^(2006.01)
A61K 31/00^(2006.01)
A61L 27/00^(2006.01)

(11) **2676658**

(21) 13184851.7
(43) 25.12.2013
(45) 16.09.2015

(22) 04.11.2009

(31) 0857575 (32) 07.11.2008 (33) FR

(62) EP09768146.4 / EP2349203

(73) Anteis SA, 18 Chemin des Aulx, 1228 Plan-Les-Ouates, CH

(72) GAVARD MOLLIARD, Samuel, FR

(74) Ricker, Mathias, et al, Wallinger Ricker Schlotter Tostmann, Patent- und Rechtsanwälte, Zweibrückenstrasse 5-7, 80331 München, DE
Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga, LV-1083, LV

(54) **TERMISKI STERILIZĒTA INJICĒJAMA HIALURONSKĀBES, POLIOLA(-U) UN LIDOKAĪNA KOMPOZĪCIJA**
HEAT-STERILISED INJECTABLE COMPOSITION OF HYALURONIC ACID, POLYOL(S) AND LIDOCAINE

(57) 1. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija gela formā, kuru lieto estētiskos nolūkos vai terapeitiskos nolūkos un kura ir balstīta uz šķērssašūtu hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, vienu vai vairākiem polioliem un uz lidokaīnu, un kas ir termiski sterilizēta.

2. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka šķērssašūtas hialuronskābes vai viena no tās sāļiem koncentrācija ir diapazonā no 0,01 līdz 100 mg/ml, un šķērssašūtas hialuronskābes vai viena no tās sāļiem molekulasmasa ir diapazonā no 1000 līdz 10×10^6 g/mol.

3. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka poliola koncentrācija ir diapazonā no 0,0001 līdz 100 mg/ml.

4. Injicējama ūdens kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka lidokaīna koncentrācija ir diapazonā no 0,0001 līdz 50 mg/ml.

5. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka gels, kas ir balstīts uz hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, ir šķērssašūts ar vai bez viena vai vairākiem dabiskas izcelsmes polisaharīdiem.

6. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka gels, kas ir balstīts uz hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, ir šķērssašūts ar bi- vai daudzfunkcionālām molekulām, kas izvēlētas no epoksīdiem, epihalogēnhidrīniem un divinilsulfona.

7. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka gels, kas ir balstīts uz hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, ir šķērssašūts ar 1,4-butāndiola diglicidilēteri (BDDE).

8. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka poliols ir izvēlēts no glicerīna, sorbitola, mannitola, propilēnglikola, eritritola, ksilitola, maltitola un laktitola.

9. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kuru lieto bioloģisko audu aizpildīšanai vai aizstāšanai, piemēram, grumbu aizpildīšanai, sejas rekonstruēšanai un lūpu apjoma palielināšanai.

10. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kuru lieto ādas rehidratācijai ar mezoterapijas palīdzību.

11. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kuru lieto, lai atdalītu, aizstātu vai aizpildītu bioloģiskos audus vai palielinātu minēto audu apjomu.

12. Injicējama ūdeni saturoša kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kuru lieto:

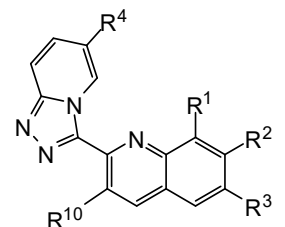
- reimatoloģijā kā sinoviālā šķidrums aizstājēvielu, pagaidu papildvielu;
- uroloģijā/ginekoloģijā kā vielu sfinktera apjoma vai urīnizvadkanāla apjoma palielināšanai;
- oftalmoloģijā kā adjuvantu kataraktas operācijā vai glaukomas ārstēšanā;
- farmācijā kā gelu aktīvo vielu atbrīvošanai;
- ķirurģijā kaulu rekonstrukcijai, balss saišu apjoma palielināšanai vai ķirurģisko audu ražošanai.

13. Process gela, kas ir balstīts uz šķērssašūtu hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, viskoelastīgo reoloģisko īpašību uzlabošanai, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver vienu vai vairāku poliolu un lidokaīna pievienošanu minētajam gelam, kurai seko termiska sterilizācija, kas uzlabo viskoelastīgās reoloģiskās gela īpašības salīdzinājumā ar gelu bez poliola un bez lidokaīna.

14. Process gela, kas ir balstīts uz šķērssašūtu hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, reoloģiskās stabilitātes paaugstināšanai laika gaitā, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver vienu vai vairāku poliolu un lidokaīna pievienošanu minētajam gelam, kurai seko termiska sterilizācija, kas laika gaitā uzlabo gela reoloģisko stabilitāti salīdzinājumā ar gelu bez poliola un bez lidokaīna.

15. Process gela, kas balstīts uz šķērssašūtu hialuronskābi vai vienu no tās sāļiem, *in vivo* paliekošās magnetizācijas paaugstināšanai, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver vienu vai vairāku poliolu un lidokaīna pievienošanu minētajam gelam, kurai seko termiska sterilizācija, kas uzlabo gela *in vivo* paliekošo magnetizāciju salīdzinājumā ar gelu bez poliola un bez lidokaīna.

- (51) **C07D 401/06**^(2006.01) (11) **2678329**
C07D 471/04^(2006.01)
C07D 519/00^(2006.01)
A61K 31/4709^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
- (21) 12716770.8 (22) 24.02.2012
(43) 01.01.2014
(45) 18.11.2015
(31) 201161446902 P (32) 25.02.2011 (33) US
(86) PCT/US2012/026572 24.02.2012
(87) WO2012/154274 15.11.2012
(73) Array Biopharma Inc., 3200 Walnut, Boulder, CO 80301, US
(72) BLAKE, James, F, US
DELISLE, Robert, Kirk, US
DE MEESE, Lisa, A., US
GRAHAM, James, M., US
LE HUEROU, Yvan, US
LYON, Michael, US
ROBINSON, John, E., US
WALLACE, Eli, M., US
WANG, Bin, US
XU, Rui, US
- (74) Office Freylinger, P.O. Box 48, 8001 Strassen, LU
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA,
Krišjāna Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **TRIAZOLPIRIDĪNA SAVIENOJUMI KĀ PIM KINĀZES INHIBITORI**
TRIAZOLOPYRIDINE COMPOUNDS AS PIM KINASE INHIBITORS
- (57) 1. Savienojums ar vispārīgo formulu (I):



un tā stereoizomēri, farmaceitiski pieņemami sāļi un solvāti, turklāt:

R¹ ir H atoms, halogēna atoms, CN grupa, OH grupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, fluor(C₁-C₆)alkilgrupa, difluor(C₁-C₆)alkilgrupa, trifluor(C₁-C₆)alkilgrupa, hidroksi(C₁-C₆)alkilgrupa, ciān(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₃)alkoksi(C₁-C₆)alkilgrupa (eventuāli aizvietota ar hidroksilgrupu), di(C₁-C₃)alkoksi(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, fluor(C₁-C₆)alkoksigrupa, difluor(C₁-C₆)alkoksigrupa, trifluor(C₁-C₆)alkoksigrupa, hidroksi(C₂-C₆)alkoksigrupa, ciān(C₁-C₆)alkoksigrupa, (C₁-C₃)alkoksi(C₂-C₆)alkoksigrupa, di(C₁-C₃)alkoksi(C₂-C₆)alkoksigrupa, (C₃-C₆)cikloalkilmetoksigrupa, oksetanilmetoksigrupa (eventuāli aizvietota ar metilgrupu), (C₁-C₆)alkilsulfanilgrupa, -C(=O)NR^aR^b, -CH₂C(=O)NR^cR^d vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kas eventuāli ir aizvietota ar -CH₂OH vai -CH₂O(C₁-C₄)alkilgrupu;

R^a, R^b, R^c un R^d ir neatkarīgi izvēlēti no H atoma un (C₁-C₄)alkilgrupas;

R² ir H atoms, halogēna atoms, CN grupa, OH grupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, fluor(C₁-C₆)alkilgrupa, difluor(C₁-C₆)alkilgrupa, trifluor(C₁-C₆)alkilgrupa, hidroksi(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₃)alkoksi(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa (eventuāli aizvietota ar (C₁-C₆)alkil-C(=O)O-, amino(C₁-C₆)alkil-C(=O)O- vai fenil(C=O)O-), fluor(C₁-C₆)alkoksigrupa, difluor(C₁-C₆)alkoksigrupa, trifluor(C₁-C₆)alkoksigrupa, hidroksi(C₂-C₆)alkoksigrupa, (C₁-C₃)alkoksi(C₂-C₆)alkoksigrupa, (C₃-C₆)cikloalkilmetoksigrupa, (C₃-C₆)cikloalkoksigrupa (eventuāli aizvietota ar OH grupu), oksetanilmetoksigrupa (eventuāli aizvietota ar metilgrupu), tetrahidropiranioksigrupa, (C₁-C₆)alkilsulfanil-

grupa, hidroksi(C₂-C₆)alkilsulfanilgrupa, (C₁-C₃)alkilsulfanil(C₂-C₆)alkoksigrupa, -COOH, hetAr¹, -C(=O)NR⁶R¹, -NR⁶C(=O)R¹, oksetanilgrupa vai ciklopropilgrupa, kas eventuāli ir aizvietota ar -CH₂OH vai -CH₂O(C₁-C₆)alkilgrupu; vai

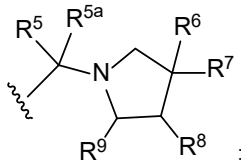
R¹ un R² kopā ar atomiem, kam tie pievienoti, veido 5- līdz 6-locekļu heterociklisku gredzenu ar 1 līdz 2 cikla heteroatomiem, kas neatkarīgi izvēlēti no O un N atoma, turklāt minētais cikls ir eventuāli aizvietots ar (C₁-C₄)alkilgrupu;

hetAr¹ ir 5- līdz 6-locekļu heteroarilgredzens ar vienu vai diviem gredzēna slāpekļa atomiem, kas eventuāli aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no (C₁-C₆)alkilgrupām;

R^e un R^f ir neatkarīgi H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa vai ciklopropilgrupa, kas eventuāli aizvietota ar (C₁-C₄)alkilgrupu;

R³ ir H atoms, halogēna atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa;

R⁴ ir:



R⁵ ir CF₃, CH₂F, CHF₂ grupa, metilgrupa vai etilgrupa;

R^{5a} ir H atoms vai metilgrupa; vai

R⁵ un R^{5a} kopā ar atomu, kam tie pievienoti, veido ciklopropilgrupas gredzenu;

R⁶ ir H atoms, NH₂ grupa, OH grupa, (C₁-C₆)alkil-NH-, fluor(C₁-C₆)alkil-NH-, hidroksi(C₁-C₆)alkil-NH-, (C₃-C₆)cikloalkil-CH₂NH-, (C₁-C₆)alkil)C(=O)NH-, (C₁-C₆)alkil)OC(=O)NH- (eventuāli aizvietota ar 5-metil-2-okso-1,3-dioksol-4-ilgrupu) vai amino(C₁-C₆)alkilgrupa;

R⁷ ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, fluor(C₁-C₆)alkilgrupa vai hidroksi(C₁-C₆)alkilgrupa; vai

R⁶ un R⁷ kopā ar atomu, kam tie pievienoti, veido 5- līdz 6-locekļu spirociklisku heterociklu ar gredzēna slāpekļa atomu;

R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa, vai

R⁶ un R⁸ kopā ar oglekļa atomiem, kuriem tie pievienoti, veido ciklopropilgrupas gredzenu, kas eventuāli aizvietots ar NH₂ grupu; R⁹ ir H atoms, vai

R⁶ un R⁹ kopā veido savienojosu grupu ar formulu -CH₂NH-, kas savieno oglekļa atomus, kuriem tie ir pievienoti; un

R¹⁰ ir H atoms vai halogēna atoms.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt R¹ ir izvēlēts no H atoma, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kas eventuāli aizvietota ar -CH₂OH vai -CH₂O(C₁-C₆)alkilgrupu, (C₁-C₆)alkoksigrupas, trifluor(C₁-C₆)alkoksigrupas, hidroksi(C₂-C₆)alkoksigrupas, (C₁-C₃)alkoksi(C₂-C₆)alkoksigrupas un (C₃-C₆)cikloalkilmetoksigrupas.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R¹ ir izvēlēts no H atoma, metilgrupas, etilgrupas, izopropilgrupas, *tert*-butilgrupas, ciklopropilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, izopropoksigrupas, trifluormetoksigrupas, 2-hidroksietoksigrupas, 2-hidroksipropoksigrupas, 3-hidroksipropoksigrupas, 2-metoksietoksigrupas, 3-metoksipropoksigrupas, 2-metoksipropoksigrupas, 3-metoksiprop-2-oksigrupas, 2-etoksietoksigrupas, 1,3-dimetoksiprop-2-iloksigrupas un ciklopropilmetoksigrupas.

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt R¹ ir H atoms.

5. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt R¹ ir (C₁-C₃)alkoksi(C₂-C₆)alkoksigrupa.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt R² ir izvēlēts no H atoma, (C₁-C₃)alkoksi(C₁-C₆)alkilgrupas, hidroksi(C₂-C₆)alkoksigrupas un (C₁-C₆)alkoksigrupas, kas eventuāli aizvietota ar (C₁-C₆)alkilC(=O)O- vai amino(C₁-C₆)alkil-C(=O)O-grupu.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt R² ir izvēlēts no H atoma, 2-metoksietoksigrupas, 3-metoksiprop-2-oksigrupas, 2-metoksipropoksigrupas, 2-etioksietoksigrupas un 2-hidroksietoksigrupas.

8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt R² ir H atoms.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt R³ ir H atoms.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt R³ ir F atoms.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, turklāt R⁵ ir CF₃, CH₂F, CHF₂ grupa, metilgrupa vai etilgrupa un R^{5a} ir H atoms.

12. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt R⁵ ir CF₃ grupa un R^{5a} ir H atoms.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, turklāt R⁶ ir izvēlēts no H atoma, NH₂, OH, CH₃NH-, (CH₃)₂CHNH-, FCH₂CH₂NH-, HOCH₂CH₂NH-, (ciklopropil)CH₂NH-, CH₃C(=O)NH-, (CH₃)₃COC(=O)NH- un NH₂CH₂-grupas.

14. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, turklāt R⁶ ir NH₂ grupa.

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, turklāt R⁷ ir H atoms.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, turklāt R⁸ ir H atoms.

17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai, turklāt R⁹ ir H atoms.

18. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai, turklāt R¹⁰ ir H atoms.

19. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai, turklāt R¹⁰ ir fluora atoms.

20. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas izvēlēts no jebkura no 1. līdz 328. piemēram.

21. Sastāvs, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 20. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu atšķaidītāju vai nesējvielu.

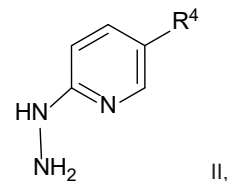
22. Savienojums saskaņā ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 20. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai iekaisīgas vai autoimūnas slimības ārstēšanā.

23. Savienojums saskaņā ar 22. pretenziju, turklāt iekaisīgā vai autoimūnā slimība ir multiplā skleroze, vilkēde, iekaisīga zarnu slimība vai reimatoīdais artrīts.

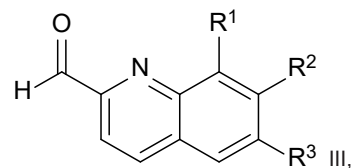
24. Savienojums saskaņā ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 20. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls lietošanai vēža ārstēšanā.

25. Process savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

(a) atbilstoša savienojuma ar formulu (II) vai tā aizsargāta atvasinājuma:

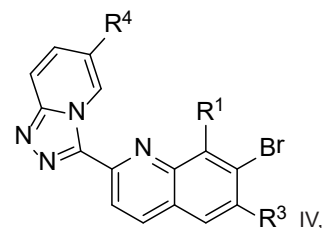


kur R⁴ ir, kā definēts formulai (I), apstrādi ar atbilstošu savienojumu (III) vai tā aizsargātu atvasinājumu:

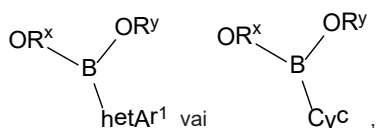


kur R¹, R² un R³ ir, kā definēts formulai (I), organiska hipervalenta joda reaģenta klātbūtnē; vai

(b) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir hetAr¹ vai ciklopropilgrupas gredzens, kas eventuāli aizvietots ar -CH₂OH vai -CH₂O(C₁-C₆)alkilgrupu, atbilstoša savienojuma ar formulu (IV) vai tā aizsargāta atvasinājuma:

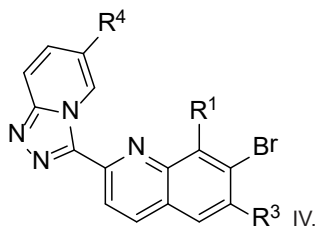


kur R¹, R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), pakļaušanu reakcijai ar reaģentu ar formulu attiecīgi:



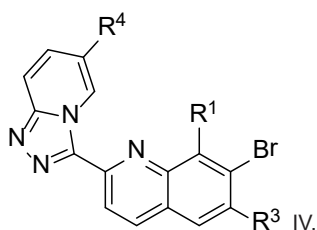
kur hetAr¹ ir, kā definēts formulai (I), Cyc ir ciklopropilgrupa, kas eventuāli aizvietota ar -CH₂OH vai -CH₂O(C₁-C₆)alkilgrupu, un R^x un R^y ir H atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa, vai R^x un R^y kopā ar atomiem, kam tie ir pievienoti, veido 5- līdz 6-locekļu gredzenu, kas eventuāli aizvietots ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no (C₁-C₃)alkilgrupām, turklāt minētā reakcija notiek pallādijs katalizatora klātbūtnē un eventuāli bāzes un liganda klātbūtnē; vai

(c) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir -NR^cC(=O)R^f grupa, atbilstoša savienojuma ar formulu (IV) vai tā aizsargāta atvasinājuma:



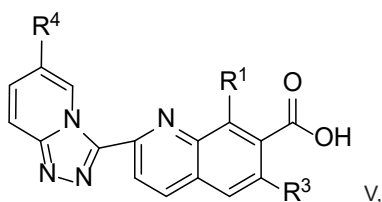
kur R¹, R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), pakļaušanu reakcijai ar reaģentu ar formulu HNR^cC(=O)R^f bāzes un metāla katalizatora klātbūtnē; vai

(d) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir (C₁-C₆)alkilsulfanilgrupa vai hidroksi(C₂-C₆)alkilsulfanilgrupa, atbilstoša savienojuma ar formulu (IV) vai tā aizsargāta atvasinājuma:



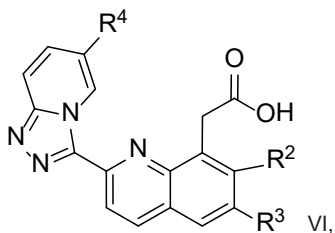
kur R¹, R², R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), apstrādi ar reaģentu ar formulu attiecīgi HS(C₁-C₆)alkilgrupa vai HS(C₁-C₆)alkil-OH bāzes klātbūtnē; vai

(e) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir -C(=O)NR^eR^f grupa, atbilstoša savienojuma ar formulu (V) vai tā aizsargāta atvasinājuma:



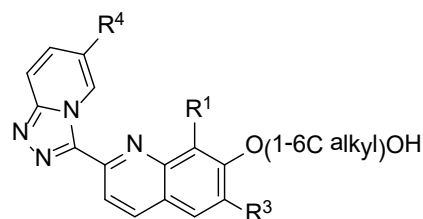
kur R¹, R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), savienojumu ar reaģentu ar formulu HNR^eR^f, kur R^e un R^f ir, kā definēts formulai (I), bāzes un savienojuma reaģenta klātbūtnē; vai

(f) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir -CH₂C(=O)NR^cR^d grupa, atbilstoša savienojuma ar formulu (VI) vai tā aizsargāta atvasinājuma:



kur R², R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), savienojumu ar reaģentu ar formulu HNR^cR^d, kur R^c un R^d ir, kā definēts formulai (I), bāzes un savienojuma reaģenta klātbūtnē; vai

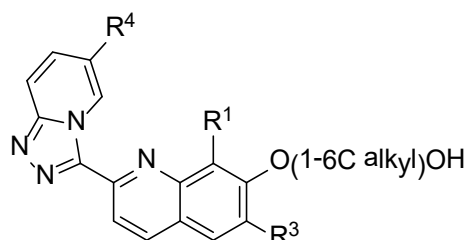
(g) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir (C₁-C₆)alkoksigrupa, kas aizvietota ar (C₁-C₆)alkilC(=O)O-grupu, atbilstoša savienojuma ar formulu (VII) vai tā aizsargāta atvasinājuma:



VII,

kur R¹, R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), savienojumu ar (C₁-C₆)alkilkarbonskābes anhidrīdu vai (C₁-C₆)alkilkarbonskābes hlorīdu bāzes klātbūtnē; vai

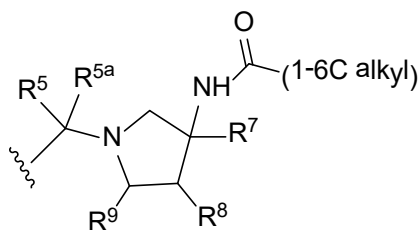
(h) savienojumam ar formulu (I), kur R² ir (C₁-C₆)alkoksigrupa, kas aizvietota ar amino(C₁-C₆)alkil-C(=O)O-grupu, atbilstoša savienojuma ar formulu (VII) vai tā aizsargāta atvasinājuma:



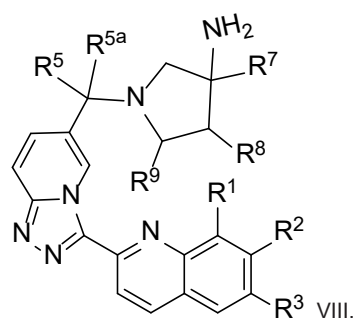
VII,

kur R¹, R³ un R⁴ ir, kā definēts formulai (I), savienojumu ar savienojumu ar formulu P¹NH(C₁-C₆)alkilC(=O)OH, kur P¹ ir H atoms vai amīna aizsarggrupa, bāzes un savienojuma reaģenta klātbūtnē; vai

(i) savienojumam ar formulu (I), kur R⁴ ir atlikums ar struktūru:



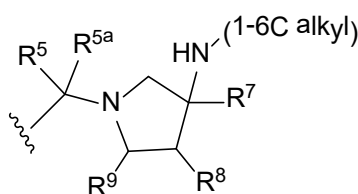
kur R⁵, R^{5a} un R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa un R⁹ ir H atoms, atbilstoša savienojuma ar formulu (VIII):



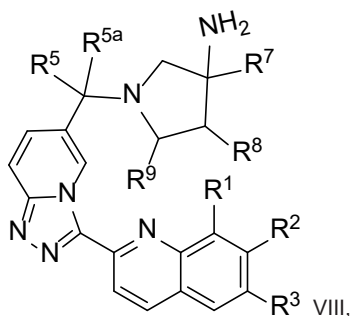
VIII,

kur R¹, R², R³, R⁵, R^{5a} un R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa un R⁹ ir H atoms, pakļaušanu reakcijai ar (C₁-C₆)alkilkarbonskābes anhidrīdu vai (C₁-C₆)alkilkarbonskābes hlorīdu bāzes klātbūtnē; vai

(j) savienojumam ar formulu (I), kur R⁴ ir atlikums ar struktūru:

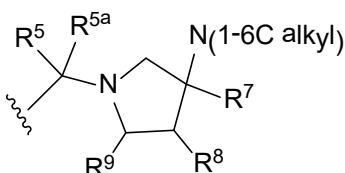


kur R⁵, R^{5a} un R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa un R⁹ ir H atoms, atbilstoša savienojuma ar formulu (VIII):

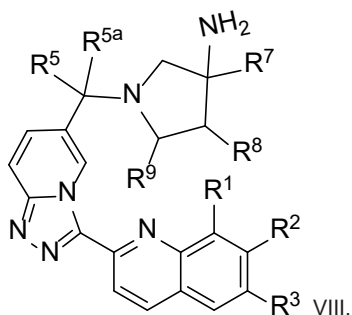


kur R¹, R², R³, R⁵, R^{5a} un R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa un R⁹ ir H atoms, pakļaušanu reakcijai ar (C₁-C₆)aldehīdu vai aizsargātu (C₁-C₆)aldehīdu katalizatora un bāzes klātbūtnē, kurai seko apstrāde ar reducētāju; vai

(k) savienojumam ar formulu (I), kur R⁴ ir atlikums ar struktūru:

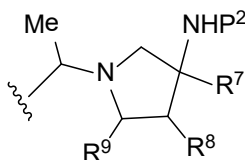


kur R⁵, R^{5a} un R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa un R⁹ ir H atoms, atbilstoša savienojuma ar formulu (VIII):

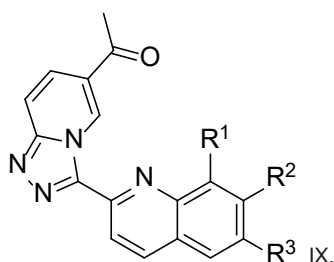


kur R¹, R², R³, R⁵, R^{5a} un R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa un R⁹ ir H atoms, pakļaušanu reakcijai ar reaģentu ar formulu HC=O(C₁-C₆)alkilgrupa un reducētāju; vai

(i) savienojumam ar formulu (I), kur R⁴ ir atlikums ar struktūru:

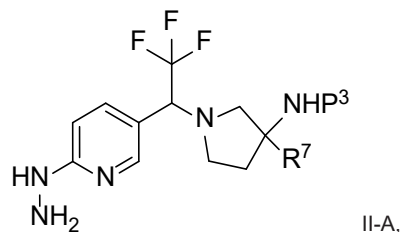


kur R⁷ ir, kā definēts formulai (I), R⁸ ir H atoms, halogēna atoms, OH grupa vai (C₁-C₆)alkoksigrupa, R⁹ ir H atoms un P² ir H atoms vai amīna aizsarggrupa, pakļaušanu reakcijai ar atbilstošu savienojumu ar formulu (IX):



kur R¹, R², un R³ ir, kā definēts formulai (I), Lūisa skābes klātbūtnē, kurai seko apstrāde ar reducētāju; un aizsarggrupu aizvākšanu un, ja nepieciešams, sāls veidošanu.

26. Savienojums ar formulu (II-A):



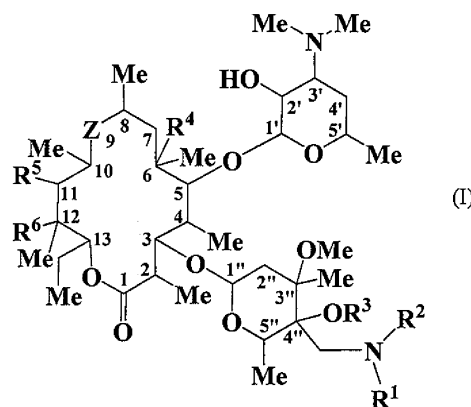
ieskaitot tā enantiomērus un diastereomērus, turklāt P³ ir H atoms vai amīna aizsarggrupa un R⁷ ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, fluor(C₁-C₆)alkilgrupa vai hidroksi(C₁-C₆)alkilgrupa.

27. Savienojums saskaņā ar 26. pretenziju, turklāt R⁷ ir H atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa.

28. Savienojums saskaņā ar 27. pretenziju, turklāt R⁷ ir H atoms vai metilgrupa.

- (51) **C07H 17/08**^(2006.01) (11) **2678349**
A61K 31/7048^(2006.01)
A61P 31/04^(2006.01)
- (21) 12749570.3 (22) 20.02.2012
(43) 01.01.2014
(45) 13.01.2016
(31) 2011034578 (32) 21.02.2011 (33) JP
(86) PCT/JP2012/054677 20.02.2012
(87) WO2012/115256 30.08.2012
(73) Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takada 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170-8633, JP
- (72) SUGIMOTO, Tomohiro, JP
SASAMOTO, Naoki, JP
KUROSAKA, Jun, JP
HAYASHI, Masato, JP
YAMAMOTO, Kanako, JP
KASHIMURA, Masato, JP
USHIKI, Yasunobu, JP
OGITA, Haruhisa, JP
MIURA, Tomoaki, JP
KANEMOTO, Kenichi, JP
KUMURA, Kou, JP
YOSHIDA, Satoshi, JP
TAMURA, Keiji, JP
SHITARA, Eiki, JP
- (74) Godemeyer Blum Lenze Patentanwälte, Partnerschaft mbB, werkpatent, An den Gärten 7, 51491 Overath, DE
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **C-4'' POZĪCIJĀ AIZVIETOTS MAKROLĪDA ATVASINĀJUMS**
C-4'' POSITION SUBSTITUTED MACROLIDE DERIVATIVE
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I):

[Formula 1]



turklāt formulā:

Me ir metilgrupa,

R¹ ir C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar vienu vai diviem aizvietotājiem, izvēlētiem no hidroksilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, aminogrupas, C₁₋₆alkilaminogrupas un grupas ar formulu -NR⁷⁸COR⁷⁹ vai formulu -NR⁸⁰SO₂R⁸¹, kurā R⁷⁸ un R⁸⁰, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa, un R⁷⁹ un R⁸¹, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir C₁₋₆alkilgrupa) vai C₁₋₆alkilsulfonilgrupa,

R² ir 4- līdz 8-locekļu piesātināta heterocikliska grupa (šī piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar vienu vai diviem aizvietotājiem, izvēlētiem no C₇₋₁₂aralkilgrupas un C₁₋₆alkilgrupas), C₁₋₆alkanoilgrupa (C₁₋₆alkanoilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C₁₋₆alkilaminogrupu) vai C₁₋₆alkilgrupa, kura var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 1. grupas, vai

R¹ un R² kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, var veidot 4- līdz 8-locekļu piesātinātu N atomu saturošu heterociklisku grupu (piesātinātā N atomu saturošā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no hidroksilgrupas, aminogrupas, C₁₋₆alkilaminogrupas un C₁₋₆alkilgrupas (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C₁₋₆alkilaminogrupu)),

aizvietotāju 1. grupa ir grupa, kura sastāv no C₁₋₆alkilsulfonilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, C₃₋₆cikloalkilgrupas, hidroksilgrupas, fenilgrupas (fenilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkoksigrupām), 4- līdz 8-locekļu piesātinātās heterocikliskas grupas (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkilgrupām) un grupas ar formulu -CONR⁸, ar formulu -SO₂NR⁹, ar formulu -NR¹¹COR¹², ar formulu -NR¹³CO₂R¹⁴, ar formulu -NR¹⁵SO₂R¹⁶ vai ar formulu -NR¹⁷R¹⁸,

R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ un R¹⁵, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa,

R¹² ir fenilgrupa (fenilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkoksigrupām),

R¹⁶ ir C₁₋₆alkoksigrupa vai fenilgrupa (fenilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkoksigrupām),

R¹⁷ un R¹⁸, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no hidroksilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas un C₃₋₆cikloalkilgrupas), C₂₋₆alkenilgrupa, C₃₋₆cikloalkilgrupa, C₁₋₆alkanoilgrupa, C₇₋₁₂aralkilgrupa (C₇₋₁₂aralkilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkoksigrupām) vai heteroalkilgrupa (heteroalkilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkoksigrupām), vai

R¹⁷ un R¹⁸ kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, var veidot 4- līdz 8-locekļu piesātinātu N atomu saturošu heterociklisku grupu, kura var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 2. grupas, vai 6-locekļu daļēji piesātinātu N atomu saturošu heterociklisku grupu, kura var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 2. grupas,

aizvietotāju 2. grupa ir grupa, kura sastāv no hidroksilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, oksogrupas, C₁₋₆alkoksiiminogrupas, aminogrupas, C₁₋₆alkilaminogrupas, grupas ar formulu -CONR¹⁹R²⁰ (R¹⁹ un R²⁰ var būt vienādi vai atšķirīgi, tie ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa), C₁₋₆halogēnalkilgrupas un C₁₋₆alkilgrupas (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no hidroksilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, aminogrupas un C₁₋₆alkilaminogrupas),

R³ ir H atoms vai

R³ un R¹ kopā var veidot karbonilgrupu,

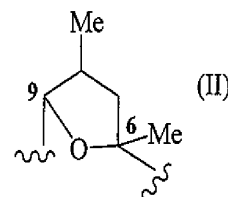
R⁴ ir hidroksilgrupa, C₁₋₆alkilgrupa vai grupa ar formulu OCONR²¹R²² (R²¹ un R²² var būt vienādi vai atšķirīgi, tie ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa vai C₂₋₆alkenilgrupa, aizvietota ar vienu heteroarilgrupu),

Z ir grupa ar formulu CHR²³ (R²³ ir hidroksilgrupa vai aminogrupa), ar formulu C(=O) vai ar formulu C(=N-OR²⁴),

R²⁴ ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar C₁₋₆alkoksigrupu, aminogrupu vai C₁₋₆alkilaminogrupu) vai 4- līdz 8-locekļu piesātināta heterocikliska grupa, vai

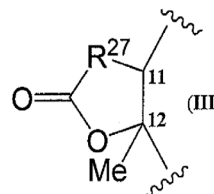
R²⁴ un Z kopā ar C atomiem, pie kuriem tie pievienoti, var veidot ciklisku struktūru ar formulu (II):

[Formula 2]



R⁵ un R⁶ kopā ar C atomiem, pie kuriem tie pievienoti, var veidot ciklisku struktūru ar formulu (III):

[Formula 3]



R²⁷ ir O atoms vai grupa ar formulu CHR²⁸ vai ar formulu NR²⁹,

R²⁸ ir H atoms, ciāngrupa vai C₁₋₆alkilsulfanilgrupa (C₁₋₆alkilsulfanilgrupa var būt aizvietota ar heteroarilgrupu, kura var būt aizvietota ar vienu aminogrupu),

R²⁹ ir H atoms, hidroksilgrupa, C₁₋₆alkoksigrupa (C₁₋₆alkoksigrupa var būt aizvietota ar fenilgrupu), 4- līdz 8-locekļu piesātināta heterocikliska grupa (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar C₁₋₆alkilsulfonilgrupu vai difenilmetilgrupu), grupa ar formulu -NR³⁰R³¹, ar formulu -NR³²CONR³³R³⁴, ar formulu -NR³²CO₂R³⁵, ar formulu -NR³²COR³⁵, ar formulu -NR³²SO₂R³⁷, ar formulu -NR³²CONR³⁸R³⁹, ar formulu -NR³²SO₂NR⁴⁰R⁴¹, ar formulu -N=C-NR⁴²R⁴³ vai C₁₋₆alkilgrupa, kura var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 3. grupas,

R³⁰ un R³¹, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar C₁₋₆alkilsulfonilgrupu, fenilgrupu vai heteroarilgrupu),

R³², R³³, R³⁴, R³⁷, R⁴⁰, R⁴¹, R⁴² un R⁴³, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa,

R³⁵ ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa vai C₇₋₁₂aralkilgrupa,

R³⁶ ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar C₁₋₆alkilsulfonilgrupu) vai C₇₋₁₂aralkilgrupa,

R³⁸ un R³⁹, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar C₃₋₆cikloalkilgrupu), C₂₋₆alkenilgrupa, C₇₋₁₂aralkilgrupa (C₇₋₁₂aralkilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no halogēna atoma, C₁₋₆alkilgrupas un C₁₋₆alkoksigrupas) vai heteroalkilgrupa,

aizvietotāju 3. grupa ir grupa, kura sastāv no hidroksilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, C₃₋₆cikloalkoksigrupas, C₁₋₆alkilsulfanilgrupas, C₁₋₆alkilsulfonilgrupas, C₁₋₅alkilsulfonilgrupas, fenilgrupas, fenoksigrupas, benziloksigrupas, fenilsulfanilgrupas, fenilsulfonilgrupas, ciāngrupas, C₇₋₁₂aralkilgrupas, 4- līdz 8-locekļu piesātinātās heterocikliskas grupas (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar C₁₋₆alkilsulfonilgrupu vai difenilmetilgrupu), heteroarilgrupas (heteroarilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no C₁₋₆alkilgrupas, C₇₋₁₂aralkilgrupas, fenilgrupas un heteroarilgrupas), un grupas ar formulu -NR⁴⁴CO₂R⁴⁵, ar formulu -OSO₂NR⁴⁶R⁴⁷, ar formulu -NR⁴⁹SO₂NR⁵⁰R⁵¹, ar formulu -CONR⁵²SO₂NR⁵³R⁵⁴, ar formulu -OCONR⁵⁵R⁵⁶, ar formulu -NR⁵⁷COR⁵⁸, ar formulu -CONR⁵⁹R⁶⁰, ar formulu -NR⁶¹CONR⁶²R⁶³, ar formulu -OCOR⁶⁴, ar formulu -SO₂NR⁶⁵R⁶⁶, ar formulu -NR⁶⁷SO₂R⁶⁸, ar formulu -NR⁶⁹R⁷⁰ vai ar formulu -CONR⁷¹SO₂R⁷²,

R⁴⁴ līdz R⁵⁷, R⁶¹, R⁶⁷, R⁷¹ un R⁷², kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa,

R⁵⁸ ir C₁₋₆alkilgrupa, C₁₋₆halogēnalkilgrupa vai fenilgrupa,

R⁵⁹ un R⁶⁰, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa, fenilgrupa, C₇₋₁₂aralkilgrupa vai heteroarilgrupa,

R⁶² un R⁶³, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C₁₋₆alkilaminogrupu),

R⁶⁴ ir C₁₋₆alkilgrupa vai fenilgrupa,

R⁶⁵ un R⁵⁶, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa vai fenilgrupa,

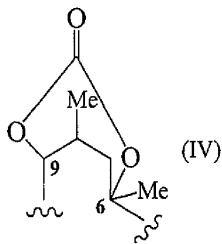
R⁶⁸ ir C₁₋₆alkilgrupa, C₁₋₆halogēnalkilgrupa, C₃₋₆cikloalkilgrupa, fenilgrupa (fenilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no C₁₋₆alkilgrupas, C₁₋₆alkilsulfonilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, ciāngrupas un karboksilgrupas) vai heteroarilgrupa, kura var būt aizvietota ar 1 līdz 3 C₁₋₆alkilgrupām,

R⁶⁹ un R⁷⁰, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa, fenilgrupa, heteroarilgrupa, kura var būt aizvietota ar vienu ciāngrupu, C₇₋₁₂aralkilgrupu vai heteroarilgrupu, vai arī

R⁶⁹ un R⁷⁰ kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, veido 4- līdz 8-locekļu piesātinātu N atomu saturošu heterociklisku grupu (piesātinātā N atomu saturošā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no C₁₋₆alkilgrupas un oksogrupas),

ja R²⁷ ir O atoms, R⁴ un Z kopā ar C atomiem, pie kuriem tie pievienoti, var veidot ciklisku struktūru ar formulu (IV):

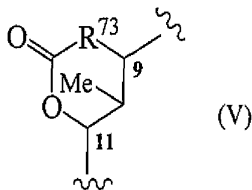
[Formula 4]



vai

R⁵ un Z kopā var veidot ciklisku struktūru ar formulu (V):

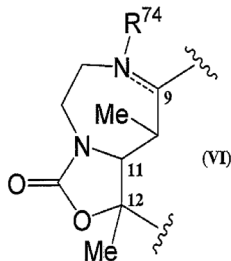
[Formula 5]



R⁷³ ir O atoms vai grupa ar formulu NH, vai

R⁵, R⁶ un Z kopā var veidot ciklisku struktūru ar formulu:

[Formula 6]

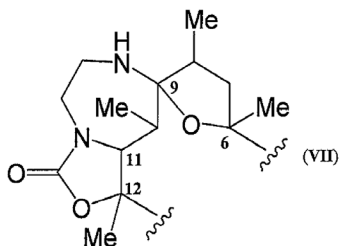


kur dubultā saite ar ietvertu pārtraukto līniju nozīmē vienkāršo saiti vai dubultsaiti, un

R⁷⁴ ir klātesošs tikai tad, ja dubultsaite ar pārtraukto līniju ir vienkārša saite un apzīmē H atomu, vai

R⁵, R⁶ un Z kopā var veidot ciklisku struktūru ar formulu (VII):

[Formula 7]



vai tā sāls, hidrāts vai solvāts.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R¹ ir C₁₋₆alkilgrupa vai C₁₋₆alkilsulfonilgrupa,

R² ir 4- līdz 8-locekļu piesātinātā heterocikliskā grupa (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar vienu vai diviem aizvietotājiem, izvēlētiem no C₇₋₁₂aralkilgrupas un C₁₋₆alkilgrupas), C₁₋₆alkanoilgrupa (C₁₋₆alkanoilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C₁₋₆alkilaminogrupu) vai C₁₋₆alkilgrupa, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 1. grupas, vai

R₁ un R₂ kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, var veidot 4- līdz 8-locekļu piesātinātu N atomu saturošu heterociklisku grupu (piesātinātā N atomu saturošā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no hidroksilgrupas, aminogrupas, C₁₋₆alkilaminogrupas un C₁₋₆alkilgrupas (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C₁₋₆alkilaminogrupu)), un

R³⁸ un R³⁹, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms, C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar C₃₋₆cikloalkilgrupu), C₇₋₁₂aralkilgrupa (C₇₋₁₂aralkilgrupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no halogēna atoma, C₁₋₆alkilgrupas un C₁₋₆alkoksigrupas) vai heteroalkilgrupa.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R² ir C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 1. grupas.

4. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R² ir C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 4. grupas, un aizvietotāju 4. grupa ir grupa, kura sastāv no hidroksilgrupas un grupas ar formulu -NR¹⁷R¹⁸.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R¹⁷ un R¹⁸, kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C₁₋₆alkilgrupa (C₁₋₆alkilgrupa var būt aizvietota ar C₃₋₆cikloalkilgrupu).

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R²⁷ ir grupa ar formulu NR²⁹.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R²⁹ ir H atoms, grupa ar formulu -NR³⁰R³¹, ar formulu -NR³²CO₂R³⁵, ar formulu -NR³²SO₂R³⁷, ar formulu -NR³²CONR³⁸R³⁹, ar formulu -NR³²SO₂NR⁴⁰R⁴¹ vai C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 3. grupas.

8. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R²⁹ ir C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 5. grupas, un aizvietotāju 5. grupa ir grupa, kura sastāv no hidroksilgrupas, C₁₋₆alkilsulfonilgrupas, 4- līdz 8-locekļu piesātinātās heterocikliskas grupas (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar C₁₋₆alkilsulfonilgrupu) un grupas ar formulu -OSO₂NR⁴⁶R⁴⁷, ar formulu -NR⁴⁹SO₂NR⁵⁰R⁵¹, ar formulu -CONR⁵⁹R⁶⁰, ar formulu -SO₂NR⁶⁵R⁶⁶, ar formulu -NR⁶⁷SO₂R⁶⁸ vai formulu -NR⁶⁹R⁷⁰.

9. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R²⁹ ir C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 6. grupas, un aizvietotāju 6. grupa ir grupa, kura sastāv no C₁₋₆alkilsulfonilgrupas, un grupas ar formulu -OSO₂NR⁴⁶R⁴⁷, ar formulu -SO₂NR⁶⁵R⁶⁶ vai ar formulu -NR⁶⁷SO₂R⁶⁸.

10. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R²⁹ ir C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar C₁₋₆alkilsulfonilgrupu.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R¹ ir C₁₋₆alkilgrupa.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R⁴ ir hidroksilgrupa vai C₁₋₆alkoksigrupa.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R⁴ ir metoksigrupa.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R³ ir H atoms.

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt Z ir grupa ar formulu C(=O) vai grupa ar formulu C(=N-OR²⁴).

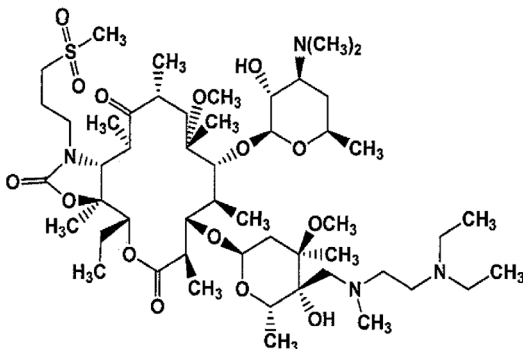
16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt Z ir grupa ar formulu C(=O).

17. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R¹ ir C₁₋₆alkilgrupa un turklāt R² ir C₁₋₆alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 4. grupas, un aizvietotāju 4. grupa sastāv no hidroksilgrupas un grupas

ar formulu $-NR^{17}R^{18}$, un turklāt R^{17} un R^{18} , kuri var būt vienādi vai atšķirīgi, ir H atoms vai C_{1-6} alkilgrupa (C_{1-6} alkilgrupa var būt aizvietota ar C_{3-6} cikloalkilgrupu), un turklāt R^{27} ir grupa ar formulu NR^{29} un R^{29} ir C_{1-6} alkilgrupa, aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 5. grupas, un aizvietotāju 5. grupa ir grupa, kura sastāv no hidroksilgrupas, C_{1-6} alkilsulfonilgrupas, 4- līdz 8-locekļu piesātinātas heterocikliskas grupas (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar C_{1-6} alkilsulfonilgrupu), un grupas ar formulu $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, ar formulu $-NR^{48}SO_2NR^{50}R^{51}$, ar formulu $-CONR^{59}R^{60}$, ar formulu $-SO_2NR^{65}R^{66}$, ar formulu $-NR^{67}SO_2NR^{68}$ vai ar formulu $-NR^{69}R^{70}$.

18. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu:

[Formula 8]

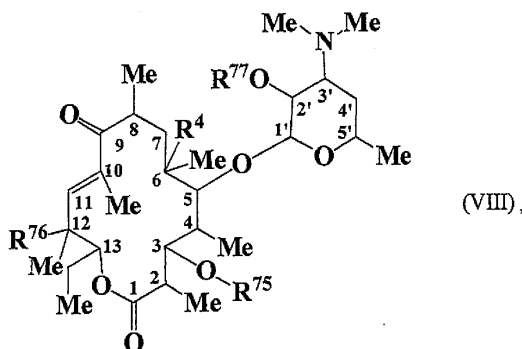


vai tā sāls, hidrāts vai solvāts.

19. Medikaments, kas kā aktīvo vielu satur vielu, izvēlētu no grupas, kura sastāv no savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai, tā sāls, hidrāta un solvāta.

20. Medikaments saskaņā ar 19. pretenziju, kurš tiek lietots infekcijas slimības profilaksē un/vai ārstēšanā.

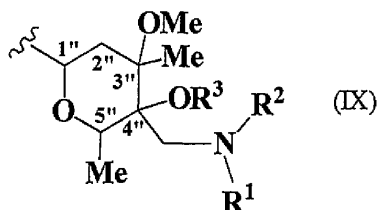
21. Savienojums ar formulu (VIII):



turklāt formulā:

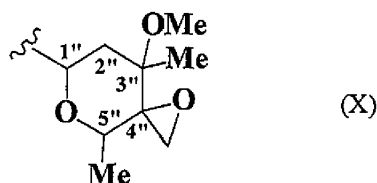
R^{75} ir grupa ar formulu (IX):

[Formula 9]



vai grupa ar formulu (X):

[Formula 10]

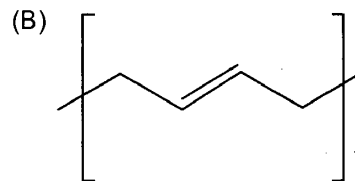
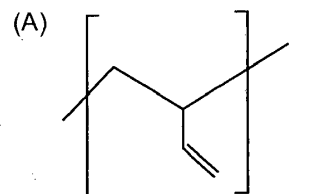


R^{76} ir hidroksilgrupa vai imidazolilkarboniloksigrupa, R^{77} ir H atoms vai hidroksilgrupas aizsarggrupa, un R^1 , R^2 , R^3 un R^4 ir tādi paši, kā definēts 1. pretenzijā, vai tā sāls, hidrāts vai solvāts.

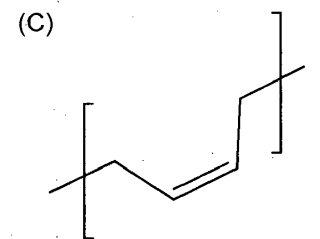
22. Savienojums saskaņā ar 21. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R^1 ir C_{1-6} alkilgrupa vai C_{1-6} alkilsulfonilgrupa un R^2 ir 4- līdz 8-locekļu piesātinātā heterocikliska grupa (piesātinātā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar vienu vai diviem aizvietotājiem, izvēlētiem no C_{7-12} aralkilgrupas un C_{1-6} alkilaminogrupas), C_{1-6} alkanoilgrupa (C_{1-6} alkanoilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C_{1-6} alkilaminogrupu) vai C_{1-6} alkilgrupa, kas var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no aizvietotāju 1. grupas, vai R^1 un R^2 kopā ar N atomu, pie kura tie pievienoti, var veidot 4- līdz 8-locekļu piesātinātu N atomu saturošu heterociklisku grupu (piesātinātā N atomu saturošā heterocikliskā grupa var būt aizvietota ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, izvēlētiem no hidroksilgrupas, aminogrupas, C_{1-6} alkilaminogrupas un C_{1-6} alkilgrupas (C_{1-6} alkilgrupa var būt aizvietota ar aminogrupu vai C_{1-6} alkilaminogrupu)).

23. Savienojums saskaņā ar 21. vai 22. pretenziju vai tā sāls, hidrāts vai solvāts, turklāt R^{77} ir trimetilsililgrupa, trietilsililgrupa, *t*-butildimetilsililgrupa, acetilgrupa, propionilgrupa, benzoilgrupa, benziloksikarbonilgrupa vai *t*-butiloksikarbonilgrupa.

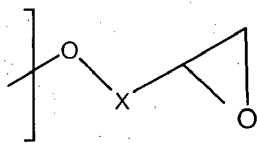
- (51) **C08C 19/06**^(2006.01) (11) **2679605**
- (21) 12174420.5 (22) 29.06.2012
- (43) 01.01.2014
- (45) 14.10.2015
- (73) Evonik Degussa GmbH, Rellinghauser Straße 1- 11, 45128 Essen, DE
- (72) BERLINEANU, Andreas, DE
- HABERKORN, Niko, DE
- (74) Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **POLIBUTADIĒNS AR EPOKSIGRUPĀM**
POLYBUTADIENE WITH EPOXY GROUPS
- (57) 1. Polibutadiēns ar epoksigrupām, turklāt polibutadiēns satur šādas no 1,3-butadiēna atvasinātas monomēru vienības:



un



turklāt A daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 10 līdz 60 molprocentiem; un turklāt B un C daļu summa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 40 līdz 90 molprocentiem; turklāt epoksigrupas ir ar formulu (I):



un X apzīmē lineāru vai sazarotu alkilēngrupu, vēlams lineāru alkilēngrupu ar formulu $-(CH_2)_x-$, kur x ir no 1 līdz 4, vēlāmāk 1.

2. Polibutadiēns saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt A, B un C vienību daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā katrā gadījumā un neatkarīgi viena no otras ir vismaz 10 %.

3. Polibutadiēns saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt A daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 15 līdz 30 molprocentiem, B daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 50 līdz 70 molprocentiem un C daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 15 līdz 30 molprocentiem.

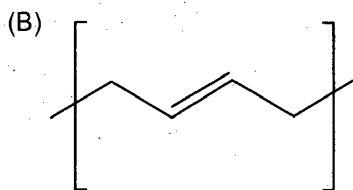
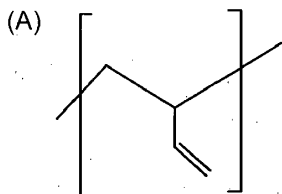
4. Polibutadiēns saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt polibutadiēns neatkarīgi no tā garuma vidēji satur no 1,5 līdz 3, vēlams no 1,75 līdz 2,5, epoksigrupām.

5. Paņēmiens polibutadiēna ar epoksigrupām iegūšanai, kas ietver šādus soļus:

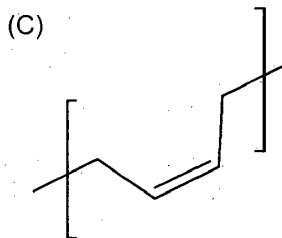
a) ar brīvo radikāļu polimerizāciju iegūta polibutadiēna ar hidroksilgrupām sagatavošanu;

b) polibutadiēna ar hidroksilgrupām no soļa a) pakļaušanu reakcijai ar monoepoksisavienojumu reakcijas maisījumā, turklāt gala hidroksilgrupu un monoepoksisavienojuma molmasas attiecība ir no 10:1 līdz 1:10, turklāt temperatūra ir no 0 līdz 150 °C, un turklāt reakcijas laiks ir no 0,5 līdz 24 stundām;

c) sārmu metāla hidroksīda, sārmu metāla hidroģēnkarbonāta vai sārmu metāla karbonāta pievienošanu reakcijas maisījumam no soļa b), turklāt polibutadiēns ar gala hidroksilgrupām satur šādas monomēru vienības:



un



turklāt A daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 10 līdz 60 molprocentiem; turklāt B un C daļu summa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 40 līdz 90 molprocentiem; turklāt A, B un C daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā katrā gadījumā un neatkarīgi viena no otras, vēlams, ir vismaz 10 %;

turklāt, vēlāmāk, A daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 15 līdz 30 molprocentiem, B daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 50 līdz 70 molprocentiem un C daļa polibutadiēnā esošo no 1,3-butadiēna atvasināto monomēru vienību kopumā ir no 15 līdz 30 molprocentiem.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt monoepoksisavienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no epihalogēnhidrīniem, vēlams epihlorhidrīna, β-metilepilorhidrīna vai epibromhidrīna, un alkilēnoksīdiem, vēlams etilēnoksīda, 1,2-propilēnoksīda vai 1,2-butilēnoksīda.

7. Paņēmiens saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju, turklāt monoepoksisavienojuma un gala hidroksilgrupu molmasas attiecība reakcijas maisījumā solī b) ir no 0,5 līdz 2, vēlams no 0,9 līdz 1,2.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 7. pretenzijai, turklāt solis b) tiek veikts šķīdinātāja klātbūtnē, turklāt šķīdinātājs, vēlams, ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no šķīdriem alifātiskiem savienojumiem, aromātiskiem savienojumiem, esteriem un ēteriem istabas temperatūrā.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 8. pretenzijai, turklāt solis b) tiek veikts vismaz viena metāla sāls vai pusmetāla sāls klātbūtnē, kas satur vismaz vienu metāla katjonu vai pusmetāla katjonu, vēlams, izvēlētu no grupas, kas sastāv no bora, alumīnija, cinka un alvas, un satur vismaz vienu anjonu, izvēlētu no grupas, kas sastāv no F⁻, Cl⁻, BF₄⁻, PF₆⁻, AsF₆⁻, SbF₆⁻, ClO₄⁻, IO₄⁻ un NO₃⁻.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 9. pretenzijai, turklāt solī c) no 0,7 līdz 1,4 mol sārmu metāla hidroksīda, sārmu metāla hidroģēnkarbonāta vai sārmu metāla karbonāta tiek pievienoti uz molu gala hidroksilgrupu solī a).

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 10. pretenzijai, kas papildus ietver liekā monoepoksisavienojuma aizvākšanu ar destilācijas palīdzību pēc soļa b) un pirms soļa c).

12. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai, turklāt solis b) tiek veikts šķīdinātāja klātbūtnē un šķīdinātājs tiek izdalīts no reakcijas maisījuma pirms soļa c), tā laikā vai pēc soļa c), vēlams pēc soļa c).

13. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 12. pretenzijai, turklāt solis b) tiek veikts inertās gāzes klātbūtnē.

14. Kompozīcija, kas satur polibutadiēnu ar epoksigrupām saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, vai polibutadiēns ar epoksigrupām, kas iegūts ar paņēmienu saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 13. pretenzijai un satur arī vismaz vienu cietinātāju un neobligāti arī vismaz vienu no epoksīdsveķiem.

15. Saistvielas līmes masās, hermetizējošās masās un skaņu absorbējošās masās izmantošanai autorūpniecībā, lejamo sveķu kompozīcijās elektroizolācijai, hermetizējošās masās būvmateriāliem, stikla šķiedras un oglekļa šķiedras audumu impregnēšanai vai salīmēšanai, kas satur polibutadiēnu ar gala epoksigrupām saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai polibutadiēnu ar gala epoksigrupām, kas iegūts ar paņēmienu saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 13. pretenzijai, un, vēlams, satur cietinātāju un neobligāti arī vismaz vienu no epoksīdsveķiem.

16. Polibutadiēna ar gala epoksigrupām saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai polibutadiēna ar gala epoksigrupām, kas iegūts ar paņēmienu saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 13. pretenzijai, vai kompozīcijas saskaņā ar 15. pretenziju izmantošana par saistvielu līmes masās, hermetizējošās masās un skaņu absorbējošās masās izmantošanai autorūpniecībā, lejamo sveķu kompozīcijās elektroizolācijai, hermetizējošās masās būvmateriāliem, stikla šķiedras un oglekļa šķiedras audumu impregnēšanai vai salīmēšanai.

17. Paņēmiens, kas ietver kompozīcijas saskaņā ar 14. pretenziju cietināšanas soli.

(51) **A61K 39/395**^(2006.01)
A61P 25/00^(2006.01)

(11) **2698166**

(21) 13181901.3

(22) 10.10.2007

(43) 19.02.2014

(45) 30.09.2015

(31) 850277 P

(32) 10.10.2006 (33) US

(62) EP07834628.5 / EP2073898

(73) Regenesance B.V., Meibergdreef 9, D3307, 1105 AZ Amsterdam Zuidoost, NL

- (72) BAAS, Frank, NL
RAMAGLIA, Valeria, NL
- (74) Jansen, Cornelis Marinus, V.O., Johan de Wittlaan 7, 2517 JR Den Haag, NL
Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV

(54) **KOMPLEMENTA INHIBĒŠANA, LAI UZLABOTU NERUV REĢENERĀCIJU**
COMPLEMENT INHIBITION FOR IMPROVED NERVE REGENERATION

(57) 1. Antiviela vai antielas fragments, kas bloķē komplemen-
ta komponentu, izmantošanai PNS vai CNS slimības vai bojājuma
ārstēšanā, veicinot aksonu reģenerāciju pacientam.

2. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
1. pretenziju, turklāt minētā antiela ir izvēlēta no grupas, kura
sastāv no:

- antielas, kas bloķē vienu vai vairākus no C6, C5, C7, C8 un C9, un
- antielas, kas bloķē C3 konvertāzi un/vai MAC kopumu.

3. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
1. vai 2. pretenziju, turklāt minētā antiela bloķē C6.

4. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
1. vai 2. pretenziju, turklāt minētā antiela bloķē C5.

5. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt minētā antiela ir himēra,
deimunizēta, cilvēka vai humanizēta antiela.

6. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt minētā antiela ir mono-
klonāla antiela.

7. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā
ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt minētā antiela ir vie-
nas ķēdes antiela, Fab fragments, smagās ķēdes antiela vai
VHH domēns.

8. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt minētā antiela vai antielas
fragments ir paredzēts izmantošanai sensoriskās vai motoriskās
funkcijas uzlabošanā.

9. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt minētā antiela vai antielas
fragments ir paredzēts izmantošanai nervu, kuri ir deģenerēti
perifērās vai centrālās nervu sistēmas neirodeģeneratīvas slimības
dēļ, reģenerācijas veicināšanā.

10. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā
ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt minētā antiela vai
antielas fragments ir paredzēts izmantošanai nervu reģenerācijas
veicināšanā pēc perifēra nerva fiziska bojājuma.

11. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā
ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, turklāt minētā antiela vai
antielas fragments ir paredzēts izmantošanai nervu reģenerācijas
veicināšanā pēc PNS vai CNS bojājuma.

12. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā
ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, turklāt minētā antiela vai
antielas fragments ir paredzēts izmantošanai nervu reģenerācijas
veicināšanā pēc nervu traumas imūnmediēta iekaisīga traucējuma
vai bojājuma un/vai progresīva neirodeģeneratīva traucējuma re-
zultātā.

13. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā ar
11. pretenziju, turklāt minētais bojājums ietver ķirurģiskus bojāju-
mus, muguras smadzeņu bojājumus, perifēro nervu traumatiskus
ievainojumus, ieskaitot bojājumus no sadursmēm un autotransporta
avārijām, šautas brūces, lūzumus, izmežģījumus un plēstas brūces.

14. Antiviela vai antielas fragments izmantošanai saskaņā
ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, turklāt minētā antiela vai
antielas fragments ir paredzēts izmantošanai 24, 12, 6, 3, 2 vai
1 stundas laikā, vēlāmāk 45, 30, 20 vai 10 minūšu laikā, pēc nervu
bojājuma rašanās.

A61P 11/06^(2006.01)

A61P 11/08^(2006.01)

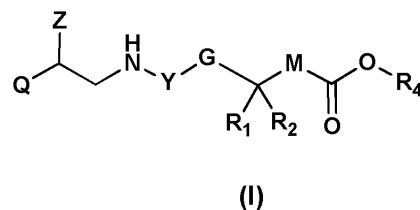
C07C 213/10^(2006.01)

C07D 215/20^(2006.01)

C07D 221/22^(2006.01)

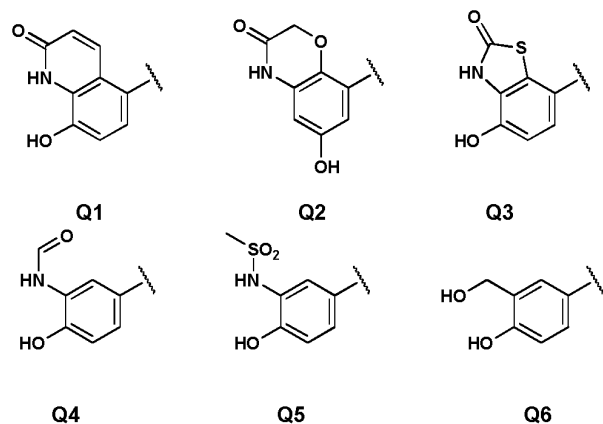
A61K 9/00^(2006.01)

- (21) 12730176.0 (22) 07.06.2012
- (43) 16.04.2014
- (45) 16.09.2015
- (31) 11169537 (32) 10.06.2011 (33) EP
- 12165283 24.04.2012 EP
- (86) PCT/EP2012/060795 07.06.2012
- (87) WO2012/168359 13.12.2012
- (73) Chiesi Farmaceutici S.p.A., Via Palermo, 26/A, 43100 Parma, IT
- (72) RANCATI, Fabio, IT
RIZZI, Andrea, IT
AMARI, Gabriele, IT
BIAGETTI, Matteo, IT
LINNEY, Ian, IT
- (74) Minoja, Fabrizio, Bianchetti Bracco Minoja S.r.l., Via Plinio 63, 20129 Milano, IT
Valters GENCS, Zvērināta advokāta Valtera Genca birojs, Kr. Valdemāra iela 21, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **SAVIEŅOJUMI AR MUSKARĪNA RECEPTORA ANTAGONISTA UN BETA-2 ADRENERĢISKĀ RECEPTORA AGONISTA AKTIVITĀTI**
COMPOUNDS HAVING MUSCARINIC RECEPTOR ANTAGONIST AND BETA2 ADRENERGIC RECEPTOR AGONIST ACTIVITY
- (57) 1. Savienojums ar vispārīgo formulu (I):

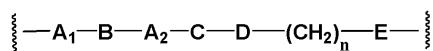


kur:

Q ir grupa ar formulu Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 vai Q6:



Z ir H atoms vai OH grupa;
Y ir izvēlēts no Y' un Y1, kuri ir divvērtīgas grupas ar formulu:



Y

vai



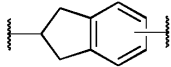
turklāt:

A1 un A2 neatkarīgi nav vai ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no (C₁-C₁₂) alkilēngrupas, (C₃-C₈)cikloalkilēngrupas un (C₃-C₈)hetero-
cikloalkilēngrupas, kas neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem

- (51) C07D 401/12^(2006.01) (11) 2718280
C07D 451/06^(2006.01)
C07D 453/02^(2006.01)
A61K 31/439^(2006.01)
A61K 31/4709^(2006.01)

aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)arilalkilgrupas un (C₁-C₆)heteroarilalkilgrupas;

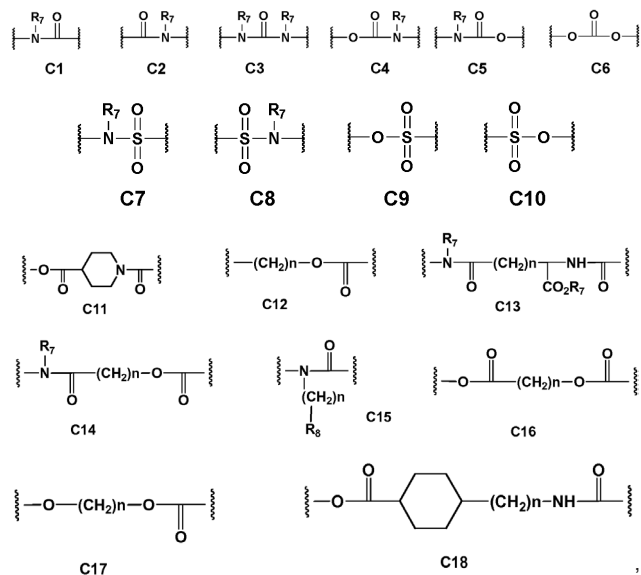
B nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₃-C₈)cikloalkilēngrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilēngrupas, arilēngrupas, heteroarilēngrupas, vai ir grupa ar formulu B1:



B1

neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no halogēniem, nitriliem, (C₁-C₆)alkilgrupām, (C₁-C₆)alkoksigrupām un (C₁-C₆)arilalkilgrupām;

C nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no -O-, -CO-, -OC(O)-, -C(OO)-, -S-, -S(O)₂-, -N(R₇)-, -N(CO)R₇-, -N(CO)NHR₇-, -N(SO₂)R₇-, vai ir viena no šādām grupām C1-C18:



turklāt R₇ ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no lineāras vai sazarotas (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilgrupas, arilgrupas, (C₁-C₆)arilalkilgrupas, (C₁-C₆)alkoksi(C₁-C₆)alkilgrupas un heteroarilgrupas grupas, un R₈ ir (C₁-C₈)alkoksikarbonilgrupa;

D nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₁₂)alkilēngrupas, -C(CH₃)₂-, arilēngrupas, (C₂-C₁₂)alkenilēngrupas, heteroarilēngrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilēngrupas un (C₂-C₆)alkinilēngrupas; n ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 3;

E nav vai ir izvēlēts no -O-, -NR₇-, -OC(O)- un -S-;

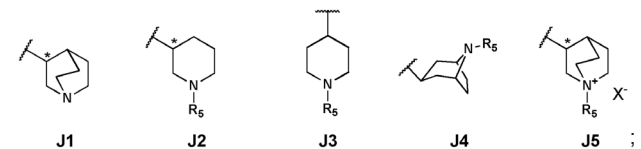
G ir arilēn grupa vai heteroarilēn grupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, -OH, oksogrups (=O), -SH, -NO₂-, -CN, -CON(R₆)₂-, -NH₂-, -NHCOR₆-, -CO₂R₆-, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilgrupas, arilgrupas, halogēnarilgrupas, heteroarilgrupas un (C₁-C₁₀)alkoksigrupas;

R₁ un R₂ neatkarīgi ir H atoms vai ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilgrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, aril(C₁-C₆)alkilgrupas, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupas un (C₃-C₈)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai (C₁-C₈)alkilgrupām, vai, ņemti kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir savienoti, R₁ un R₂ var veidot (C₃-C₈)cikloalkilgrupu, turklāt R₁ un R₂ vienlaicīgi nav H atomi;

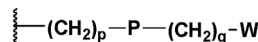
M ir -O- vai -N(R₃)-;

R₃ ir H atoms vai izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas;

R₄ ir grupa ar formulu J1, J2, J3, J4 vai J5:



R₅ ir grupa ar formulu K:



K

turklāt p ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 4; q ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 4;

P nav vai ir izvēlēts no divvērtīgas grupas, kas sastāv no O atoma, S atoma, SO, SO₂, CO, NR₆CH=CH, N(R₆)SO₂, N(R₆)COO, N(R₆)C(O), SO₂N(R₆), CO(O)N(R₆) un C(O)N(R₆) grupas;

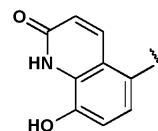
W ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no H atoma, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, -OH, oksogrups (=O), -SH, -NO₂-, -CN, -CON(R₆)₂-, -NH₂-, -NHCOR₆-, -CO₂R₆-, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilgrupas un (C₁-C₁₀)alkoksigrupas;

X ir fizioloģiski pieņemams anjons;

R₆ ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₁₀)alkilgrupas, (C₁-C₆)halogēnalkilgrupas, (C₂-C₆)alkinilgrupas, (C₂-C₆)alkenilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupas, heteroarilgrupas un arilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, -OH, oksogrups (=O), -SH, -NO₂-, -CN, -CONH₂-, -COOH, (C₁-C₁₀)alkoksikarbonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilgrupas un (C₁-C₁₀)alkoksigrupas; un farmaceitiski pieņemami tā sāļi vai solvāti.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt B nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₃-C₈)cikloalkilēngrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilēngrupas, arilēngrupas un heteroarilēngrupas; C nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no -O-, -CO-, -OC(O)-, -C(OO)-, -S-, -S(O)-, -S(O)₂- un -N(R₇)-, turklāt R₇ ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas; G ir arilēn grupa vai heteroarilēn grupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, -OH, oksigrups (=O), -SH, -NO₂-, -CN, -CON(R₆)₂-, -NH₂-, -NHCOR₆-, -CO₂R₆-, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilgrupas un (C₁-C₁₀)alkoksigrupas, un turklāt Q, Z, A1, A2, D, E, G, R₁, R₂ M, R₄ un R₆ ir tādi aizvietotāji, kā definēts 1. pretenzijā.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt Q ir Q1:



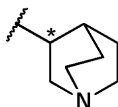
Q1

Z ir -OH, A1 nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₃-C₈)heterocikloalkilēngrupas un (C₁-C₁₂)alkilēngrupas, A2 nav vai ir (C₁-C₆)alkilēn grupa, B nav vai ir arilēn grupa, C nav, D nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₁₂)alkilēngrupas, heteroarilēngrupas un arilēngrupas, E nav vai ir -O-, G ir arilēn grupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt A1 nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no metilēngrupas, etilēngrupas, propilēngrupas, butilēngrupas, pentilēngrupas, heksilēngrupas, heptilēngrupas, oktilēngrupas un nonilēngrupas, A2 nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no metilēngrupas un oksadiazolēngrupas, B ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fenilēngrupas un cikloheksilēngrupas, vai nav, C nav, D nav vai ir izvēlēts no metilēngrupas, etilēngrupas, propilēngrupas, butilēngrupas, pentilēngrupas, heksilēngrupas, heptilēngrupas, oktilēngrupas, nonilēngrupas, fenilēngrupas un oksadiazolēngrupas; G ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fluorifenilēngrupas un fenilēngrupas.

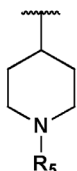
5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt A1 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no etilēngrupas, pentilēngrupas, heksilēngrupas, heptilēngrupas, oktilēngrupas un nonilēngrupas, D nav,

R₁ ir H atoms, R₂ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fenilgrupas, bifenilgrupas, naftilgrupas, piridinilgrupas, difluorfenilgrupas, metilfenilgrupas, fluorfenilgrupas un tiofenilgrupas, M ir -N(H)-, R₄ ir grupa ar formulu J1:



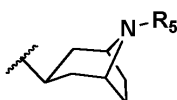
J1

vai J3:



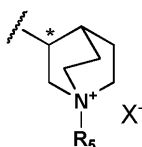
J3

vai J4:



J4

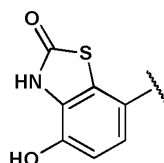
vai J5:



J5

turklāt R₅ ir grupa ar formulu K, turklāt p ir 0 vai 1, P nav vai ir CO grupa, q nav vai ir 1 un W ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₆)alkilgrupas un arilgrupas.

6. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt Q ir Q3:



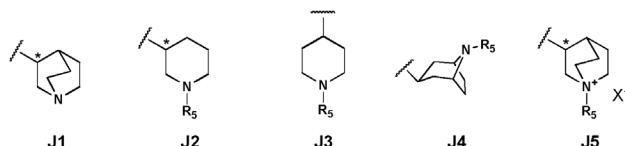
Q3

Z ir H atoms, A1 nav vai ir (C₁-C₁₂)alkilēngrupa, A2 nav, B nav, C nav, D nav vai ir (C₁-C₂)alkilēngrupa, E ir -O-, G ir arilēngrupa.

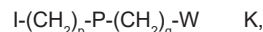
7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt A1 nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no metilēngrupas, etilēngrupas, propilēngrupas, butilēngrupas, pentilēngrupas, heksilēngrupas, heptilēngrupas, oktilēngrupas un nonilēngrupas, A2 nav, B nav, C nav, D nav vai ir izvēlēts no metilēngrupas, etilēngrupas, propilēngrupas, butilēngrupas, pentilēngrupas, heksilēngrupas, heptilēngrupas, oktilēngrupas un nonilēngrupas; G ir fenilēngrupa.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt R₁ un R₂ neatkarīgi ir H atoms vai ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilgrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, aril(C₁-C₆)alkilgrupas, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupas un (C₃-C₈)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai (C₁-C₈)alkilgrupām, vai, ņemti kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir savienoti, R₁ un R₂ var veidot (C₃-C₈)cikloalkilgrupu, turklāt R₁ un R₂ vienlaicīgi nav H atomi; M ir -O- vai -N(R₃)-; R₃ ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas; R₄ ir grupa ar formulu

J1, J2, J3, J4 vai J5:

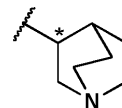


R₅ ir grupa ar formulu K:



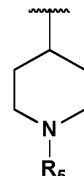
turklāt p ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 4; q ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 4; P nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no -O-, -S-, -S(O)-, -S(O)₂-, -C(O)-, -N(R₆)-, -CH=CH-, -N(R₆)S(O)₂-, -N(R₆)CO(O)-, -N(R₆)C(O)-, -SO₂N(R₆)-, -CO(O)N(R₆)- un -C(O)N(R₆)-; W ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, -OH, oksigrupas (=O), -SH, -NO₂, -CN, -CON(R₆)₂, -NH₂, -NHCOR₆, -CO₂R₆, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsufinilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilgrupas un (C₁-C₁₀)alkoksigrupas; R₆ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no H atoma, (C₁-C₁₀)alkilgrupas, (C₁-C₆)halogēnalkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, heteroarilgrupas un arilgrupas; G, Y, Z un Q ir tādi aizvietotāji, kā definēts 1. pretenzijā.

9. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt R1 un R2 neatkarīgi ir H atoms vai ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai (C₁-C₈)alkilgrupām, vai, ņemti kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir savienoti, R₁ un R₂ var veidot (C₃-C₈)cikloalkilgrupu, turklāt R₁ un R₂ vienlaicīgi nav H atomi; M ir -N(R₃)-; R₃ ir H atoms; R₄ ir grupa ar formulu J1:



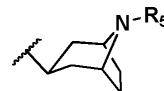
J1

vai J3:



J3

vai J4:



J4

turklāt R₅ ir grupa ar formulu K, turklāt p ir 0, P nav, q ir 1 un W ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₆)alkilgrupas un arilgrupas.

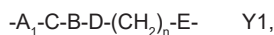
10. Savienojums saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt W ir H atoms vai fenilgrupa; R₁ ir H atoms, R₂ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fenilgrupas, bifenilgrupas, naftilgrupas, tiofenilgrupas, piridinilgrupas, difluorfenilgrupas, metilfenilgrupas un fluorfenilgrupas; M ir -N(H)-; R₄ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no hinuklidinilgrupas, benzilpiperidinilgrupas, metilpiperidinilgrupas, benzil-8-azabicyclo[3,2,1]oktan-3-ilgrupas un azonija-bicyclo[2,2,2]oktanilgrupas.

11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt Q ir grupa ar formulu Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 vai Q6, Z ir H atoms vai OH grupa; Y1 ir grupa ar formulu:



turklāt A1 ir (C₁-C₁₂)alkilēn grupa; C nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no -O-, -CO-, -OC(O)-, vai ir grupa ar formulu C1-C8, turklāt R₇ ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no lineāras vai sazarotas (C₁-C₈)alkilgrupas, (C₃-C₈)cikloalkilgrupas, (C₃-C₈)heterocikloalkilgrupas, arilgrupas, (C₁-C₈)arilalkilgrupas, (C₁-C₈)alkoksi(C₁-C₈)alkilgrupas un heteroarilgrupas, un R₈ ir (C₁-C₈)alkoksikarbonilgrupa; B nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₃-C₈)cikloalkilēn grupas un arilēn grupas; D nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₁₂)alkilēn grupas, -C(CH₃)₂-, heteroarilēn grupas un arilēn grupas; n ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 2; E ir -O-; G ir arilēn grupa vai heteroarilēn grupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, -OH, oksogrupas (=O), -SH, -NO₂, -CN, -CON(R₆)₂, -NH₂, -NHCOR₆, -CO₂R₆, (C₁-C₁₀)alkil-sulfanilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupas, (C₁-C₁₀)alkilgrupas, arilgrupas, halogēnarilgrupas, heteroarilgrupas un (C₁-C₁₀)alkoksigrupas; R₁, R₂, M un R₄ ir tādi aizvietotāji, kā definēts 1. pretenzijā.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt Q ir grupa ar formulu Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 vai Q6, Z ir H atoms vai OH grupa; Y1 ir grupa ar formulu:



turklāt A1 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no metilēn grupas, etilēn grupas, propilēn grupas, butilēn grupas, pentilēn grupas un heksilēn grupas; C nav vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no -O-, -CO-, -OC(O)-, C11, C13, C14, C16, C17, C18, turklāt R₉ ir H atoms vai ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no metilgrupas, etilgrupas un izopropilgrupas, un C15, turklāt n ir 0 vai 1 un R₈ ir etoksikarbonilgrupa; B nav vai ir izvēlēts no fenilēn grupas, piperidīnēn grupas, ciklopropilēn grupas, cikloheksilēn grupas, pīridīnēn grupas, furān-dīlgrupas, oksazol-dīlgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem; D nav vai ir izvēlēts no metilēn grupas, -C(CH₃)₂-, fenilēn grupas un oksadiazolilēn grupas; n ir 0 vai vesels skaitlis no 1 līdz 2; E ir -O-; G ir izvēlēts no fenilēn grupas un bifenilēn grupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no fluora atoma, fenilgrupas un 2-tiofenilgrupas.

13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir:

(R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(8-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)oktiloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(7-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)heptiloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(6-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)heksiloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(5-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)pentiloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 1-benzilpiperidīn-4-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 1-metilpiperidīn-4-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 8-benzil-8-azabicyklo[3,2,1]oktan-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(4-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(tiofen-2-il)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-bifenil-4-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-bifenil-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(piridīn-2-il)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3,5-difluorfenil)(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamāts;

(R)-hinuklidin-3-il-(3,4,5-difluorfenil)(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(o-tolil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(m-tolil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(p-tolil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(4-difluorfenil)(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-fluorfenil)(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-hlorfenil)(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(cikloheksil-(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamāts);
 (R)-hinuklidin-3-il-((3-((6-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)heksiloksi)fenil)(tiofen-2-il)metilkarbamāts);
 (R)-hinuklidin-3-il-((3-((6-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)heksiloksi)fenil)(tiofen-3-il)metilkarbamāts);
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(9-(2-(4-hidroksi-2-okso-2,3-dihidrobenzo[d]tiazol-7-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(4-(2-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)etil)benziloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(2-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)etil)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (3R)-3-(3-(6-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)heksiloksi)fenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)-1-azonija-bicyklo[2,2,2]oktāns;
 (R)-hinuklidin-3-il-(3-(3-(2-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)etil)benziloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāta formiāts;
 (3R)-3-(((3-(4-(2-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)etil)benziloksi)fenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (3R)-3-(((3-hlorfenil)(3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (3R)-3-(((3-brom-5-((9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (R)-hinuklidin-3-il-(2-hlor-3-(9-((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts;
 (R)-hinuklidin-3-il-(2,6-difluor-3-(9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts);
 (R)-hinuklidin-3-il-(2-brom-5-((9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts);
 (R)-hinuklidin-3-il-((2-brom-5-((9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamāts);
 (3R)-3-(((3-hlor-3-(9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (3R)-3-(((3-difluor-3-(9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (3R)-3-(((2-brom-5-((9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)fenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (3R)-3-(((3-((9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)-4-metilfenil)(fenil)metilkarbamoiloksi)-1-(2-okso-2-feniletil)hinuklidīn-1-ijs);
 (R)-hinuklidin-3-il-((3-(9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)-4-metoksifenil)(fenil)metilkarbamāts);
 (R)-hinuklidin-3-il-((3-(9-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino)noniloksi)-5-metoksifenil)(fenil)metilkarbamāts);

2-(4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butoksi)etil-4-((3-(fenil(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts;
 3-(2-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)etil)benzil-4-((3-(fenil(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts;
 3-(3-fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)propil-4-(2-(((R)-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)etil)benzoāts;
 4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butil-4-(2-(3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)etil)benzoāts;
 4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butil-4-(5-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)-1,2,4-oksadiazol-3-il)benzoāts;
 4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butil-4-((4-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)piperidin-1-il)metil)benzoāts;
 2-(4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butoksi)etil-4-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts;
 4-(2-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)etil)benzil-4-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts;
 2-(2-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)etoksi)etil-4-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts;
 4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butil-2-hlor-4-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts;
 4-(((R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohlinolin-5-il)etil)amino)butil-2-fluor-4-((3-(fenil-(((R)-hinuklidin-3-iloksi)karbonil)amino)metil)fenoksi)metil)benzoāts.

14. Farmaceutisks sastāvs, kas satur savienojumu ar formulu (I), kas definēts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, ar vienu vai vairākiem farmaceutiski pieņemamiem nesējiem un/vai palīgvielām.

15. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts bronhu-obstruktīvu vai iekaisuma slimību, vēlams astmas vai hroniska bronhīta, vai hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), novēršanai un/vai ārstēšanai.

16. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai kombinācija ar vienu vai vairākām aktīvām sastāvdaļām, kas izvēlētas no klasēm, kas sastāv no kortikosteroīdiem, P38 MAP kinēzes inhibitoriem, IKK2 inhibitoriem, HNE inhibitoriem, PDE4 inhibitoriem, leikotriēnu modulatoriem, NSAID un glotņu regulatoriem.

17. Farmaceutisks sastāvs saskaņā ar 14. pretenziju ievadīšanai ar inhalāciju, piemēram, ieelpojami pulveri, propelentu saturoši dozējami aerosoli vai propelentu nesaturoši ieelpojami preparāti.

18. Ierīce, kas satur farmaceutisko sastāvu saskaņā ar 17. pretenziju, kura var būt vienas devas vai daudzdevu pulvera inhalators, dozējošs inhalators un izsmidzināmais inhalators.

(54) **BENZODIAZEPĪNA BROMODOMĒNA INHIBITORS
 BENZODIAZEPINE BROMODOMAIN INHIBITOR**

(57) 1. 2-[[4(S)-6-(4-hlorfenil)-1-metil-8-(metiloksi)-4H-[1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]benzodiazepin-4-il]-N-etilacetamīda benzolsulfonskābes sāls.

2. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur 2-[[4(S)-6-(4-hlorfenil)-1-metil-8-(metiloksi)-4H-[1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]benzodiazepin-4-il]-N-etilacetamīda benzolsulfonskābes sāli un vienu vai vairākus farmaceutiski pieņemamus nesējus, šķīdinātājus vai pildvielas.

3. 2-[[4(S)-6-(4-hlorfenil)-1-metil-8-(metiloksi)-4H-[1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]benzodiazepin-4-il]-N-etilacetamīda benzolsulfonskābes sāls izmantošanai terapijā.

(51) **A61K 9/10^(2006.01)** (11) **2723320**
A61K 31/122^(2006.01)
A61P 3/00^(2006.01)

(21) 12802262.1 (22) 20.06.2012

(43) 30.04.2014

(45) 13.01.2016

(31) 1150585 (32) 23.06.2011 (33) SE

(86) PCT/SE2012/050681 20.06.2012

(87) WO2012/177214 27.12.2012

(73) Swedish Orphan Biovitrum International AB, Department of Cell Biology and Genetics, P.O. Box 1738, 112 76 Stockholm, SE

(72) SVENSSON, Lennart, SE
 SIDÉN, Hans, SE

(74) Awapatent AB, P.O. Box 45086, 104 30 Stockholm, SE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **NITIZINONU SATUROŠA ŠĶIDRA FARMACEITISKA
 KOMPOZĪCIJA
 LIQUID PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRIS-
 ING NITIZINONE**

(57) 1. Šķidra farmaceutiska kompozīcija, kas piemērota perorālai ievadīšanai un kas satur:

(a) efektīvu daudzumu mikronizētas 2-(2-nitro-4-trifluorometilbenzil)-1,3-cikloheksāndiona (nitizinona) suspensijas; un
 (b) citronskābes buferi, kura pH ir diapazonā no 2,5 līdz 3,5, vēlams, pH ir 3,0.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā nitizinona daudzums ir no 1 līdz 10 mg/ml, vēlams 4 mg/ml.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver vienu vai vairākas farmaceutiski pieņemamas sastāvdaļas, kas izvēlētas no grupas, kura sastāv no suspendējošiem līdzekļiem, saldinātājiem, konservantiem, virsmaktīvām vielām un aromatizētājiem.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kurā suspendējošais līdzeklis ir hidroksipropilmetilceluloze.

5. Kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kurā suspendējošais līdzeklis ir hidroksipropilmetilceluloze daudzumā no 1 līdz 20 mg/ml, vēlams 5 mg/ml.

6. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kurā saldinātājs ir glicerīns.

7. Kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kurā saldinātājs ir glicerīns daudzumā no 100 līdz 500 mg/ml, vēlams 500 mg/ml.

8. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kurā konservants ir metilparabēns un/vai propilparabēns.

9. Kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kurā konservants ir metilparabēns daudzumā no 1 līdz 2 mg/ml, vēlams 1,4 mg/ml, bet propilparabēns ir daudzumā no 0,1 līdz 0,2 mg/ml, vēlams 0,14 mg/ml.

10. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kurā konservants ir nātrija benzoāts daudzumā no 0,2 līdz 5 mg/ml, vēlams 1 mg/ml.

11. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kurā virsmaktīvā viela ir polisorbāts 80.

12. Kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, kurā virsmaktīvā viela ir polisorbāts 80 daudzumā no 0,1 līdz 20 mg/ml, vēlams no 0,10 līdz 0,15 mg/ml.

13. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9., 11. vai 12. pretenziju, kas ietver:

(a) nitizinonu (4 mg/ml);

(51) **C07D 487/04^(2006.01)** (11) **2722334**
A61K 31/55^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
A61P 43/00^(2006.01)

(21) 13192666.9 (22) 06.08.2010

(43) 23.04.2014

(45) 13.01.2016

(31) 0919433 (32) 05.11.2009 (33) GB
 201010509 22.06.2010 GB

(62) EP10740654.8 / EP2496580

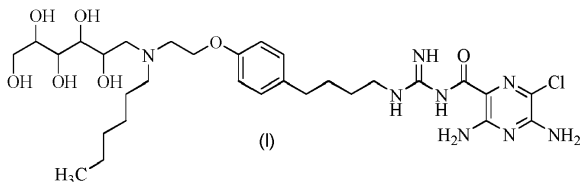
(73) GlaxoSmithKline LLC, Corporation Service Company, 2711 Centreville Road, Suite 400, Wilmington, Delaware 19808, US

(72) GOSMINI, Romain Luc Marie, FR
 MIRGUET, Olivier, FR

(74) Shore, Andrew David, GlaxoSmithKline, Corporate Intellectual Property (CN 925.1), 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

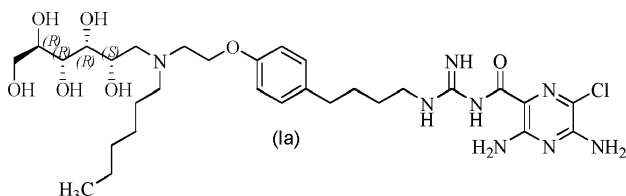
- (b) citronskābes monohidrātu (9 mg/ml);
 - (c) trinātrija citrāta dihidrātu (2,1 mg/ml);
 - (d) hidroksipropilmetilcelulozi (5 mg/ml);
 - (e) glicerīnu (500 mg/ml);
 - (f) metilparabēnu (1,4 mg/ml);
 - (g) propilparabēnu (0,14 mg/ml) un
 - (h) polisorbātu 80 (0,14 mg/ml).
14. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. vai no 10. līdz 12. pretenzijai, kas ietver:
- (a) nitizinonu (4 mg/ml);
 - (b) citronskābes monohidrātu (9 mg/ml);
 - (c) trinātrija citrāta dihidrātu (2,1 mg/ml);
 - (d) hidroksipropilmetilcelulozi (5 mg/ml);
 - (e) glicerīnu (500 mg/ml);
 - (f) nātrija benzoātu (1,0 mg/ml) un
 - (g) polisorbātu 80 (0,14 mg/ml).
15. Kompozīcija saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, kas papildus satur aromatizētāju.
16. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošanai medicīniska stāvokļa, kas izvēlēts no tirozinēmijas, Pārkinsona slimības, depresijas, nemierīgo kāju sindroma un alkaptonūrijas, ārstēšanā.
17. Kompozīcija saskaņā ar 16. pretenziju izmantošanai iedzīmtas 1. tipa tirozinēmijas (HT-1) ārstēšanā.
18. Kompozīcija saskaņā ar 17. pretenziju izmantošanai iedzīmtas 1. tipa tirozinēmijas (HT-1) ārstēšanā pediatrijas pacientam.

- (51) **C07D 239/48**^(2006.01) (11) **2723722**
A61K 31/4965^(2006.01)
A61P 11/00^(2006.01)
- (21) 12733368.0 (22) 26.06.2012
(43) 30.04.2014
(45) 09.09.2015
- (31) 201161501687 P (32) 27.06.2011 (33) US
201261635745 P 19.04.2012 US
- (86) PCT/US2012/044272 26.06.2012
(87) WO2013/003386 03.01.2013
- (73) Parion Sciences, Inc., 2525 Meridian Parkway, Suite 260, Durham, NC 27713, US
(72) JOHNSON, Michael, R., US
(74) Reitsötter - Kinzebach, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE
Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga, LV-1083, LV
- (54) **3,5-DIAMINO-6-HLOR-N-(N-(4-(4-(2-(HEKSIL(2,3,4,5,6-PENTAHIDROKSIHEKSIL)AMINO)ETOKSI)FENIL)BUTIL)KARBAMIMIDOIL)PIRAZĪN-2-KARBOKSAMĪDS**
3,5-DIAMINO-6-CHLORO-N-(N-(4-(4-(2-(HEXYL(2,3,4,5,6-PENTAHYDROXYHEXYL)AMINO)ETHOXY)PHENYL)BUTYL)CARBAMIMIDOYL)PYRAZINE-2-CARBOXAMIDE
- (57) 1. Savienojums ar formulu:



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

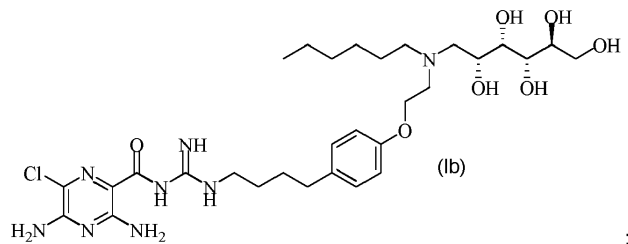
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3R,4R,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīds ar formulu:



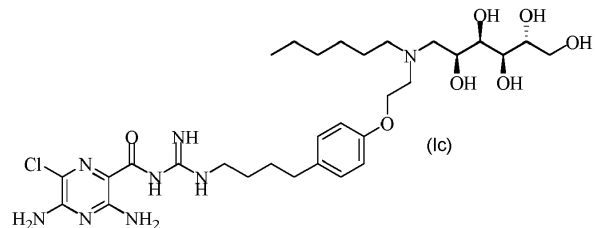
vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

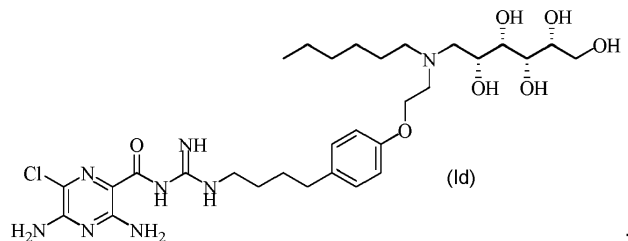
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2R,3S,4S,5S)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



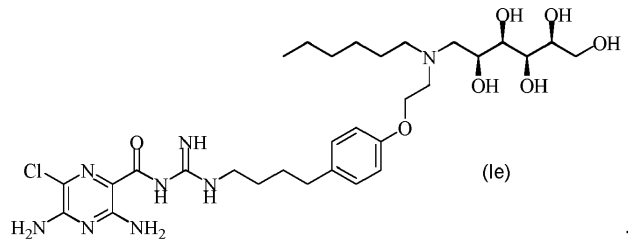
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3R,4R,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



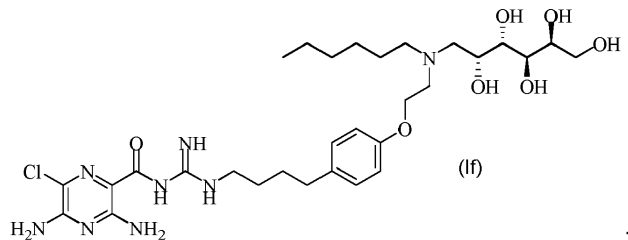
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2R,3S,4S,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



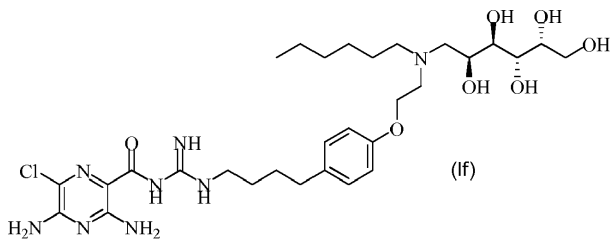
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3R,4R,5S)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



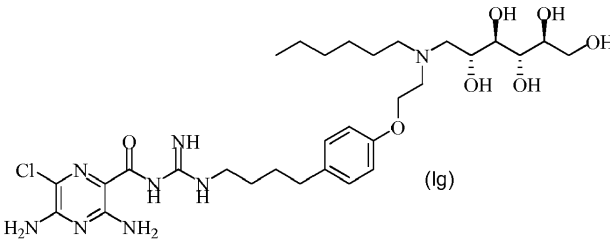
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2R,3S,4R,5S)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



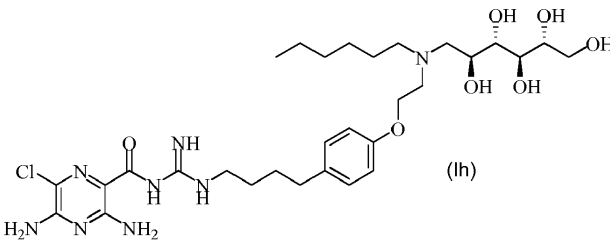
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3R,4S,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



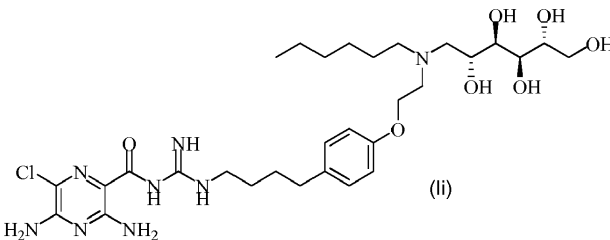
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2R,3R,4S,5S)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



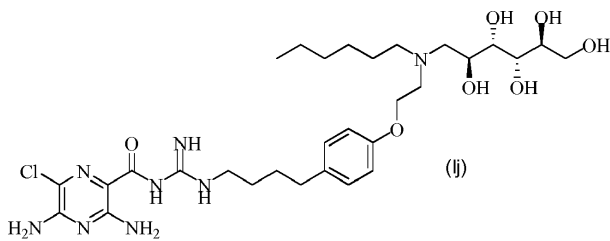
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3S,4R,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



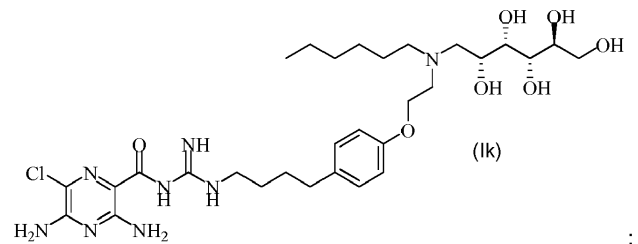
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2R,3R,4R,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3S,4S,5S)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2R,3S,4S,5S)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda:



un
3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3R,4R,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīda;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

4. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceutiski efektīvu daudzumu savienojuma saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemama sāls un tā farmaceutiski pieņemamu nesēju vai palīgvielu.

5. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt savienojums ir 3,5-diamino-6-hlor-N-(N-(4-(4-(2-(heksil((2S,3R,4R,5R)-2,3,4,5,6-pentahidroksiheksil)amino)etoksi)fenil)butil)karbamimidoil)pirazīn-2-karboksamīds vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

6. Kompozīcija saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, turklāt minētā kompozīcija ir piemērota inhalācijai.

7. Kompozīcija saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, turklāt minētā kompozīcija ir šķīdums aerosola veidošanai un ievadīšanai ar smidzinātāju.

8. Kompozīcija saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, turklāt minētā kompozīcija ir piemērota ievadīšanai ar dozējošo inhalatoru.

9. Kompozīcija saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, turklāt minētā kompozīcija ir sauss pulveris, piemērots ievadīšanai ar sausā pulvera inhalatoru.

10. Kompozīcija saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kas papildus satur farmaceutiski efektīvu daudzumu terapeitiski aktīvas vielas, kas ir izvēlēta no pretiekaisuma vielām, antiholīnērgiskām vielām, β-agonistiem, P2Y2 receptoru agonistiem, peroksisomu proliferāciju aktivizējošiem receptoru agonistiem, kināzes inhibitoriem, antiinfekciozām vielām un antihistamīniem.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai metodē nātrija kanālu bloķēšanai vai gļotādas virsmas hidratācijas veicināšanai vai gļotādas aizsardzības atjaunošanai cilvēkam.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai metodē hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (COPD) ārstēšanai vai cistiskās fibrozes ārstēšanai cilvēkam, kam šī ārstēšana nepieciešama.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai par medikamentu.

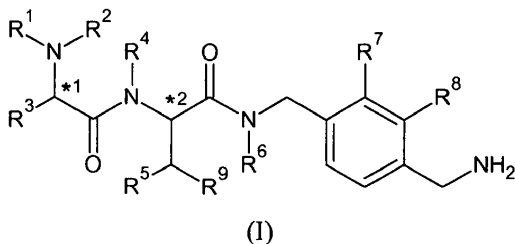
14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 10. pretenzijai izmantošanai slimības ārstēšanā, kas saistīta ar atgriezenisku vai neatgriezenisku elpceļu obstrukciju, hronisku obstruktīvu plaušu slimību (COPD), astmu, bronhektāzēm (tostarp bronhektāzēm tādu stāvokļu dēļ, kas nav cistiskā fibroze), akūtu bronhītu, hronisku bronhītu, vīruslimības izraisītu klepu, cistisko fibrozi, emfizēmu, pneimoniju, panbronhīlītu, ar transplantāciju saistītu bronhīolītu un ar plaušu mākslīgo ventilāciju saistītu traheobronhītu, vai ar plaušu mākslīgo ventilāciju saistītas pneimonijas novēršanā cilvēkam, kam tā nepieciešama.

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 10. pretenzijai izmantošanai sausas mutes (kserosomijas), sausas ādas, maksts sausuma, sinusīta, rinosinusīta vai deguna dehidratācijas, tostarp deguna dehidratācijas, kas izraisīta, ievadot sausu skābekli, sausās acs jeb Šēgrēna slimības, kas veicina acs vai radzenes hidrāciju, ārstēšanā, distālā zarnu obstrukcijas sindroma ārstēšanā, vidusauss iekaisuma, primārās ciliārās diskīnēzijas, distālā zarnu obstrukcijas sindroma, ezofagīta, aizcietējuma vai hroniska divertikulīta ārstēšanā cilvēkam, kam šī ārstēšana nepieciešama.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai metodē deterministiskas ietekmes uz veselību saistībā ar elpošanas ceļiem un/vai

citiem ķermeņa orgāniem, kuras izraisītājs ir ieelpojamie aerosoli, kas satur radionuklīdus, novēršanai, mazināšanai un/vai ārstēšanai cilvēkam, kam tā ir nepieciešama.

- (51) **C07C 237/22**^(2006.01) (11) **2729443**
C07C 311/06^(2006.01)
C07K 5/06^(2006.01)
C07C 311/19^(2006.01)
C07D 207/16^(2006.01)
- (21) 12735610.3 (22) 06.07.2012
(43) 14.05.2014
(45) 25.11.2015
(31) 201111682 (32) 07.07.2011 (33) GB
201161505305 P 07.07.2011 US
(86) PCT/GB2012/051588 06.07.2012
(87) WO2013/005045 10.01.2013
(73) Kalvista Pharmaceuticals Limited, Building 227, Tetricus Science park, Salisbury, Wiltshire SP4 0JQ, GB
(72) EVANS, David Michael, GB
DAVIE, Rebecca Louise, GB
EDWARDS, Hannah Joy, GB
ROOKER, David Philip, GB
(74) Hallybone, Huw George, et al, Carpmaels & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
(54) **BENZILAMĪNA ATVASINĀJUMI KĀ PLAZMAS KALIKREĪNA INHIBITORI**
BENZYLAMINE DERIVATIVES AS INHIBITORS OF PLASMA KALLIKREIN
(57) 1. Savienojums ar formulu (I)



kurā:
R¹ ir izvēlēts no H, alkilgrupas, -COalkilgrupas, -COarilgrupas, -COheteroarilgrupas, -CO₂alkilgrupas, -(CH₂)_aOH, -(CH₂)_bCOOR¹⁰, -(CH₂)_cCONH₂, -SO₂alkilgrupas, -SO₂arilgrupas, -SO₂(CH₂)_nR¹³, -CO(CH₂)_mR¹⁴, -COcikloalkilgrupas, -COCH=CHR¹⁵, -CO(CH₂)_nNHCO(CH₂)_kR¹⁶ un -CONR¹⁷R¹⁸;
R² ir izvēlēts no H un alkilgrupas;
R³ ir izvēlēts no H, alkilgrupas, -(CH₂)_darilgrupas, -(CH₂)_eheteroarilgrupas, -(CH₂)_fcikloalkilgrupas, -(CH₂)_gheterocikloalkilgrupas, -CH(cikloalkil)₂, -CH(heterocikloalkil)₂ un -(CH₂)_laril-O-(CH₂)_m-arilgrupas;
R⁴ un R⁶ ir neatkarīgi izvēlēti no H un alkilgrupas;
R⁵ ir izvēlēts no H, alkilgrupas, alkoksigrupas un OH;
vai R⁴ un R⁵ kopā ar atomiem, pie kuriem tie ir pievienoti, var saistīties, lai veidotu 5- vai 6-locekļu azacikloalkilstruktūru;
R⁷ un R⁸ ir neatkarīgi izvēlēti no H, alkilgrupas, alkoksigrupas, CN, halogēna atoma un CF₃;
R⁹ ir arilgrupa vai heteroarilgrupa;
R¹⁰ ir H vai alkilgrupa;
a, b, c, d, e, f, g, h, i, j, l un m ir neatkarīgi 1, 2 vai 3;
k ir 0, 1, 2 vai 3;
*1 un *2 norāda uz hirālajiem centriem;
alkilgrupa ir lineāra piesātināta ogļūdeņražgrupa ar līdz 10 oglekļa atomiem (C₁-C₁₀) vai sazarota piesātināta ogļūdeņražgrupa ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem (C₃-C₁₀); alkilgrupa eventuāli var būt aizvietota ar 1 vai 2 aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no (C₃-C₁₀)cikloalkilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, OH, CN, CF₃, COOR¹¹, fluora atoma un NR¹¹R¹²;
cikloalkilgrupa ir mono- vai bicikliska piesātināta ogļūdeņražgrupa ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem;
cikloalkilgrupa eventuāli var būt kondensēta ar arilgrupu; vai cikloalkilgrupa ir adamantilgrupa;

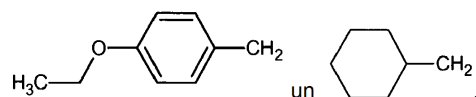
heterocikloalkilgrupa ir C-saistīts vai N-saistīts 3- līdz 10-locekļu piesātināts, mono- vai biciklisks gredzens, turklāt minētais heterocikloalkilgredzens satur, ja iespējams, 1, 2 vai 3 heteroatomus, neatkarīgi izvēlētus no N, NR¹¹ un O;
alkoksigrupa ir lineāra O-saistīta ogļūdeņražgrupa ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem (C₁-C₆) vai sazarota O-saistīta ogļūdeņražgrupa ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem (C₃-C₆); alkoksigrupa eventuāli var būt aizvietota ar 1 vai 2 aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no (C₃-C₁₀)cikloalkilgrupas, OH, CN, CF₃, COOR¹¹, fluora atoma un NR¹¹R¹²;
arilgrupa ir fenilgrupa, difenilgrupa vai naftilgrupa; arilgrupa eventuāli var būt aizvietota ar līdz 5 aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no alkilgrupas, alkoksigrupas, OH, halogēna atoma, CN, COOR¹¹, CF₃ un NR¹¹R¹²;
heteroarilgrupa ir 5-, 6-, 9- vai 10-locekļu mono- vai biciklisks aromātisks gredzens, kas satur, ja iespējams, 1, 2 vai 3 gredzena locekļus, neatkarīgi izvēlētus no N, NR¹¹, S un O; heteroarilgrupa eventuāli var būt aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no alkilgrupas, alkoksigrupas, OH, halogēna atoma, CN, COOR¹¹, CF₃, NR¹¹R¹² un NHR¹⁹;
R¹¹ un R¹² ir neatkarīgi izvēlēti no H un alkilgrupas;
R¹³ ir arilgrupa vai heteroarilgrupa;
R¹⁴ ir arilgrupa, heteroarilgrupa, cikloalkilgrupa vai heterocikloalkilgrupa;
R¹⁵ ir H, alkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, cikloalkilgrupa vai heterocikloalkilgrupa;
R¹⁶ ir H, arilgrupa vai heteroarilgrupa;
R¹⁷ ir H, alkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa vai heterocikloalkilgrupa;
R¹⁸ ir -(CH₂)_mR²¹, kur m ir 0, 1, 2 vai 3 un R²¹ ir H, arilgrupa vai heteroarilgrupa;
R¹⁹ ir -COalkilgrupa, -COarilgrupa vai -COheteroarilgrupa;
un tā tautomēri, stereoizomēri (ietverot enantiomērus, diastereoizomērus un to racēmiskus un neracēmiskus maisījumus), farmaceutiski pieņemami sāļi un solvāti.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R⁹ ir izvēlēts no fenilgrupas vai naftilgrupas, turklāt fenilgrupa eventuāli var būt aizvietota ar līdz 3 aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no alkilgrupas, alkoksigrupas, OH, halogēna atoma, CN, COOR¹¹, CF₃ un NR¹¹R¹².

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā R⁹ ir izvēlēts no fenilgrupas, 1-naftalīngrupas, 2,4-dihlorfenilgrupas, 3,4-dihlorfenilgrupas, 3,4-difluorfenilgrupas, 4-hlorfenilgrupas, 4-trifluorometilfenilgrupas un 4-etoksifenilgrupas.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā R¹ ir izvēlēts no H, -COarilgrupas, -COalkilgrupas, -CH₂COOH, -SO₂Ph un -SO₂CH₃.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā R³ ir izvēlēts no:



6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā R⁴ un R⁶ ir izvēlēti no H un CH₃.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kurā stereokīmiskā konfigurācija pie hirālā centra *1 ir R.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kurā stereokīmiskā konfigurācija pie hirālā centra *2 ir S.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kurā a ir 2 un b, c, d, e, f, g, h, j, l un m ir 1.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no (S)-N-(4-aminometilbenzil)-2-[(R)-3-(4-etoksifenil)-2-propionilamino-propionilamino]-3-fenilpropionamīda, N-[(R)-1-[(S)-1-(4-aminometilbenzilkarbamoil)-2-feniletilkarbamoil]-2-(4-etoksifenil)etil]benzamīda, {(R)-1-[(S)-1-(4-aminometilbenzilkarbamoil)-2-feniletilkarbamoil]-2-cikloheksiletilamino}etiķskābes, (S)-N-(4-aminometil-3-fluorbenzil)-2-[(R)-3-(4-etoksifenil)-2-propionilaminopropionilamino]-3-fenilpropionamīda, (S)-N-(4-aminometil-2-hlorbenzil)-2-[(R)-3-(4-etoksifenil)-2-propionilaminopropionilamino]-3-fenilpropionamīda, (S)-N-(4-aminometilbenzil)-3-(3,4-dihlorfenil)-2-[(R)-3-(4-etoksifenil)-2-propionilaminopropionilamino]propionamīda, (S)-N-(4-aminometil-3-hlorbenzil)-2-[(R)-3-(4-etoksifenil)-2-propionilaminopropionilamino]-3-fenilpropionamīda,

3-metiltiofēn-2-karbonskābes [(R)-1-[(S)-1-(4-aminometilbenzil-karbamoil)-2-piridin-3-iletilkarbamoil]-2-(4-etoksifenil)etil]amīda, un tā farmaceitiski pieņemami sāļi un solvāti.

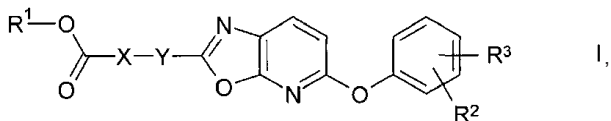
12. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju, atšķaidītāju vai palīgvielu.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai lietošanai medicīnā.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai lietošanai slimības vai patoloģiska stāvokļa, kurā ir iesaistīta plazmas kalikreīna aktivitāte, ārstēšanas metodē, turklāt slimība vai patoloģiskais stāvoklis, kurā ir iesaistīta plazmas kalikreīna aktivitāte, ir izvēlēta(-s) no pazemināta redzes asuma, diabētiskas retinopātijas, diabētiskas makulāras edēmas, iedzimtas angioedēmas, diabēta, pankreatīta, cerebrālas hemorāģijas, nefropātijas, kardiomiopātijas, neiropātijas, iekaisīgas zarnu slimības, artrīta, iekaisuma, septiskā šoka, hipotensijas, vēža, pieaugušo respiratorā distresa sindroma, diseminētas intravaskulāras koagulācijas, kardiopulmonāras šūntēšanas operācijas un pēcoperācijas asiņošanas.

15. Savienojums lietošanai saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt slimība vai patoloģiskais stāvoklis, kurā ir iesaistīta plazmas kalikreīna aktivitāte, ir ar diabētisko retinopātiju un diabētisko makulāro edēmu saistīta tīklenes vaskulāra caurlaidība.

- (51) **C07D 498/04**(2006.01) (11) **2729473**
 (21) 12733131.2 (22) 06.07.2012
 (43) 14.05.2014
 (45) 25.11.2015
 (31) 11305877 (32) 07.07.2011 (33) EP
 12305525 11.05.2012 EP
 (86) PCT/EP2012/063297 06.07.2012
 (87) WO2013/004826 10.01.2013
 (73) SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR
 (72) KADEREIT, Dieter, DE
 SCHÄFER, Matthias, DE
 HACHTEL, Stephanie, DE
 HUEBSCHLE, Thomas, DE
 HISS, Katrin, DE
 (74) Michalski Hüttermann & Partner, Patentanwälte, Spedition-
 straße 21, 40221 Düsseldorf, DE
 Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV &
 Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
 (54) **KARBONSKĀBES ATVASINĀJUMI AR OKSAZOLO[5,4-B]PIRIDĪNGREDZENU
 CARBOXYLIC ACID DERIVATIVES WITH AN
 OXAZOLO[5,4-B]PYRIDINE RING**
 (57) 1. Savienojums ar formulu I jebkurā no tā stereoizomēru
 formām vai stereoizomēru formu maisījums jebkurā attiecībā vai
 tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls
 fizioloģiski pieņemams solvāts,



kurā:

X ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₆)alkāndiilgrupas, (C₂-C₆)alkēndiilgrupas, (C₂-C₆)alkīndiilgrupas, (C₃-C₇)cikloalkāndiilgrupas, (C₁-C₆)alkāndiiloksigrupas un (C₃-C₇)cikloalkāndiiloksigrupas; visas no kurām ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no fluora atoma un hidroksilgrupas, kur (C₁-C₆)alkāndiiloksi- un (C₃-C₇)cikloalkāndiiloksigrupu skābekļa atoms ir pievienots grupai Y;

Y ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fenilēngrupas un divvērtīga atlikuma no aromātiskā 5- vai 6-locekļu monocikliska heterocikla, kas satur 1, 2 vai 3 vienādus vai dažādus gredzena heteroatomus, kas ir izvēlēti no N, O un S, kur viens no gredzena slāpekļa atomiem var saturēt ūdeņraža atomu vai aizvietotāju R⁴ un kur fenilēngrupa un aromātiskā heterocikla divvērtīgais atlikums ir neobligāti aizvietoti pie viena vai vairākiem gredzena oglekļa atomiem ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem R⁵;

R¹ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma un (C₁-C₄)alkilgrupas;

R² un R³ neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no H, halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S(O)_m-, aminogrupas, nitroggrupas, cianogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas un aminosulfonilgrupas, (C₃-C₇)cikloalkil-C_wH_{2w}- un oksigrupas, kur w ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2; R⁴ izvēlēts no grupas, kas sastāv no (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₃-C₇)cikloalkil-C_wH_{2w}- un oksigrupas, kur w ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2;

R⁵ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₃-C₅)cikloalkil-C_zH_{2z}-, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S(O)_m-, aminogrupas, nitroggrupas, cianogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas un aminosulfonilgrupas, kur z ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2;

m ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2.

2. Savienojums ar formulu I jebkurā no tā stereoizomēru formām vai stereoizomēru formu maisījums jebkurā attiecībā vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka

X ir (C₁-C₆)alkāndiiloksigrupa, kur (C₁-C₆)alkāndiiloksigrupas skābekļa atoms ir pievienots grupai Y;

Y ir fenilēngrupa, kur fenilēngrupa ir neobligāti aizvietota pie viena vai vairākiem gredzena oglekļa atomiem ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem R⁵;

R¹ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa;

R² un R³ neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no H, halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S(O)_m-, aminogrupas, nitroggrupas, cianogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas un aminosulfonilgrupas, (C₃-C₇)cikloalkil-C_wH_{2w}- un oksigrupas, kur w ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2; R⁵ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₃-C₅)cikloalkil-C_zH_{2z}-, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S(O)_m-, aminogrupas, nitroggrupas, cianogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas un aminosulfonilgrupas, kur z ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2;

m ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2.

3. Savienojums ar formulu I jebkurā no tā stereoizomēru formām vai stereoizomēru formu maisījums jebkurā attiecībā vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka

X ir (C₁-C₆)alkāndiiloksigrupa, kur (C₁-C₆)alkāndiiloksigrupas skābekļa atoms ir pievienots grupai Y;

Y ir fenilēngrupa, kur fenilēngrupa ir neobligāti aizvietota pie viena vai vairākiem gredzena oglekļa atomiem ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem R⁵;

R¹ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa;

R² un R³ neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no H, halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S(O)_m-, aminogrupas, nitroggrupas, cianogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas un aminosulfonilgrupas, (C₃-C₇)cikloalkil-C_wH_{2w}- un oksigrupas, kur w ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2; R⁵ ir (C₁-C₄)alkilgrupa;

m ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 0, 1 un 2.

4. Savienojums ar formulu I jebkurā no tā stereoizomēru formām vai stereoizomēru formu maisījums jebkurā attiecībā vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka

X ir (C₁-C₄)alkāndiiloksigrupa, kur (C₁-C₄)alkāndiiloksigrupas skābekļa atoms ir pievienots grupai Y;

Y ir fenilēngrupa, kur fenilēngrupa ir neobligāti aizvietota pie viena vai vairākiem gredzena oglekļa atomiem ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem R⁵;

R¹ ir ūdeņraža atoms;

R² un R³ neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no H, halogēna atoma;

R⁵ ir (C₁-C₄)alkilgrupa.

5. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vismaz vienu savienojumu ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemamu sāli vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemamu solvātu un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka farmaceutiskā kompozīcija ir hidrogela preparāts.

7. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts izmantošanai par medikamentu.

8. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts brūču sadziedēšanas traucējumu ārstēšanai

9. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts brūču sadziedēšanai.

10. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts brūču sadziedēšanai diabētiķiem.

11. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts diabētiskās pēdas sindroma ārstēšanai.

12. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts sirds un asinsvadu traucējumu ārstēšanai.

13. Savienojums ar formulu I saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā fizioloģiski pieņemams sāls vai tāda savienojuma vai tāda sāls fizioloģiski pieņemams solvāts kardioprotekcijai.

kas raksturīgs ar to, ka plēve (30) aptver tās dobuma sieniju zonas, kuras vēl nav aptvertas ar augšpusē apvalku vai ar apakšpusē apvalku;

- augšpusē apvalks aptver caurduramo vāku, izņemot caurduršanas zonu.

2. Kontainers saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka sienīgas, kas aptver dobumu, ir izgatavotas no stikla.

3. Kontainers saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka augšpusē apvalks ar berzes palīdzību ir savienots ar vāku un/vai apakšpusē apvalks ar berzes palīdzību ir savienots ar sienīgam pie pamatnes.

4. Kontainers saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka augšpusē apvalks un/vai apakšpusē apvalks ir izveidots/izveidoti no elastīga polimēra.

5. Kontainers saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka plēve pielīmējot ir savienota ar augšpusē apvalku, apakšpusē apvalku un sienīgam un/vai plēve pielīmējot daļēji ir savienota pati ar sevi.

6. Kontainers saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka sienīgas, kas aptver dobumu, veido primāro trauku, kam ir doba cilindra forma tā apakšējā un vidējā zonā, un kas virzienā uz augšu uz atveres pusi sašaurinās, lai veidotu plecu un kaklu, un ar to, ka apkārt atverei ir izveidots atloks.

7. Kontainers saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka vāks satur pārsegu, kas ir piestiprināts primārā trauka atlokam.

8. Kontainers saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka augšpusē apvalkam ir augšdaļa, kas ir ar sašaurinātu šķērsriezumu, un apakšdaļa, kas ir ar paplašinātu šķērsriezumu, teleskopiska cilindra veidā, turklāt augšdaļa nodrošina iespēju savienoties ar vāku, un apakšdaļa atrodas vienā līmenī ar sienīgam, kuras aptver dobumu.

9. Kontainers saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas satur vismaz vienu radionuklīdu.

10. Kontainera saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai izmantošana radioaktīvu materiālu turēšanai un uzglabāšanai, it īpaši, radioaktīvu materiālu, kurus izmanto terapeitiskajiem un/vai diagnostiskajiem nolūkiem, turklāt vēlams, lai minētais radioaktīvais materiāls satur vismaz vienu alfa-emitējošo radionuklīdu.

11. Izmantošana saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kontainers satur vienreizēju devu radioaktīvā materiāla.

12. Paņēmiens kontainera piepildīšanai ar šķidrumu, kas ietver vismaz sekojošus soļus:

- primārā trauka piepildīšanu ar šķidrumu;

- piepildītā primārā trauka aizvākošanu;

- primārā trauka nodrošināšanu ar apakšpusē apvalku tā apakšējā daļā;

- vāka nodrošināšanu ar augšpusē apvalku;

- primārā trauka daļu, kas vēl nav aptverta ar apakšpusē apvalku vai augšpusē apvalku, aptīšanu ar plēvi, turklāt plēve sniedzas no apakšpusē apvalka līdz augšpusē apvalkam un savieno tos vienu ar otru.

13. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka šķidrums ir medikamenta, it īpaši, radioterapeitiska līdzekļa, vienreizēja deva.

14. Paņēmiens saskaņā ar 12. vai 13. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka plēve satur līmes slāni uz vienas puses, un plēve, kas ir paredzēta piestiprināšanai apakšpusē apvalkam, augšpusē apvalkam un primārajam traukam, ir aptīta ap norādītajiem komponentiem.

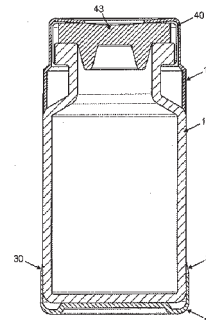


FIG. 4

(51) **A61J 1/14**^(2006.01) (11) **2731577**

B65B 3/00^(2006.01)

B65D 23/08^(2006.01)

B65D 25/24^(2006.01)

B65D 51/00^(2006.01)

G21F 5/015^(2006.01)

G21F 5/08^(2006.01)

G21F 5/12^(2006.01)

A61J 1/05^(2006.01)

(21) 12735524.6 (22) 12.07.2012

(43) 21.05.2014

(45) 16.03.2016

(31) 102011079031 (32) 12.07.2011 (33) DE

(86) PCT/EP2012/063747 12.07.2012

(87) WO2013/007806 17.01.2013

(73) Bayer AS, Drammensveien 288, 0283 Oslo, NO

(72) JAKOBSEN, Jan Børge, NO

BØRRETZEN, Peer, NO

HAUGSETER, Bjørn, NO

(74) BIP Patents, c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Straße 10, 40789 Monheim am Rhein, DE
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV

(54) **KONTEINERS ŠĶIDRUMAM**
LIQUID CONTAINER

(57) 1. Kontainers šķidrumam, kas satur:

- dobumu (4) šķidruma iepildīšanai, turklāt dobums ir ierobežots ar sienīgam no sānu pusēm (3) un no apakšpusē (2);

- atveri (5) dobuma piepildīšanai ar šķidrumu;

- vāku (40, 43) dobuma noslēgšanai, turklāt vāks satur caurduršanas zonu kanulas ievietošanai dobumā;

- apakšpusē apvalku (20), kas aptver dobuma sienīgas pie tā pamatnes;

- augšpusē apvalku (10);

- plēvi (30), kas sniedzas no augšpusē apvalka (10) līdz apakšpusē apvalkam (20);

- (51) **A23J 1/14**^(2006.01) (11) **2736351**
A23J 3/14^(2006.01)
A23J 3/16^(2006.01)
- (21) 12733111.4 (22) 05.07.2012
(43) 04.06.2014
(45) 06.01.2016
(31) 11175743 (32) 28.07.2011 (33) EP
(86) PCT/EP2012/063134 05.07.2012
(87) WO2013/013949 31.01.2013
(73) DSM IP Assets B.V., Het Overloon 1, 6411 TE Heerlen, NL
(72) WNUKOWSKI, Piotr, NL
SMOLDERS, Gerardus Johannes Franciscus, NL
VEERMAN, Cecile, NL
- (74) Schmitt, Maja, et al, DSM Intellectual Property, P.O. Box 4, 6100 AA Echt, NL
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV

(54) **PROTEĪNA IZOLĒŠANA NO EĻĻAS AUGU SĒKLĀM**
PROTEIN ISOLATION FROM OIL SEEDS

(57) 1. Paņēmiens natīvā proteīna izolēšanai no eļļas augu sēklu miltiem vai eļļas augu sēklu raušiem, kurš satur šādas stadijas:

- miltu ekstrahēšanu ar ūdeni, lai iegūtu ūdens šķīdumu,
- ūdens ekstrakta koncentrēšanu līdz ūdens šķīdumam, kas satur no 5 līdz 30 masas % proteīna, labāk no 10 līdz 30 masas % proteīna,
- ūdenī šķīstoša šķīdinātāja pievienošanu koncentrētajam ūdens šķīdumam, lai iegūtu proteīna precipitātu, turklāt ūdenī šķīstošais šķīdinātājs ir etanols, kurš tiek pievienots gala saturam robežās no 60 līdz 80 tilpuma %, un
- proteīna precipitāta atdalīšanu no šķidrās frakcijas.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur proteīna precipitāta mazgāšanas stadiju.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas papildus satur proteīna precipitāta žāvēšanas stadiju.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā pēc ekstrahēšanas stadijas un pirms ūdenī šķīstošā šķīdinātāja pievienošanas ūdens šķīdums vai koncentrētais ūdens šķīdums tiek diafiltrēts, izmantojot, vislabāk, ultrafiltrāciju (UF).

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kurā šķīstoši oglekļa hidrāti, glikozinolāti vai to atvasinājumi, fitīnskābes sāļi vai polifenolu savienojumi vai viena vai vairāku to savienojumu kombinācija tiek izolēta no ūdens šķīduma vai no koncentrētā ūdens šķīduma.

6. Paņēmiens saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kurā diafiltrēšana tiek veikta pirms, vienlaicīgi ar vai pēc ūdens ekstrakta koncentrēšanas.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā milti ir rapša, sojas vai saulespuķu sēklu milti.

8. Izolēts natīvais eļļas augu sēklu proteīns vai natīvā eļļas augu sēklu proteīna kompozīcija, kurā:

- proteīna saturs sausā substancē ir vismaz 80 masas %, labāk vismaz 85 masas %, vēl labāk vismaz 90 masas %, vislabāk robežās no 92 līdz 99 masas %,
- etanola saturs sausā substancē ir mazāks par 0,2 masas %, labāk mazāks par 0,1 masas %,
- etanola saturs sausā substancē ir lielāks par 0,001 masas %, labāk lielāks par 0,01 masas %, un
- fenola saturs sausā substancē ir mazāks par 0,1 masas %, labāk mazāks par 0,05 masas %, vēl labāk mazāks par 0,02 masas %, kas izteikti kā sinapīnskābes ekvivalenti.

9. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kurai glikozinolāta saturs sausā substancē ir mazāks par 10 μmol/g, labāk mazāks nekā 1 μmol/g.

10. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kurā lipīda saturs sausā substancē ir no 2 līdz 15 masas %, labāk no 2 līdz 10 masas %, vēl labāk no 2 līdz 8 masas % vai sojas proteīna gadījumā ir no 2 līdz 20 masas %, labāk no 2 līdz 15 masas %.

11. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai, kurā fitīnskābes sāls saturs (P x 3,5) sausā substancē ir mazāks par 0,5 masas %, labāk mazāks par 0,2 masas %.

12. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai, kurai slāpekļa šķīdības indekss (NS) ir

vismaz 30 NS%, labāk vismaz 50 NS%, vēl labāk vismaz 60 NS%, pat vēl labāk vismaz 70 NS%, vislabāk vismaz 75 NS%.

13. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai, kurā sausās substances saturs ir vismaz 70 masas %, labāk vismaz 80 masas %, vēl labāk vismaz 85 masas %, pat vēl labāk vismaz 90 masas %; tomēr vēl labāk ir, ka sausās substances saturs vismaz ir 91 masas %, vēl labāk no 92 līdz 99 masas %, vislabāk no 93 līdz 98 masas %.

14. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 13. pretenzijai, kas satur rapša, saulespuķu vai sojas sēklu proteīnu.

15. Izolēts proteīns vai proteīna kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 13. pretenzijai, kas satur rapša sēklas, pie kam 2S proteīns un 12S proteīns ir klātesošs attiecībā (sauso substanču masa pret masu) no 1:6 līdz 6:1, labāk no 1:2 līdz 2:1.

(51) **C07D 401/02**^(2006.01) (11) **2736895**

C07D 471/04^(2006.01)

A61K 31/506^(2006.01)

A61K 31/437^(2006.01)

A61P 35/00^(2006.01)

- (21) 12759801.9 (22) 25.07.2012
(43) 04.06.2014
(45) 06.01.2016
(31) 201161512061 P (32) 27.07.2011 (33) US
201261591363 P 27.01.2012 US
(86) PCT/GB2012/051783 25.07.2012
(87) WO2013/014448 31.01.2013
(73) AstraZeneca AB, 101 Hartwell Avenue, 151 85 Södertälje, SE

- (72) BUTTERWORTH, Sam, GB
FINLAY, Maurice, Raymond, Verschoyle, GB
WARD, Richard, Andrew, GB
KADAMBAR, Vasantha, Krishna, IN
CHINTAKUNTLA, Chandrasekhara, Reddy, IN
MURUGAN, Andiappan, IN
REDFEARN, Heather, Marie, GB
CHUAQUI, Claudio Edmundo, US

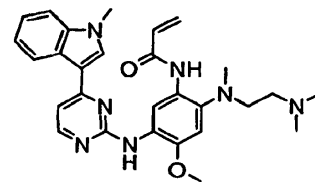
(74) Berry, Ian Gordon, et al, AstraZeneca, Global Intellectual Property, Patents, Mereside - Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, GB

Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV

(54) **2-(2,4,5-AIZVIETOTI-ANILĪN)PIRIMIDĪNA ATVASINĀJUMI KĀ EGFR MODULATORI, KAS IR IZMANTOJAMI VĒŽA ĀRSTĒŠANAI**

2-(2,4,5-SUBSTITUTED-ANILINO) PYRIMIDINE DERIVATIVES AS EGFR MODULATORS USEFUL FOR TREATING CANCER

(57) 1. Savienojums N-(2-{2-dimetilaminoetil-metilamino}-4-metoksi-5-[[4-(1-metilindol-3-il)pirimidin-2-il]amino]fenil)prop-2-enamīds:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums N-(2-{2-dimetilaminoetil-metilamino}-4-metoksi-5-[[4-(1-metilindol-3-il)pirimidin-2-il]amino]fenil)prop-2-enamīds saskaņā ar 1. pretenziju.

3. Farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir N-(2-{2-dimetilaminoetil-metilamino}-4-metoksi-5-[[4-(1-metilindol-3-il)pirimidin-2-il]amino]fenil)prop-2-enamīda mezilāta sāls.

4. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai kombinācijā ar farmaceutiski pieņemamu atšķaidītāju vai nesējvielu.

5. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai par medikamentu.

6. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai vēža ārstēšanā.

7. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai nesīkšūnu plaušu vēža ārstēšanā.

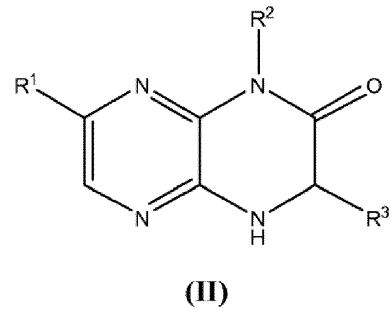
8. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai L858R EGFR mutācijas un/vai T790M EGFR mutācijas, un/vai eksona 19 delēciju aktivējošas mutācijas mediētas slimības ārstēšanā.

9. Farmaceutisks produkts, kas satur savienojumu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai un papildu pretaudzēja vielu vēža kombinētajai ārstēšanai.

10. Farmaceutisks produkts saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt vēzis ir nesīkšūnu plaušu vēzis.

11. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai un papildu pretaudzēja viela izmantošanai vēža kombinētajā ārstēšanā.

12. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai un papildu pretaudzēja viela izmantošanai nesīkšūnu plaušu vēža kombinētajā ārstēšanā.



vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereozomērs vai tautomērs, turklāt:

R¹ ir piridilgrupa, kas aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no grupas, kas sastāv no aizvietotas vai neaizvietotas C₁₋₈alkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas heterociklilgrupas, halogēna atoms, aminokarbonilgrupas, ciāngrupas, hidroksilalkilgrupas, -OR un -NR₂ grupas, turklāt katrs R neatkarīgi ir H atoms vai aizvietota vai neaizvietota C₁₋₄alkilgrupa;

R² ir aizvietota vai neaizvietota cikloalkilgrupa; un

R³ ir H atoms vai aizvietota vai neaizvietota C₁₋₈alkilgrupa; turklāt termins "aizvietots" nozīmē aizvietošanu ar jebkuru no aizvietotājiem, kas izklāstīti sekojošās pretenzijās, vai ar halogēna atomu; alkilgrupu; hidroksilgrupu; alkoksigrupu; alkoksilalkilgrupu; aminogrupu; alkilaminogrupu; karboksilgrupu; nitrogrupu; ciāngrupu; tiolgrupu; tioētergrupu; imīngrupu; imīdgrupu; amidīngrupu; guanidīngrupu; enamīngrupu; aminokarbonilgrupu; acilaminogrupu; fosfonātgrupu; fosfīngrupu; tiokarbonilgrupu; sulfonilgrupu; sulfonogrupu; sulfonamīdgrupu; ketongrupu; aldehīdgrupu; estergrupu; urīnvielas grupu; uretāngrupu; oksīmgrupu; hidroksilamīngrupu; alkoksiamīngrupu; aralkoksiamīngrupu; N-oksidā grupu; hidrazīngrupu; hidrazīdgrupu; hidrazongrupu; azīdgrupu; izociānātgrupu; izotiociānātgrupu; cianātgrupu; tiociānātgrupu; skābekļa (=O) grupu; B(OH)₂ grupu, O(alkil)aminokarbonilgrupu; cikloalkilgrupu, kas var būt monocikliska vai kondensēta vai nekondensēta policikliska grupa; heterociklilgrupu, kas var būt monocikliska vai kondensēta vai nekondensēta policikliska grupa; monociklisku vai kondensētu vai nekondensētu policiklisku arilgrupu vai heteroarilgrupu; ariloksigrupu; aralkiloksigrupu; heterocikliloksigrupu; vai heterociklilalkoksigrupu.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt R³ ir H atoms.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt R¹ ir piridilgrupa, kas aizvietota ar hidroksilalkilgrupu; vai turklāt R¹ ir piridilgrupa, kas aizvietota ar aizvietotu vai neaizvietotu triazolilgrupu, un aizvietota vai neaizvietota C₁₋₈alkilgrupa.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir:

7-(6-(1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-1-(*cis*-4-metoksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-1-(*cis*-4-hidroksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-1-(*trans*-4-hidroksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-1-(*trans*-4-metoksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

1-(*trans*-4-metoksicikloheksil)-7-(4-metil-6-(1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1R,3R)-3-metoksiciklopentil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1S,3R)-3-metoksiciklopentil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1S,3S)-3-metoksiciklopentil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1R,3S)-3-metoksiciklopentil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

1-(*trans*-4-hidroksicikloheksil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

1-(*cis*-4-hidroksicikloheksil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

1-(*trans*-4-hidroksicikloheksil)-7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

1-(*cis*-4-hidroksicikloheksil)-7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;

- (51) **C07D 487/04**^(2006.01) (11) **2740733**
A61P 35/00^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
A61P 25/28^(2006.01)
A61P 3/10^(2006.01)
A61P 3/04^(2006.01)
A61P 9/00^(2006.01)
A61K 31/4985^(2006.01)
- (21) 14158171.0 (22) 27.10.2009
(43) 11.06.2014
(45) 30.12.2015
(31) 108627 P (32) 27.10.2008 (33) US
(62) EP09759827.0 / EP2358718
(73) Signal Pharmaceuticals, LLC, 10300 Campus Point Drive, Suite 100, San Diego, CA 92121, US
- (72) ELSNER, Jan, US
HARRIS, Roy, PE
LEE, Branden, US
MORTENSEN, Deborah, US
PACKARD, Garrick K., US
PAPA, Patrick, US
PERRIN-NINKOVIC, Sophie, US
RIGGS, Jennifer, US
SANKAR, Sabita, US
SAPIENZA, John, US
SHEVLIN, Graziella I., PE
TEHRANI, Lida, US
XU, Weiming, US
ZHAO, Jingjing, US
PARNES, Jason, US
MADAKAMUTIL, Loui, US
FULTZ, Kimberly Elizabeth, US
NARLA, Rama K., US
- (74) Jones Day, Rechtsanwältte, Attorneys-at-Law, Patentanwälte, Prinzregentenstrasse 11, 80538 München, DE
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
- (54) **3,4-DIHDROPIRAZINO[2,3-b]PIRAZIN-2(1H)-ONA SAVIENOJUMI KĀ MTOR KINĀZES INHIBITORI ONKOLOĢISKĀM INDIKĀCIJĀM UN AR MTOR/P13K/AKT METABOLISKO CEĻU SAISTĪTĀM SLIMĪBĀM**
3,4-DIHYDROPYRAZINO[2,3-b]PYRAZIN-2(1H)-ONE COMPOUNDS AS MTOR KINASE INHIBITORS FOR ONCOLOGY INDICATIONS AND DISEASES ASSOCIATED WITH THE MTOR/P13K/AKT PATHWAY
- (57) 1. Savienojums ar formulu (II):

1-((1S,3R)-3-metoksiciklopentil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;
 1-((1R,3R)-3-metoksiciklopentil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;
 1-((1R,3S)-3-metoksiciklopentil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;
 1-((1S,3S)-3-metoksiciklopentil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons;
 1-(*trans*-4-metoksicikloheksil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons; vai
 7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1R,3R)-3-metoksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 7-(6-(1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-1-(*cis*-4-hidroksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1R,3R)-3-metoksiciklopentil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 1-(*trans*-4-hidroksicikloheksil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 1-(*trans*-4-hidroksicikloheksil)-7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 1-((1S,3R)-3-metoksiciklopentil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-(*trans*-4-metoksicikloheksil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 7-(6-(2-hidroksipropan-2-il)piridin-3-il)-1-((1R,3S)-3-metoksiciklopentil)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 1-(*cis*-4-hidroksicikloheksil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir 1-((1R,3S)-3-metoksiciklopentil)-7-(2-metil-6-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-il)-3,4-dihidropirazino[2,3-b]pirazin-2(1H)-ons, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls, stereoizomērs vai tautomērs.
 14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur iedarbīgu daudzumu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, eventuāli piemērota perorālai, parenterālai, mukozālai, transdermālai vai topikālai ievadīšanai.
 15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai vai farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju izmantošanai paņēmiņā, lai ārstētu vai aizkavētu vēzi, iekaisuma stāvokļus, imunoloģiskus stāvokļus, neirodeģeneratīvas slimības, diabētu, aptaukošanos, neiroloģiskus traucējumus, vecuma izraisītas slimības vai kardiovaskulārus stāvokļus.
 16. Savienojums vai farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 15. pretenziju, turklāt vēzis ir galvas, kakla, acs, mutes, rīkles, barības vada, bronhu, balsenes, rīkles gala, krūškurvja, kaulu, plaušu, resnās zarnas, taisnās zarnas, kuņģa, prostatas, urīnpūšļa, dzemdes, dzemdes kakla, krūts dziedzeru, olnīcu, sēklinieku, ādas, vairogdziedzera, asins, limfmezglu, nieru, aknu, aizkuņģa dziedzeru, smadzeņu, centrālās nervu sistēmas vēzis vai cieti audzēji un asinsrades šūnu audzēji; vai
 turklāt iekaisuma stāvoklis ir psoriāze, astma, alerģiskais rinīts, bronhīts, hroniska obstruktīva plaušu slimība, cistiska fibroze, iekaisīgu zarnu slimība, kairinātu zarnu sindroms, Krona slimība, gļotainais kolīts, čūlainais kolīts vai aptaukošanās; vai
 turklāt imunoloģiskais stāvoklis ir reimatoīdais artrīts, reimatoīdais spondilīts, osteoartrīts, multiplā skleroze, vilkēde, iekaisīga zarnu slimība, čūlainais kolīts, Krona slimība, miastēnija, Greivsa slimība,

encefalomiēlīts, II tipa diabēts, dermatomiozīts vai transplantāta atgrūšana; vai
 turklāt vecuma izraisīta slimība ir vēzis, aptaukošanās, II tipa cukura diabēts, autoimūna slimība, kardiovaskulāra slimība vai neironu deģenerācija.
 17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai vai farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju izmantošanai kināzes inhibēšanā šūnā, kas ekspresē minēto kināzi, turklāt eventuāli kināze ir mTOR, DNA-PK vai PI3K, vai to kombinācija.
 18. *In vitro* paņēmiens kināzes inhibēšanai šūnā, kura ekspresē minēto kināzi, kas ietver minētās šūnas kontaktēšanu ar iedarbīgu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai daudzumu, turklāt eventuāli kināze ir mTOR, DNA-PK vai PI3K, vai to kombinācija.
 19. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai vai farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju izmantošanai paņēmiņā, lai ārstētu vai aizkavētu ārstējamu vai novēršamu stāvokli ar kināzes metaboliskā ceļa inhibēšanu, turklāt eventuāli kināzes metaboliskais ceļš ir mTOR/PI3K/Akt metaboliskais ceļš;
 turklāt stāvoklis eventuāli ir multiplā mieloma, mantijas šūnu limfoma, difūza lielo B šūnu limfoma, akūta mieloīda limfoma, folikulāra limfoma, hroniska limfocītiska leukēmija; krūts dziedzeru, plaušu, endometrija, olnīcu, kuņģa, dzemdes kakla vai prostatas vēzis; glioblastoma; nieru karcinoma; aknu šūnu karcinoma; resnās zarnas karcinoma; neiroendokrīnie audzēji; galvas un kakla audzēji; sarkomas; audzēja sindromi, kas rodas tieši vai netieši no ģenētiskiem defektiem PTEN, TSC1, TSC2, NF1, AMPK, LKB1, VHL vai PKD1; Kaudenas slimība, Kaudenas sindroms, Kaudenas sindromam līdzīgs sindroms, Raiļija-Smita sindroms (*Bannayan-Zonana syndrome* jeb *Bannayan-Riley-Ruvalcaba syndrome*), Lermīta-Diklo slimība, endometrija karcinoma, tuberozā skleroze, limfangioleiomiomatoze, neurofibromatoze 1, Pēca-Jēghersa sindroms, nieru šūnu karcinoma, Hipela-Lindava slimība, Proteja sindroms vai policistiska nieru slimība; reimatoīdais artrīts; reimatoīdais spondilīts; osteoartrīts; podagra; astma, bronhīts; alerģiskais rinīts; hroniska obstruktīva plaušu slimība; cistiskā fibroze; iekaisīgu zarnu slimība; kairinātu zarnu sindroms; gļotainais kolīts; čūlainais kolīts; Krona slimība; Hantingtona slimība; gastrīts; ezofagīts; hepatīts; pankreatīts; nefrīts; multiplā skleroze; sarkanā vilkēde; ateroskleroze; restenoze pēc angioplastijas; kreisā ventrikula hipertrofija; miokarda infarkts; trieka; išēmiski sirds, plaušu, zarnu, nieru, aknu, aizkuņģa dziedzeru, liesas un smadzeņu bojājumi; akūta vai hroniska orgāna transplantāta atgrūšana; orgāna saglabāšana transplantācijai; orgāna mazspēja vai locekļa zaudējums; transplantāta atgrūšanas slimība; endotoksīnu šoks; multipla orgānu mazspēja; psoriāze; uguns, ķīmikāliju vai radiācijas izraisīts apdegums; ekzēma; dermatīts; ādas pārstādīšana; išēmija; išēmiski stāvokļi, kas saistīti ar ķirurģisku vai traumatisku ievainojumu; epilepsija; Alzheimeras slimība; Pārkinsona slimība; imunoloģiska reakcija uz bakteriālu vai vīrusa infekciju; kaheksija; angiogēnas vai proliferatīvas slimības.

(51) A61K 9/16 ^(2006.01)	(11) 2747752
A61K 9/20 ^(2006.01)	
A61K 9/50 ^(2006.01)	
(21) 12781346.7	(22) 08.11.2012
(43) 02.07.2014	
(45) 07.10.2015	
(31) 11188597	(32) 10.11.2011
201161559253 P	14.11.2011
(86) PCT/EP2012/072161	08.11.2012
(87) WO2013/068478	16.05.2013
(73) Omya International AG, Baslerstrasse 42, 4665 Oftringen, CH	
(72) SCHWARZENTRUBER, Patrick, CH	
DI MAIUTA, Nicola, CH	
SCHOELKOPF, Joachim, CH	
RIDGWAY, Catherine Jean, CH	
GANE, Patrick A.C., CH	
(74) Tiefbrunner, Vera, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstrasse 3, 80335 München, DE	

Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **JAUNI KONTROLĒTAS IZDALĪŠANĀS AKTĪVO VIELU NESĒJI AR PĀRKLĀJUMU
NEW COATED CONTROLLED RELEASE ACTIVE
AGENT CARRIERS**

(57) 1. Nesējs aktīvo vielu kontrolētai izdalīšanai, kas sastāv no:

- kodola, kas ietver
- dabisku vai sintētisku kalcija karbonātu,
- vismaz vienu aktīvo vielu,

turklāt minētā vismaz viena aktīvā viela ir saistīta ar minēto dabisko vai sintētisko kalcija karbonātu ar aktivētu virsmu, un kurā minētais dabiskais vai sintētiskais kalcija karbonāts ar aktivētu virsmu ir dabiskā vai sintētiskā kalcija karbonāta reakcijas ar oglekļa dioksīdu un vienu vai vairākām skābēm produkts, kurā oglekļa dioksīds ir veidots *in situ*, apstrādājot ar skābi, un/vai tiek piegādāts no ārēja avota, un

- pārklājuma, kas iekapsulē kodolu.

2. Nesējs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka dabiskais vai sintētiskais kalcija karbonāts ar aktivētu virsmu ir cietvielas vai ūdens suspensijas formā, kas satur kalcija karbonātu ar aktivētu virsmu un pH lielāku par 6,0, labāk lielāku par 6,5, vēl labāk lielāku par 7,0, vislabāk lielāku par 7,5, mērot pie 20 °C temperatūras.

3. Nesējs saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka dabiskais kalcija karbonāts ir izvēlēts no kalciju karbonātu saturošu minerālu grupas, kas sastāv no marmora, kalcīta, krīta un dolomīta, kaļķakmens un to maisījumiem.

4. Nesējs saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka sintētiskais kalcija karbonāts ir izgulsnēts kalcija karbonāts, kas izvēlēts no grupas: aragonīta, vaterīta vai kalcīta mineraloģiskas kristāla formas vai to maisījumiem.

5. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka dabiskā vai sintētiskā kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu īpatnējā virsmas platība ir no 5 līdz 200 m²/g, labāk 20 līdz 80 m²/g un, vislabāk 30 līdz 60 m²/g, kas mērīta, izmantojot slāpekli un BET metodi saskaņā ar ISO 9277.

6. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka dabiskā vai sintētiskā kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu vidējais svērtais graudu diametrs d_{50} ir no 0,1 līdz 50 μm, labāk no 0,5 līdz 25 μm, vēl labāk no 0,8 līdz 20 μm, vislabāk 1 līdz 10 μm, mērot saskaņā ar sedimentācijas metodi.

7. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka dabiskā vai sintētiskā kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu iekšējā daļiņu porainība ir diapazonā no 5 līdz 50 tilpuma % (tilp./tilp.), labāk no 20 līdz 50 tilpuma % (tilp./tilp.), vislabāk no 30 līdz 50 tilpuma % (tilp./tilp.), aprēķināta no dzīvudrabā porozimetrijas mērījuma.

8. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viena aktīvā viela ir adsorbēta uz kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu daļiņām un/vai adsorbēta un/vai absorbēta kalcija karbonāta ar aktīvu virsmu daļiņās.

9. Nesējs saskaņā ar ikvienu no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viena aktīvā viela ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no pretmikrobu, farmaceitiski, bioloģiski, kosmētiski aktīvām vielām, barības vielām, piemēram, vitamīniem, sāļiem, pastiprinātājiem, piemēram, kofeīna un guarānas, kā arī veselību veicinošām baktērijām, piemēram, probiotikām, aromātiskām vielām vai garšvielām, biocīdiem, fungicīdiem, pesticīdiem vai herbicīdiem un dezinfekcijas līdzekļiem.

10. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viena aktīvā viela ir izvēlēta no aktīvo vielu grupas, kas minētas Biocīdo produktu direktīvā 98/8/EK (BPD), vēlamais produkta veids (PT) 1-23, vēlāmāk PT6 un vēl vēlāmāk PT6-13.

11. Nesējs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viena aktīvā viela ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no glutardialdehīda (GDA), izotiazolinoniem, piemēram, 2-metil-2H-izotiazol-3-ons (MIT), 5-hlor-2-metil-2H-izotiazol-3-ons (CMIT), benzizotiazolinona (BIT), oktilizotiazolinona (OIT) 4,5-dihlor-2-n-oktil-4-izotiazola (DCOIT), 2-brom-2-nitro-1,3-propāndiols (*Bronopol*), 2,2-dibrom-3-nitrilpropionamīda (DBNPA),

o-fenilfenola (OPP) un tā sāļiem, fenoksietanola, formaldehīda, etilēnglikolhemiforamāls, 1-(3-hloralil)-3,5,7,1-triaza-azonij-adamantāna hlorīda, tetrakishidroksimetilfosfonija sulfāta (THPS), 4,4-dimetiloksazolidīna (DMO), heksahidro-1,3,5-*tris*(2-hidroksietil)-s-triazīna, heksahidro-1,3,5-trietil-s-triazīna (HTT), tetrahidro-3,5-dimetil-2H-1,3,5-tiadiazīn-2-iona (DAZOMET), 3-jod-2-propionilbutilkarbamāta (IPBC), 5-hlor-2-(2,4-dihlorfenoksi)-fenola (triklosāna); un derivātiem, sāļiem un to maisījumiem; antikancerogēniem, limonēna, piparmētras, tādām virsmaktīvajām vielām kā atputotājiem vai mīkstinātājiem, minerāleļļām, silīcija, mitrinātājiem, vaska, parafīna, hidroftiskām vielām, piemēram, hidroftiskām saistvielām un atputekļošanas eļļām.

12. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka kodols, kas sastāv no kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu un vismaz viena aktīvā viela ir tabletes, kapsulas, granulās vai pulvera formā.

13. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka pārklājuma materiāls ir izvēlēts no ūdenī šķīstošiem polimēriem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no metilcelulozes, hidroksipropilcelulozes, hidroksipropilmetilcelulozes, hidroksietilcelulozes, polivinilpirolidona, polivinilspirta, nātrija algināta, polietilēnglikola, pullulāna, tragakanta sveķiem, guāras sveķiem, akācijas sveķiem, gumiarābika, poliakrilskābes, metilmetakrilāta kopolimēra, karboksivinilpolimēra, amilozes, augsta amilozes satura cietes, hidroksipropilāta augsta amilozes satura cietes, dekstrīna, pektīna, hīta, hītozāna, želatīna, zeīna, glutēna, sojas proteīna izolāta, sūkulu proteīna izolāta, kazeīna un derivātiem, sāļiem un maisījumiem; un no ūdenī nešķīstošiem polimēriem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no hidroģenētas augu eļļas, hidroģenētas rīcineļļas, polivinilhlorīda, šellaka, poliuretāna, celulozes derivātiem, sveķu kolofonija, koka kolofonija, vaskiem, akrilāta un metakrilāta polimēriem, akrila un metakrilskābes esteru kopolimēriem un derivātiem, to sāļiem un maisījumiem.

14. Nesējs saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām izmantošanai papīra, krāsu, pārklājumu, farmaceitiskam, bioloģiskam, kosmētiskam, vai lauksaimnieciskam pielietojumam.

15. Metode nesēja sagatavošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīga ar šādiem soļiem:

- kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu nodrošināšana,
- aktīvo vielu šķīduma vai suspensijas formas nodrošināšana piemērotā vidē;
- kalcija karbonātu ar aktivētu virsmu kontaktēšana ar aktīvo vielu,
- ielādēto kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu atdalīšana no liekā šķīduma, šķīduma vai suspensijas,
- atdalītā ielādētā kalcija karbonāta ar aktivētu virsmu pārklāšana ar pārklājuma materiālu.

16. Nesēja izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai papīra, krāsu, pārklājuma, farmaceitiskam, bioloģiskam, kosmētiskam, rūpnieciskam vai lauksaimnieciskam pielietojumam.

17. Nesēja izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai aktīvās vielas transportēšanai uz mērķa vidi.

18. Nesēja izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai aktīvās vielas kontrolētai izdalīšanai.

19. Izmantošana saskaņā ar 17. vai 18. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka aktīvā viela ir termojūtīga.

20. Izmantošana saskaņā ar 18. vai 19. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kontrolētai izdalīšanai ir temperatūras kontrole.

21. Nesēja izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai termojūtīgo aktīvo vielu aizsardzībai.

22. Metode aktīvās vielas transportēšanai uz mērķa vidi, izmantojot nesēju saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai.

23. Metode aktīvās vielas kontrolētai izdalīšanai, izmantojot nesēju saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai.

24. Metode saskaņā ar 22. vai 23. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka aktīvā viela ir termojūtīga.

25. Metode saskaņā ar 23. vai 24. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kontrolētai izdalīšanai ir temperatūras kontrole.

26. Metode termojūtīgu aktīvo vielu aizsardzībai, izmantojot nesēju saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai.

(51) **A61K 35/74**^(2015.01)
A61P 1/12^(2006.01)

(11) **2750682**

- A61P 1/00**^(2006.01)
A61P 17/10^(2006.01)
A61P 19/02^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
- (21) 12772317.9 (22) 11.10.2012
(43) 09.07.2014
(45) 18.05.2016
(31) 1150940 (32) 11.10.2011 (33) SE
1250011 11.01.2012 SE
(86) PCT/EP2012/070177 11.10.2012
(87) WO2013/053836 18.04.2013
(73) Achim Biotherapeutics AB, Björnbodavägen 65, 162 44 Vällingby, SE
(72) BERSTAD, Arnold, NO
MIDTVEDT, Tore, NO
NORIN, Elisabeth, SE
BENNO, Peter, SE
DAHLGREN, Atti-La, CH
(74) Fenix Legal KB, Stureplan 4C, 4 tr, 114 35 Stockholm, SE
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
(54) **ANAEROBI KULTIVĒTU CILVĒKA ZARNU MIKROFLORU SATUROŠA KOMPOZĪCIJA
COMPOSITION COMPRISING ANAEROBICALLY CULTIVATED HUMAN INTESTINAL MICROBIOTA**
(57) 1. Kompozīcija, kas satur pilnīgi anaerobi kultivētu cilvēka zarnu mikrofloru, izvēlētu no vismaz trim no četriem tipiem, *Bacteroidetes*, *Firmicutes*, *Proteobacteria* un *Actinobacteria*, izmantošanai slimību profilaksē un ārstēšanā.
2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka tā ir brīva no paplašināta darbības spektra un metallo-*beta* laktamāzēm, farmaceitisko vielu metabolītiem vai ksenobiotikām.
3. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 2. pretenzijai, raksturīga ar to, ka tā ir brīva no sekojošiem mikroorganismiem: A, B un C hepatīta vīrusiem, citomegalovīrusa, Epstein-Barr vīrusa, cilvēka imūndeficīta vīrusa (HIV), Kalici- un Rota vīrusa, *Salmonella*, *Shigella*, *Campylobacter*, *Yersinia* un protozoju cistām.
4. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, raksturīga ar to, ka sekojošās baktēriju sugas kopā aptver vairāk nekā 1 % no izgudrojuma kopējā baktēriju satura:
baktērijas: "*Actinobacteria*"; *Actinobacteria*; *Coriobacteridae*; *Coriobacteriales*; *Coriobacterineae*; *Coriobacteriaceae*; *Collinsella*, baktērijas: "*Actinobacteria*"; *Actinobacteria*; *Coriobacteridae*; *Coriobacteriales*; *Coriobacterineae*; *Coriobacteriaceae*; *Eggerthella*, baktērijas: "*Actinobacteria*"; *Actinobacteria*; *Coriobacteridae*; *Coriobacteriales*; *Coriobacterineae*; *Coriobacteriaceae*; *Olsenella*, baktērijas: "*Bacteroidetes*"; *Bacteroidia*; *Bacteroidales*; *Porphyromonadaceae*; *Parabacteroides*, baktērijas: "*Bacteroidetes*"; *Bacteroidia*; *Bacteroidales*; *Prevotellaceae*; *Prevotella*, baktērijas: "*Bacteroidetes*"; *Bacteroidia*; *Bacteroidales*; *Rikenellaceae*; *Alistipes*, baktērijas: "*Bacteroidetes*"; *Bacteroidia*; *Bacteroidales*; *Bacteroidaceae*; *Bacteroides*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Bacilli*; *Lactobacillales*; *Enterococcaceae*; *Enterococcus*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Eubacteriaceae*; *Eubacterium*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Eubacteriaceae*; neklasificētas *Eubacteriaceae*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Lachnospiraceae*; *Anaerostipes*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Lachnospiraceae*; *Dorea*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Lachnospiraceae*; *Roseburia*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Lachnospiraceae*; neklasificētas *Lachnospiraceae*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Peptostreptococcaceae*; *Sporacetigenium*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Peptostreptococcaceae*; neklasificētas *Peptostreptococcaceae*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Ruminococcaceae*; *Anaerofilum*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Ruminococcaceae*; *Anaerotruncus*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Ruminococcaceae*; *Oscillibacter*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Ruminococcaceae*; neklasificētas *Ruminococcaceae*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Clostridiaceae*; *Clostridiaceae* 1; *Clostridium*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Clostridiaceae*; *Clostridiaceae* 1; *Sarcina*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Clostridiaceae*; *Clostridiaceae* 1; neklasificētas *Clostridiaceae* 1, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XI*; *Anaerococcus*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XI*; *Finegoldia*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XI*; *Peptoniphilus*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XI*, neklasificētas *Incertae Sedis XI*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XIII*; *Anaerovorax*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XIII*; *Mogibacterium*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Incertae Sedis XIV*; *Blautia*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; neklasificētas *Clostridiales*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Clostridia*; *Clostridiales*; *Veillonellaceae*; *Veillonella*, baktērijas: "*Firmicutes*"; *Erysipelotrichi*; *Erysipelotrichales*; *Erysipelotrichaceae*; *Holdemania*, un baktērijas: "*Proteobacteria*"; *Betaproteobacteria*; *Burkholderiales*; *Alcaligenaceae*; *Parasutterella*.
5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, raksturīga ar to, ka kompozīcijas baktēriju sastāvs satur vienu vai vairākas no baktēriju grupām, kas minētas 4. pretenzijā.
6. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai diarejas, tādas kā kairināto zarnu sindroma (KZS) vai ar antibiotiku lietošanu saistītas diarejas (AID), sevišķi saistītas ar *Clostridium difficile*, *Clostridium difficile* asociētas diarejas (CDID) un atkārtotu *Clostridium difficile* infekciju (ACDI), ārstēšanā.
7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai ievadīšanai cilvēkam ar ierīci, kas izvēlēta no nazo-duodenālās zondes, gastroskopa, kolo/sigmoidoskopa un klizmas, vai liofilizētas formas piemērotā galēniskā preparātā, piemēram, kuņģa skābes rezistentā kapsulā, nano-iekapsulētā formā vai supozitorija formā.
8. Paņēmiens kompozīcijas, kas satur pilnīgi anaerobi kultivētu cilvēka zarnu mikrofloru, kas izvēlēta no vismaz trim no četriem tipiem *Bacteroidetes*, *Firmicutes*, *Proteobacteria* un *Actinobacteria*, pagatavošanai, paņēmiens raksturīgs ar anaerobu izkārņījumu parauga kultivēšanu kultivēšanas vidē, kas veicina vismaz triju no sekojošiem četriem baktēriju tipiem: *Bacteroidetes*, *Firmicutes*, *Proteobacteria* un *Actinobacteria* anaerobo proliferāciju, un kas raksturīgs ar to, ka aerobās baktērijas kultivēšanas laikā tiek supresētas.
- (51) **H01H 1/54**^(2006.01) (11) **2752862**
H01H 50/44^(2006.01)
H01H 50/54^(2006.01)
(21) 14162921.2 (22) 09.02.2012
(43) 09.07.2014
(45) 20.01.2016
(31) 931820 (32) 11.02.2011 (33) US
(62) EP12746573.0 / EP2673793
(73) Hongfa Holdings U.S., Inc., 20381 Hermana Circle, Lake Forest CA 92630, US
(72) GRUNER, Philipp, US
(74) WP Thompson, 8th Floor, 1 Mann Island, Liverpool L3 1BP, GB
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(54) **BISTABILS ELEKTROMAGNĒTISKS RELEJS AR X-PIE-DZIŅAS MOTORU**
BI-STABLE ELECTROMAGNETIC RELAY WITH X-DRIVE MOTOR

(57) 1. Elektromagnētiska releja mezgls (10), lai selektīvi ļautu strāvai plūst cauri slēdža izvadiem (11), turklāt elektromagnētiskā releja mezgls satur:

spoles mezglu (12), turklāt spoles mezgls satur strāvu vadošu spoli (16) un spoles serdi (17), turklāt spole ir aptīta ap serdi, turklāt spolei ir elektromagnētiskās piedziņas izvadi (19), turklāt serde satur pretēji vērstus serdes izvadus (21), pretēji vērstu pastāvīgo magnētu pirmo un otro magnētu pāri (13), turklāt magnētu pāri ir attiecīgi nekustīgi nostiprināti blakus serdes izvadiem tā, ka serdes izvadi ir attiecīgi pārvietojami starp magnētu pāriem; un slēdžu mezglu, turklāt slēdža mezglam ir pirmā un otrā savienojuma vieta (14) un pirmā un otrā kontakta piespiedējatsperu montāžas, turklāt savienojuma vietas vienu ar otru savieno serdes izvadus un kontakta piespiedējatsperu montāžas, kontakta piespiedējatsperu montāžas satur pretēji vērstus kontaktu pārus (31), pirmo un otro atsperu atzaru (15) un pirmo un otro slēdža izvadus, spole kalpo magnētiskā lauka radīšanai, turklāt magnētiskais lauks var tikt izvadīts cauri serdei, lai panāktu serdes rotāciju ap rotācijas asi, to panākot, ar virzītu izvēlēto magnētu pāru pievilkšanos, serdes izvadi savienojuma vietu pārvietošanai, turklāt savienojuma vietas darbina kontakta piespiedējatsperu montāžas starp vaļēju stāvokli un noslēgtu stāvokli, turklāt noslēgtais stāvoklis kalpo strāvas laišanai cauri slēdža mezglam pa kontaktiem un slēdža izvadiem, raksturīgs ar to, ka spoles mezgls ir pagriežams, serde ir kolineāra ar spoles asi (100) un spoles mezgls satur spoles korpusu (18), turklāt spoles korpusam apņem spoli un serdi, spoles korpusam ir korpusa griešanās ass (101), kas ortogonāla pret spoles asi, viss spoles korpusam ir pagriežams ap korpusa griešanās asi tā, ka spoles korpusam, spoles korpusā ieslēgtā spole un serde, visi pagriežas, spoles korpusam griežoties ap korpusa griešanās asi, turklāt spoles ass tādējādi pagriežamās pārvietojas X-veidīgu plakānu robežās.

2. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt savienojuma vietas ir L-veidīgas, L-veidīgajām savienojumu vietām katrai ir pirmā un otrā sajūgšanas daļa, turklāt otrās sajūgšanas daļas stiepes viena otrai pretī ortogonāli pret pirmajām sajūgšanas daļām, serdes izvadi ir savienoti ar pirmajām sajūgšanas daļām un atsperu atzari stiepes būtībā paralēli otrajām sajūgšanas daļām, kad tās ir vaļējā stāvoklī.

3. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 2. pretenzijai, turklāt atsperu atzari satur pirmos atsperu līdzekļus, kur pirmie atsperu līdzekļi kalpo kontaktu vibrācijas slāpēšanai starp kontaktiem, tiem pārslēdzoties no vaļēja stāvokļa noslēgtā stāvoklī.

4. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 3. pretenzijai, turklāt atsperu atzari satur otros atsperu līdzekļus, kur otrie atsperu līdzekļi kalpo slāpētās kontaktu vibrācijas pastiprināšanai starp kontaktiem, tiem pārslēdzoties no vaļēja stāvokļa noslēgtā stāvoklī.

5. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 4. pretenzijai, turklāt pirmie atsperu līdzekļi var tikt darbināti blakus pirmajām sajūgšanas daļām un otrie atsperu līdzekļi var tikt darbināti blakus otrajām sajūgšanas daļām, tādējādi pirmie un otrie atsperu līdzekļi kalpo distancētu slāpēšanas līdzekļu radīšanai katram kontaktu pārim, turklāt distancētie slāpēšanas līdzekļi kalpo slāpētās kontaktu vibrācijas pastiprināšanai starp kontaktiem, tiem pārslēdzoties no vaļēja stāvokļa noslēgtā stāvoklī.

6. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 5. pretenzijai, turklāt katrs kontaktu pāris ir pozicionēts starp distancētajiem slāpēšanas līdzekļiem, tādējādi distancētie slāpēšanas līdzekļi veido sāniski viens otram pretī novietotus slāpēšanas līdzekļus katram kontaktu pārim, lai pastiprinātu slāpēto kontaktu vibrāciju starp kontaktiem, tiem pārslēdzoties no vaļēja stāvokļa noslēgtā stāvoklī.

7. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt atsperu atzari vaļējā vai noslēgtā stāvoklī ir viens otram paralēli un katrs satur pretī novietotas virsmas, turklāt pretī novietotās virsmas īsslēguma scenārija gadījumā tiek magnētiski pievilktas viena pie otras, magnētiski pievilktas virsmas kalpo kontaktu turēšanai noslēgtā stāvoklī īsslēguma scenārija laikā.

8. Elektromagnētiskā releja mezgls atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt magnētu pāru pretī novietotie magnēti katrs satur pretī novietotas virsmas, pretī atrodošās magnētu virsmas ir būtībā plakanas un stiepes savstarpēji šķeļošās plaknēs, serdei ir būtībā

plakanas pretēji vērstas serdes virsmas, turklāt serdes virsmas un magnētu virsmas ir vērstas līdzīgos virzienos, kad tās saskaras viena ar otru, turklāt līdzīgos leņķos vērstās serdes un magnētu virsmas kalpo magnētiskās plūsmas pastiprināšanai caur kontaktojošo virsmu laukumu starp serdi un magnētiem.

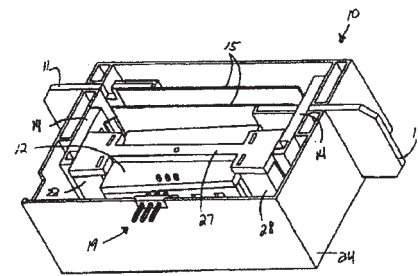
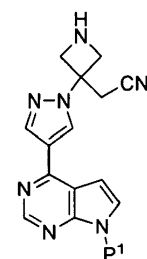


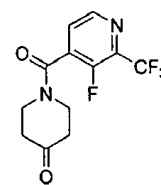
FIG. 1

- (51) **C07D 487/04**^(2006.01) (11) **2753621**
C07D 491/10^(2006.01)
- (21) 12770334.6 (22) 06.09.2012
(43) 16.07.2014
(45) 09.12.2015
(31) 201161531896 P (32) 07.09.2011 (33) US
(86) PCT/US2012/053921 06.09.2012
(87) WO2013/036611 14.03.2013
(73) Incyte Holdings Corporation, 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, DE 19803, US
(72) ZHOU, Jiacheng, US
LIU, Pingli, US
CAO, Ganfeng, US
WU, Yongzhong, US
(74) Carpmaels & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
(54) **METODES UN STARPPRODUKTI JAK INHIBITORA IEGŪŠANAI**
PROCESSES AND INTERMEDIATES FOR MAKING A JAK INHIBITOR
(57) 1. Metode, kas ietver savienojuma ar formulu (III):



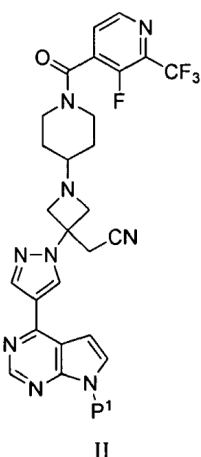
III

vai tā sāls pakļaušanu reakcijai ar savienojumu ar formulu (IV):



IV

reducējoša reaģenta klātbūtnē, lai veidotu savienojumu ar formulu (II):



vai tā sāli, ar nosacījumu, ka minētais reducējošais reaģents nav nātrija ciānbordeiterīds, turklāt P¹ ir aizsarggrupa.

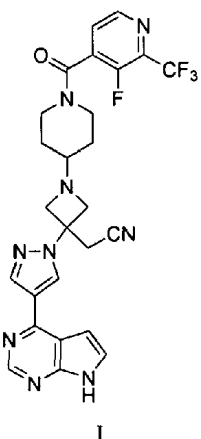
2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētā aizsarggrupa ir -CH₂OCH₂CH₂Si(CH₃)₃.

3. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt minētais reducējošais reaģents ir izvēlēts no nātrija ciānborhidrīda un nātrija triacetoksiborhidrīda.

4. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt minētais reducējošais reaģents ir nātrija triacetoksiborhidrīds.

5. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt savienojumi ar formulām (II), (III) un (IV) katrs ir brīva bāze.

6. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas papildus ietver aizsarggrupas atšķelšanu savienojumam ar formulu (II) vai tā minētajam sālim, lai veidotu savienojumu ar formulu (I):



vai tā sāli.

7. Metode saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt minētā aizsarggrupas atšķelšana ietver apstrādāšanu ar bora trifluorīda ēterātu, kam seko apstrāde ar ūdeni saturošu amonija hidroksīdu.

8. Metode saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, turklāt minētā metode papildus ietver savienojuma ar formulu (I) pakļaušanu reakcijai ar adipīnskābi, lai veidotu adipāta sāli.

9. Metode saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 8. pretenzijai, turklāt savienojumi ar formulām (I), (II), (III) un (IV) katrs ir brīva bāze.

10. Metode saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, turklāt minētā metode papildus ietver:

(a) savienojuma ar formulu (I) karsēšanu metanolā atteces temperatūrā, lai veidotu maisījumu,

(b) pēc soļa (a), metilizobutilketona pievienošanu maisījumam,

(c) pēc soļa (b), šķīdinātāja daļas aizvākšanu destilācijas ceļā pie temperatūras masā no 40 līdz 50 °C, lai veidotu koncentrētu maisījumu,

(d) pēc soļa (c), metanola pievienošanu koncentrētajam maisījumam, lai veidotu atšķaidītu maisījumu,

(e) pēc soļa (d), atšķaidītā maisījuma karsēšanu atteces temperatūrā, lai veidotu maisījumu,

(f) pēc soļa (e), metilizobutilketona pievienošanu maisījumam,

(g) pēc soļa (f), šķīdinātāja daļas aizvākšanu destilācijas ceļā pie temperatūras masā no 40 līdz 50 °C, lai veidotu koncentrētu maisījumu,

(h) pēc soļa (g), adipīnskābes un metanola pievienošanu koncentrētajam maisījumam,

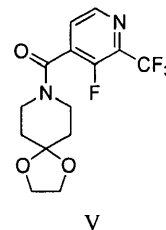
(i) pēc soļa (h), maisījuma karsēšanu atteces temperatūrā un

(j) pēc soļa (i), šķīdinātāja daļas aizvākšanu destilācijas ceļā pie temperatūras masā no 40 līdz 50 °C, lai veidotu koncentrētu maisījumu,

(k) pēc soļa (j), heptāna pievienošanu maisījumam un

(l) pēc soļa (k), maisījuma maisīšanu istabas temperatūrā, lai veidotu savienojuma ar formulu (I) adipīnskābes sāli.

11. Metode saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 10. pretenzijai, turklāt savienojums ar formulu (IV) vai tā sāls tiek iegūts ar metodi, kas ietver aizsarggrupas atšķelšanu savienojumam ar formulu (V):



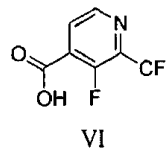
vai tā sālim.

12. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt minētā aizsarggrupas atšķelšana ietver pakļaušanu reakcijai ar ūdeni saturošu skābi.

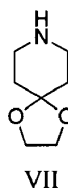
13. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētā skābe ir sālskābe.

14. Metode saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, turklāt savienojumi ar formulām (I), (II), (III), (IV) un (V) katrs ir brīva bāze.

15. Metode saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 14. pretenzijai, turklāt minētais savienojums ar formulu (V) vai tā sāls tiek iegūts ar metodi, kas ietver savienojuma ar formulu (VI):



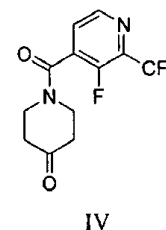
pakļaušanu reakcijai ar savienojumu ar formulu (VII):



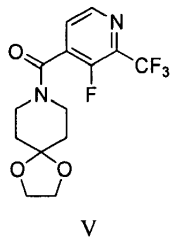
savienošanās reakcijas aģenta klātbūtnē.

16. Metode saskaņā ar 15. pretenziju, turklāt savienošanās reakcijas aģents ir benzotriazol-1-iloksi-*tris*(dimetilamino)fosfonija heksafluorofosfāts (BOP).

17. Metode savienojuma ar formulu (IV):



vai tā sāls iegūšanai, kas ietver aizsarggrupas atšķelšanu savienojumam ar formulu (V):



V

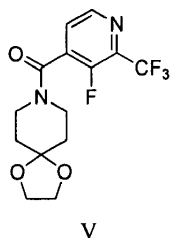
vai tā sālim, lai veidotu savienojumu ar formulu (IV) vai tā minēto sāli.

18. Metode saskaņā ar 17. pretenziju, turklāt minētā aizsarggrupas atšķelšana ietver pakļaušanu reakcijai ar ūdeni saturošu skābi.

19. Metode saskaņā ar 18. pretenziju, turklāt minētā skābe ir sāļsskābe.

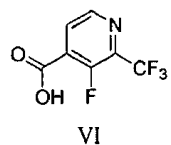
20. Metode saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 19. pretenzijai, turklāt savienojumi ar formulām (IV) un (V) katrs ir brīva bāze.

21. Metode savienojuma ar formulu (V):



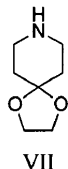
V

vai tā sāls iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (VI):



VI

vai tā sāls pakļaušanu reakcijai ar savienojumu ar formulu (VII):

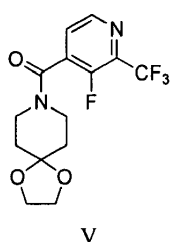


VII

vai tā sāli savienošanās reakcijas aģenta klātbūtnē, lai veidotu savienojumu ar formulu (V) vai tā minēto sāli.

22. Metode saskaņā ar 21. pretenziju, turklāt savienošanās reakcijas aģents ir benzotriazol-1-iloksi-*tris*(dimetilamino)fosfonijs heksafluorofosfāts (BOP).

23. Savienojums ar formulu (V):



V

vai tā sāls.

(51) C07D 471/04^(2006.01) (11) 2755972

A61P 9/06^(2006.01)

A61P 25/28^(2006.01)

A61K 31/4353^(2006.01)

(21) 11757271.9 (22) 12.09.2011

(43) 23.07.2014

(45) 28.10.2015

(86) PCT/EP2011/065713 12.09.2011

(87) WO2013/037389 21.03.2013

(73) SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR

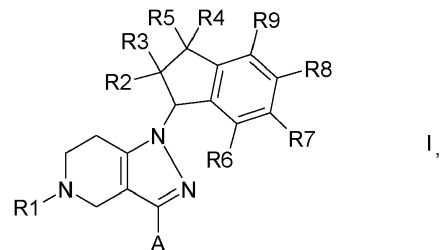
(72) BIALY, Laurent, DE
PERNERSTORFER, Josef, DE
WIRTH, Klaus, DE
STEINMEYER, Klaus, DE
HESSLER, Gerhard, DE

(74) Venne-Dunker, Sabine, et al, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Global Intellectual Property Department, Industriepark Höchst, Gebäude K 703, 65926 Frankfurt am Main, DE
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV

(54) **INDANILAIZVIETOTI 4,5,6,7-TETRAHIDRO-1H-PIR-AZOLO[4,3-c]PIRIDĪNI, TO IZMANTOŠANA PAR MEDIKAMENTIEM UN TOS SATUROŠI FARMACEITISKIE PREPARĀTI**

INDANYL-SUBSTITUTED 4,5,6,7-TETRAHYDRO-1H-PYR-AZOLO[4,3-C]PYRIDINES, THEIR USE AS MEDICAMENT, AND PHARMACEUTICAL PREPARATIONS COMPRISING THEM

(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



I,

kurā:

A ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5-locekļu vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkiloksigrupas, (C₁-C₆)alkil-S-, NC-, (C₁-C₆)alkil-OC(O)-, (C₁-C₆)alkil-SO₂-, (C₁-C₆)alkiloksi(C₁-C₆)alkil-grupas vai R¹²R¹³N-C(O)-,

kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R¹⁰-C(O)-, R¹¹-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-SO₂- vai R¹²R¹³N-C(O)(C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R2 ir H atoms, OH grupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkiloksigrupa, (C₁-C₆)alkil-C(O)O-;

R3 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa;

R4 ir H, F atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkil-atlikuma ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R5 ir H, F atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkil-atlikuma ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R6 līdz R9 katrs neatkarīgi ir izvēlēts no H, F, Cl, Br atoma, NC-, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₃-C₆)cikloalkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-SO₂-, (C₁-C₆)alkil-OC(O)-, (C₁-C₆)alkiloksigrupas-, (C₁-C₆)alkil-S-, kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R10 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkiloksigrupa, (C₁-C₆)alkil-S-, HO-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-O-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupa vai R¹²R¹³N-, kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

R11 ir H atoms, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, OH grupa, (C₁-C₆)alkil-oksigrupa vai (C₁-C₆)alkil-S-,

kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R12 un R13 katrs neatkarīgi ir H atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai savienojumu ar formulu (I) fizioloģiski pieņemams sāls.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

A ir fenil-, furanil-, furazanil-, imidazolil-, izotiazolil-, izoksazolil-, 1,2,3-oksadiazolil-, 1,2,4-oksadiazolil-, 1,2,5-oksadiazolil-, 1,3,4-oksadiazolil-, oksazolil-, pirazinil-, pirazolinil-, pirazolil-, pirdazil-, pirdil-, pirimidinil-, pirolil-, 1,2,3-tiadiazolil-, 1,2,4-tiadiazolil-, 1,2,5-tiadiazolil-, 1,3,4-tiadiazolil-, tiazolil-, tiofenil-, triazinil-, 1,2,3-triazolil-, 1,2,4-triazolil-, 1,2,5-triazolil- vai 1,3,4-triazolilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar 1, 2 vai 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl atoma, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S-, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-OC(O)-, (C₁-C₄)alkil-SO₂-, NC-, kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R¹⁰-C(O)-, R¹¹-(C₁-C₄)alkilgrupa vai (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, OH grupa, (C₁-C₄)alkiloksigrupa vai (C₁-C₄)alkil-C(O)O-;

R3 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa;

R4 ir H, F atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkilatlikuma ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R5 ir H, F atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkilatlikuma ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R6 līdz R9 katrs neatkarīgi ir izvēlēts no H, F, Cl, Br atoma, NC-, (C₁-C₄)alkilgrupas, ciklopropilgrupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-, (C₁-C₄)alkil-OC(O)-, (C₁-C₄)alkiloksigrupas, (C₁-C₄)alkil-S-, kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R10 ir (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, (C₁-C₄)alkiloksigrupa, (C₁-C₄)alkil-S-, HO-(C₁-C₄)alkilgrupa, (C₁-C₄)alkil-O-(C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropil(C₁-C₄)alkilgrupa, R¹²R¹³N-;

R11 ir H atoms, ciklopropilgrupa, OH grupa, (C₁-C₄)alkiloksigrupa, (C₁-C₄)alkil-S-, kur viens vai vairāki alkildaļu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R12 un R13 katrs neatkarīgi ir H atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai savienojumu ar formulu (I) fizioloģiski pieņemams sāls.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā:

A ir fenil-, pirdil-, pirazinil-, pirdazil-, pirimidinil-, pirazolil-, imidazolil-, izotiazolil-, tiazolil- vai tiofenilatlikums, kas neobligāti ir aizvietots ar 1, 2 vai 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl atoma, metoksigrupas, etoksigrupas, metilgrupas, etilgrupas, NC-, CF₃O-, CF₃ grupas;

R1 ir R¹⁰-C(O)-, R¹¹-(C₁-C₄)alkilgrupa vai CH₃-SO₂-;

R2 ir OH grupa, metoksigrupa, etoksigrupa, metil-C(O)O-, etil-C(O)O-;

R3 ir H atoms, metilgrupa;

R4, R5 ir H atoms;

R6 līdz R9 katrs neatkarīgi ir izvēlēts no H, F, Cl, Br atoma, NC-, metilgrupas, etilgrupas, ciklopropilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, metil-S-, etil-S-, CF₃ grupas;

R10 ir metilgrupa, etilgrupa, *n*-propilgrupa, izopropilgrupa, *n*-butilgrupa, izobutilgrupa, *sek*-butilgrupa, *terc*-butilgrupa, ciklopropilgrupa, metoksigrupa, etoksigrupa, (C₁-C₂)alkil-O-(C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropil(C₁-C₂)alkilgrupa, R¹²R¹³N-;

R11 ir H atoms, ciklopropilgrupa, metoksigrupa, etoksigrupa, CF₃ grupa;

R12 un R13 katrs neatkarīgi ir H atoms, metilgrupa vai etilgrupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai savienojumu ar formulu (I) fizioloģiski pieņemams sāls.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā:

A ir fenil-, pirdil-, izotiazolil-, tiazolil- vai tiofenilatlikums, kas neobligāti ir aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl atoma, metoksigrupas, metilgrupas, NC-, CF₃O-, CF₃ grupas;

R1 ir R¹⁰-C(O)-, R¹¹-(C_nH_{2n})-, izopropilgrupa, *terc*-butilgrupa vai CH₃-SO₂-, kur n ir 1, 2 vai 3;

R2 ir OH grupa, metoksigrupa;

R3 ir H atoms, metilgrupa;

R4, R5 ir H atoms;

R6 ir H atoms;

R7, R8 neatkarīgi ir izvēlēti no H, F, Cl, Br atoma;

R9 ir H, F, Cl, Br atoms, NC-, metilgrupa, etilgrupa, ciklopropilgrupa, metoksigrupa, etoksigrupa, metil-S-, etil-S- vai CF₃ grupa;

R10 ir metilgrupa, etilgrupa, *n*-propilgrupa, izopropilgrupa, *n*-butilgrupa, izobutilgrupa, *terc*-butilgrupa, ciklopropilgrupa, metoksigrupa, metoksimetilgrupa;

R11 ir H atoms, ciklopropilgrupa, metoksigrupa, CF₃ grupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai savienojumu ar formulu (I) fizioloģiski pieņemams sāls.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-propionil-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-ciklopropānkarbonil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(3-trifluormetoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[3-(3-hlorfenil)-1-((1*S*,2*S*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(2-fluor-5-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4-brom-6-fluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-6-fluor-2-hidroksi-4-metilindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(6-trifluormetilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[5-ciklopropānkarbonil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzamīda;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-izobutiril-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-(3-cianofenil)-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-karbonskābes metilestera;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluor-3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-dihlor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-((1*S*,2*S*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

racēmiska 1-[1-((1*S*,2*S*)-4,6-difluor-2-hidroksi-2-metilindan-1-il)-3-(4-fluor-3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-(3,3,3-trifluorpropil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzamīda;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4-hlor-6-fluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-6-hlor-4-fluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(3-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-metoksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[(*S*)-3-(4-fluorfenil)-1-indan-1-il]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4-ciklopropil-6-fluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

(1*R*,2*R*)-1-[5-ciklopropilmetil-3-(4-fluorfenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-1-il]-4,6-difluorindan-2-ola;

propionskābes (1*R*,2*R*)-1-[3-(3-cianofenil)-5-propionil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-1-il]-4,6-difluorindan-2-ilestera;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-dihlor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(6-trifluormetilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

(1*R*,2*R*)-4,6-difluor-1-[3-(4-fluorfenil)-5-(2-metoksietil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-1-il]indan-2-ola;

1-[1-((1*R*,2*R*)-6-hlor-4-fluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

(1*R*,2*R*)-4,6-difluor-1-[3-(4-fluorfenil)-5-propil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-1-il]indan-2-ola;

3-[5-acetil-1-((1*S*,2*S*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-6-hlor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[(1*R*)-3-(4-fluorfenil)-1-indan-1-il-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-(2-metoksiacetil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*S*,2*S*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(3-trifluormetoksi-*fenil*)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-6-hlor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

3-[5-ciklopropilmetil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-(2,2-dimetilpropionil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4-etil-6-fluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-(2-metoksietil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-6-fluor-2-hidroksi-4-metilsulfanilindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-(3,3,3-trifluorpropil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzamīda;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-5-(2,2-dimetilpropionil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

racēmiska 1-[1-((1*R*,2*R*)-5,6-dihlor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-metoksiindan-1-il)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[3-(3-hlorfenil)-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

racēmiska 3-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksi-2-metilindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-*p*-tolil-1,4,6,7-tetrahidro-pirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluor-3-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

5-[5-acetil-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]-2-fluorbenzonitrila;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(3-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[3-(4-hlorfenil)-1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

racēmiska 1-[1-((1*R*,2*R*)-5,7-dihlor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

1-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-difluor-2-hidroksiindan-1-il)-3-(4-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-5-il]etanona;

(1*R*,2*R*)-4,6-difluor-1-[3-(4-fluorfenil)-5-izopropil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-1-il]indan-2-ola;

(1*R*,2*R*)-1-[5-acetil-3-(3-cianofenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-*c*]piridin-1-il]-6-fluor-2-hidroksiindan-4-karbonitrila;

3-[1-((1*R*,2*R*)-4,6-dihlor-2-hidroksiindan-1-il)-5-metansulfonil-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridin-3-il]benzonitrila;

to stereozomērām formām un/vai to fizioloģiski pieņemamiem sāļiem.

6. Medikaments, kas satur savienojumu ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai.

7. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai TASK-1 kanāla mediētu slimību ārstēšanā vai novēršanā.

8. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai aritmiju, it īpaši priekškambaru tahiaritmiju, priekškambaru fibrilācijas un priekškambaru mirgošanas, ārstēšanā vai novēršanā.

9. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai ar miegu saistītu elpošanas traucējumu, centrālas un obstruktīvas miega apnojas sindroma, augšējo elpceļu rezistences sindroma, Čeina-Stoksa sindroma, krākšanas, traucētas elpošanas centra darbības, zīdaiņu pēkšņās nāves sindroma, pēcoperācijas hipoksijas un apnojas, elpošanas traucējumu, kas saistīti ar elpošanas muskuļiem, elpošanas traucējumu pēc atradināšanas no ilgstošas plaušu mākslīgās ventilācijas, elpošanas traucējumu, kas rodas adaptācijas laikā augstu kalnos, akūtu elpošanas traucējumu,

hronisku plaušu traucējumu ar hipoksiju un hiperkapniju, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS) un ar aptaukošanos saistīta hipoventilācijas sindroma ārstēšanā un novēršanā.

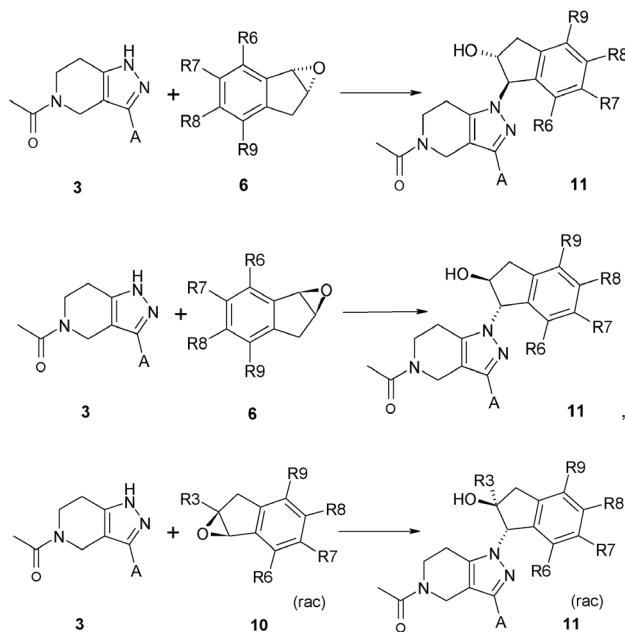
10. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai par elpošanas stimulēšanas līdzekli respiratoras depresijas ārstēšanai vai novēršanai, kas ir asociēta ar anestēziju vai sedatīvām procedūrām nelielu operāciju laikā vai diagnostiskos nolūkos.

11. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai par elpošanas stimulēšanas līdzekli respiratoras depresijas ārstēšanai vai novēršanai, kas ir izraisīta ar opioīdiem hronisku sāpju ārstēšanas laikā, it īpaši vēža vai paliatīvās aprūpes, vai sedatīvo procedūru gadījumā, un/vai atradināšanai no ilgstošas plaušu mākslīgās ventilācijas.

12. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai multiplās sklerozes un centrālās nervu sistēmas iekaisīgu vai deģeneratīvu traucējumu ārstēšanā vai novēršanā.

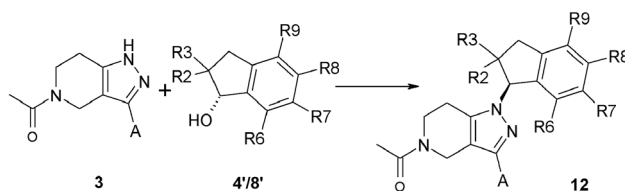
13. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai ar intravenozu ievadīšanu, perorālu ievadīšanu, nazālu ievadīšanu, intramuskulāru ievadīšanu, subkutānu ievadīšanu, ievadīšanu ar inhalāciju, vietēju ievadīšanu vai faringālu ievadīšanu.

14. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai iegūšanai, kas ietver 4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridīnu (3) pakļaušanu reakcijai ar epoksīdiem (6) vai (10), lai iegūtu 2-hidroksiindan-1-il-aizvietotus 4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridīnus (11), karsējot savienojuma (3) un epoksīda (6) maisījumu bāzes pārākuma klātbūtnē inertā šķīdinātājā vai deprotonējot savienojumu (3) ar bāzi un to alkilējot ar epoksīdu (6):



kur atlikumiem A, R3, R6, R7, R8, R9 ir tāda pati nozīme kā norādīts no 1. līdz 5. pretenzijai.

15. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai iegūšanai, kas ietver 4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-pirazolo[4,3-*c*]piridīna (3) pakļaušanu reakcijai ar aminoindan-1-oliem (4') vai (8'), sakarsējot savienojuma (3) un aminoindan-1-ola (4') vai (8') maisījumu fosfīna un 1,1'-(azodikarbonil)-savienojuma klātbūtnē, lai iegūtu savienojumu (12):



kur atlikumiem A, R3, R6, R7, R8, R9 ir tāda pati nozīme kā norādīts no 1. līdz 5. pretenzijai un kur R2 ir H atoms vai (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkiloksigrupa, (C₁-C₆)alkil-C(O)O-grupa.

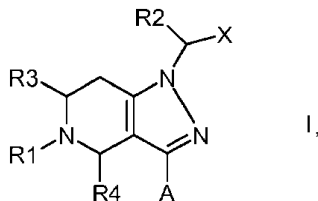
(51) **C07D 471/04**^(2006.01) (11) **2755973**
C07D 471/18^(2006.01)
A61K 31/437^(2006.01)
A61K 31/439^(2006.01)
A61P 9/06^(2006.01)

(21) 11757858.3 (22) 16.09.2011
(43) 23.07.2014
(45) 04.11.2015
(86) PCT/EP2011/066061 16.09.2011
(87) WO2013/037415 21.03.2013
(73) SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR

(72) BIALY, Laurent, DE
LORENZ, Katrin, DE
WIRTH, Klaus, DE
STEINMEYER, Klaus, DE
HESSLER, Gerhard, DE
PERNERSTORFER, Josef, DE
BRENDDEL, Joachim, DE
(74) Venne-Dunker, Sabine, et al, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Global Intellectual Property Department, Industriepark Höchst, Gebäude K 703, 65926 Frankfurt am Main, DE
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV

(54) **INDANILAIZVIETOTI 4,5,6,7-TETRAHIDRO-1H-PIR-AZOLO[4,3-c]PIRIDĪNI, TO IZMANTOŠANA PAR MEDIKAMENTIEM UN TOS SATUROŠI FARMACEITISKIE PREPARĀTI**
SUBSTITUTED 4,5,6,7-TETRAHYDRO-1H-PYRAZOLO[4,3-C]PYRIDINES, THEIR USE AS MEDICAMENT, AND PHARMACEUTICAL PREPARATIONS COMPRISING THEM

(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kurā:

A ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

X ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atomiem, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₆)alkil-SO₂-,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;
R2 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;
R3 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;
R4 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido (C₂-C₃)alkilēngrupas tiltiņu;

R5 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-O-, (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-(C₁-C₆)alkilgrupa, HO-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₆-C₁₀)arilgrupa, (C₆-C₁₀)aril(C₁-C₆)alkilgrupa, R₇R₈N-, heteroarilgrupa, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, alifātisks heterocikls,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas un 4- līdz 7-locekļu alifātiskiem heterocikliem, kas satur skābekļa atomu, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkilgrupas, un

kur heteroarilatlīkumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-CN-, (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R6 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kur viens alkilgrupas ūdeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu vai (C₁-C₆)alkil-O-atlikumu, un

kur viens vai vairāki alkilgrupas ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

R7 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa;

kur viens vai vairāki alkilgrupas ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceitiski pieņemami sāļi, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2, R3 un R4 ir H atoms, un A ir 4-fluorfenilgrupa, X atlikums nav fenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-acetoksifenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa, un ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2, R3 un R4 ir H atoms, un X ir fenilatlikums, A atlikums nav fenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-etiloksifenilgrupa, 3-trifluorometilfenilgrupa, 2-tiofenilgrupa vai 4-metiltiofenilgrupa, un ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2 ir metilgrupa, un R3 un R4 ir H atoms, un A ir 4-flourfenilgrupa, X atlikums nav fenilgrupa.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas vai tiofen-3-ilgrupas, kur fenilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar no 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

X ir 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, kur heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietota ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;

R3 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa;

R4 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido (C₂-C₃)alkilēngrupas tiltiņu;

R5 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-O-, (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-(C₁-C₆)alkilgrupa, HO-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₆-C₁₀)arilgrupa, (C₆-C₁₀)aril(C₁-C₆)alkilgrupa, R₇R₈N-, heteroarilgrupa, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, alifātisks heterocikls, kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas un 4- līdz 7-locekļu alifātiskiem heterocikliem, kas satur skābekļa atomu, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkilgrupas, un

kur heteroarilatlīkumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz

3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R6 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kur viens alkilgrupas udeņraža atoms var būt aizstāts ar OH- vai (C₁-C₆)alkil-O-atlikumu, un kur viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

R7 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O- un (C₁-C₄)alkil-S-, kur alkildaļu viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

X ir 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas,

kur heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietota ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₆)alkil-SO₂-,

kur alkildaļu viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 ir H atoms, metilgrupa;

R4 ir H atoms, metilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido etilēngrupas tiltiņu;

un kur R5 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₂)alkil-O-, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₄)alkil-O-metilgrupa, HO-(C₁-C₂)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₂)alkilgrupa, fenilgrupa, fenil(C₁-C₂)alkilgrupa, R7R6N-, heteroarilgrupa, heteroaril(C₁-C₄)alkilgrupa, alifātisks heterocikls,

kur alkildaļu viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, un

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, oksetanilgrupas, tetrahidofuranilgrupas un tetrahidropiranilgrupas, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkilgrupas, un

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-,

kur heteroarilatlikumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas, izotiazol-3-ilgrupas, izotiazol-4-ilgrupas, izotiazol-5-ilgrupas, pirazol-3-ilgrupas, pirazol-4-ilgrupas, imidazol-2-ilgrupas, imidazol-4-ilgrupas, pirimidin-2-ilgrupas, pirimidin-4-ilgrupas, pirimidin-5-ilgrupas, piridazin-3-ilgrupas, piridazin-4-ilgrupas, pirazin-2-ilgrupas un pirazin-3-ilgrupas, un

kur heteroarilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R6 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur alkilgrupas viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar OH grupu, metoksiatlikumu vai etoksiatlikumu; un

R7 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas,

kur minētie atlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 un R4 ir H atoms;

R5 ir metilgrupa, etilgrupa, *n*-propilgrupa, izopropilgrupa, *n*-butilgrupa, izobutilgrupa, *tert*-butilgrupa, ciklopropilgrupa vai ciklobutilgrupa;

un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt:

A ir 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, kur heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietota ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, kur alkildaļu viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

X ir fenilgrupa, tiofen-2-ilgrupa vai tiofen-3-ilgrupa, kur minētie atlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₆)alkil-SO₂-,

kur alkildaļu viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;

R3 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

R4 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido (C₂-C₃)alkilēngrupas tiltiņu;

R5 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-O-, (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-(C₁-C₆)alkilgrupa, HO-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₆-C₁₀)arilgrupa, (C₆-C₁₀)aril(C₁-C₆)alkilgrupa, R₇R₆N-, heteroarilgrupa heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, alifātisks heterocikls, kur alkildaļu viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, un

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas un 4- līdz 7-locekļu alifātiskiem heterocikliem, kas satur skābekļa atomu, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkilgrupas, un

kur heteroarilatlikumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R6 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kur viens alkilgrupas udeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu vai (C₁-C₆)alkil-O-atlikumu, un

kur viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R7 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi, ar nosacījumu, ka A nav 4-metiltofēnilgrupa, ja savienojums ar formulu (I) R5 ir metilgrupa un R2, R3 un R4 ir udeņraža atoms, un X ir fenilgrupa.

6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt:

A ir 2-piridilgrupa, 3-piridilgrupa vai 4-piridilgrupa, kur piridilatlikumi ir aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir fenilgrupa, tiofen-2-ilgrupa vai tiofen-3-ilgrupa, kur minētie atlikumi ir aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 un R4 ir H atoms; un

R5 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa, *n*-propilgrupa, izopropilgrupa, *n*-butilgrupa, izobutilgrupa vai *tert*-butilgrupa, vai kur R5 ir ciklopropilgrupa, ciklobutilgrupa, ciklopentilgrupa vai (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₂)alkilgrupa, vai kur R5 ir (C₁-C₂)alkil-O-, (C₁-C₂)alkil-S- vai OCF₃ grupa, vai kur R5 ir (C₁-C₄)alkil-O-metilgrupa, HO-(C₁-C₂)alkilgrupa, vai kur R5 ir fenilgrupa vai fenilmetilgrupa, kur fenilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas (C₁-C₂)alkilgrupas, (C₁-C₂)alkil-O-, CN grupas, metil-SO₂-, vai kur R5 ir R7R6N-, kur

R6 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur viens alkilgrupas udeņraža atoms var būt aizstāts ar OH-, metoksiatlikumu vai etoksiatlikumu, un

R7 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa, vai

kur R5 ir heteroarilgrupa, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, kur heteroarilatlikumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas, izotiazol-3-ilgrupas, izotiazol-4-ilgrupas, izotiazol-5-ilgrupas, pirazol-3-ilgrupas, pirazol-4-ilgrupas, imidazol-2-ilgrupas, imidazol-4-ilgrupas, pirimidin-2-ilgrupas, pirimidin-4-ilgrupas, pirimidin-5-ilgrupas, piridazin-3-ilgrupas, piridazin-4-ilgrupas, pirazin-2-ilgrupas un pirazin-3-ilgrupas, un

kur heteroarilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-, vai kur R5 ir alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, oksetanilgrupas un tetrahidrofuranilgrupas, tetrahidropirānilgrupas, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no grupas: F atoms, OH grupa, (C₁-C₂)alkil-O- un (C₁-C₄)alkilgrupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozīmēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₂)alkil-O- un (C₁-C₂)alkil-S-, kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

X ir fenilgrupa,

kur fenilgrupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O-, (C₁-C₄)alkil-S-, (C₁-C₄)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₂)alkil-SO₂-, kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;

R3 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

R4 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido (C₂-C₃)alkilēngrupas tiltiņu;

R5 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-O-, (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-(C₁-C₆)alkilgrupa, HO-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₆-C₁₀)arilgrupa, (C₆-C₁₀)aril(C₁-C₆)alkilgrupa, R7R6N-, heteroarilgrupa, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, alifātisks heterocikls, kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, un

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas un no 4- līdz 7-locekļu alifātiskiem heterocikliem, kas satur skābekļa atomu, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 līdz

3 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkilgrupas, un

kur heteroarilatlikumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R6 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kur viens alkilgrupas udeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu vai (C₁-C₆)alkil-O-atlikumu, un

kur viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R7 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa,

kur viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2, R3 un R4 ir H atoms, un A ir 4-fluorfenilgrupa, X atlikums nav fenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-acetoksifenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2, R3 un R4 ir H atoms, un X ir fenilatlikums, A atlikums nav fenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-etiloksifenilgrupa vai 3-trifluormetilfenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2 ir metilgrupa, un R3 un R4 ir H atoms, un A ir 4-fluorfenilgrupa, X atlikums nav fenilgrupa.

8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R1 ir R5-C(=O)- vai metil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 ir H atoms, metilgrupa;

R4 ir H atoms, metilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido etilēngrupas tiltiņu;

un kur R5 ir heteroarilgrupa vai heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, kur heteroarilatlikumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas, izotiazol-3-ilgrupas, izotiazol-4-ilgrupas, izotiazol-5-ilgrupas, pirazol-3-ilgrupas, pirazol-4-ilgrupas, imidazol-2-ilgrupas, imidazol-4-ilgrupas, pirimidin-2-ilgrupas, pirimidin-4-ilgrupas, pirimidin-5-ilgrupas, piridazin-3-ilgrupas, piridazin-4-ilgrupas, pirazin-2-ilgrupas un pirazin-3-ilgrupas, un

kur heteroarilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, metilgrupas, etilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, CN grupas, metil-SO₂-, vai

kur R5 ir H atoms, vai

kur R5 ir ciklopropilgrupa, ciklobutilgrupa, ciklopentilgrupa, cikloheksilgrupa vai (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₂)alkilgrupa, vai

kur R5 ir (C₁-C₂)alkil-O- vai (C₁-C₂)alkil-S-, vai

kur R5 ir (C₁-C₄)alkil-O-metilgrupa, HO-(C₁-C₂)alkilgrupa, vai

kur R5 ir fenilgrupa vai fenilmetilgrupa,

kur fenilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₂)alkilgrupas, (C₁-C₂)alkil-O-, CN grupas, metil-SO₂-, un kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir R7R6N-, kur:

R6 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur viens alkilgrupas udeņraža atoms var būt aizstāts ar hidroksilgrupu, metoksiatlikumu vai etoksiatlikumu, un

R7 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa; vai

kur R5 ir alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no oksetanilgrupas, tetrahidrofuranilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₂)alkil-O- un (C₁-C₄)alkilgrupas; un kur viens vai vairāki alkilgrupu udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

9. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R1 ir R5-C(=O)-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 ir H atoms, metilgrupa;

R4 ir H atoms, metilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido etilēngrupas tiltni;

un kur R5 ir (C₂-C₆)alkilgrupa, vai

kur R5 ir metilgrupa,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2, R3 un R4 ir H atoms, un A ir 4-fluorfenilgrupa, X atlikums nav fenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-acetoksifenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa; un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt:

A ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

A ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₆)alkil-SO₂-,

kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;

R3 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

R4 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido (C₂-C₃)alkilēngrupas tiltni;

un kur R5 ir heteroarilgrupa vai heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa,

kur heteroarilatlikumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur heteroarilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-,

kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav pirimidin-4-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 1-metilpirazol-3-ilgrupa vai 1-metilimidazol-2-ilgrupa, vai

kur R5 ir metilgrupa,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir udeņraža atoms un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A nav piridin-3-ilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa,

3-cianofenilgrupa, 3-metoksifenilgrupa, 3-trifluorometoksifenilgrupa, 2-fluor-5-metoksifenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir udeņraža atoms un X ir 3-cianofenilatlikums, A nav 4-fluorfenilatlikums,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R3 ir metilgrupa, R2 un R4 ir udeņraža atomi un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir udeņraža atoms un X ir fenilgrupa, A nav fenilgrupa, 3-trifluorometilfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-etiloksifenilgrupa, 4-acetoksifenilgrupa, 4-metiltofienilgrupa, 2-tiofenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir udeņraža atoms un A ir 4-fluorfenilgrupa, X nav fenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-etiloksi-fenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R5 ir metilgrupa un R2 ir metilgrupa, un R3 un R4 ir H atoms, un A ir 4-fluorfenilgrupa, atlikums X nav fenilgrupa, vai

kur R5 ir H atoms, (C₂-C₆)alkilgrupa, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupa, kur alkilatlikuma viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir (C₃-C₆)cikloalkilgrupa vai (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₄)alkilgrupa, ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav ciklopropilgrupa, vai

kur R5 ir (C₁-C₄)alkil-O- vai (C₁-C₄)alkil-S-,

kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir (C₁-C₄)alkil-O-(C₁-C₂)alkilgrupa, HO-(C₁-C₄)alkilgrupa, vai kur R5 ir fenilgrupa, fenil-(C₁-C₄)alkilgrupa,

kur fenilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-, un kur alkildaļa viens vai vairāki udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav 3-metilsulfonilfenilatlikums vai 4- metilsulfonilfenilatlikums, vai kur R5 ir R₇R₆N-, kur:

R6 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur viens alkilgrupas udeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu, metoksi-atlikumu vai etoksiatlikumu, un

R7 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa; vai

kur R5 ir alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no oksetanilgrupas, tetrahidrofuranilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₄)alkil-O- un (C₁-C₄)alkilgrupas, un

kur viens vai vairāki alkilgrupu udeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav 3-metiloksetan-3-ilgrupa, tetrahidrofuran-3-ilgrupa, tetrahidropiran-4-ilgrupa vai 1-metil-piperidin-4-ilgrupa.

11. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa, piridin-2-ilgrupa, piridin-3-ilgrupa, piridin-4-ilgrupa, tiofen-2-ilgrupa vai tiofen-3-ilgrupa,

kur minētie atlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₂)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-, vai piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas,

kur minētie atlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R₁ ir R₅-C(=O)- vai (C₁-C₂)alkil-SO₂-;

R₂ ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropilgrupa;

R₃ ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa;

R₄ ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa;

vai turklāt R₃ un R₄ kopā veido etilēngrupas tiltni;

un kur R₅ ir heteroarilgrupa vai heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa,

kur heteroarilatlikumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas, izotiazol-3-ilgrupas, izotiazol-4-ilgrupas, izotiazol-5-ilgrupas, pirazol-3-ilgrupas, pirazol-4-ilgrupas, imidazol-2-ilgrupas, imidazol-4-ilgrupas, pirimidin-2-ilgrupas, pirimidin-4-ilgrupas, pirimidin-5-ilgrupas, piridazin-3-ilgrupas, piridazin-4-ilgrupas, pirazin-2-ilgrupas un pirazin-3-ilgrupas, un

kur minētie atlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, metilgrupas, etilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, CN grupas, metil-SO₂-, ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R₅ nav pirimidin-4-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 1-metilpirazol-3-ilgrupa vai 1-metilimidazol-2-ilgrupa, vai

kur R₅ ir metilgrupa, ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atoms un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A nav piridin-3-ilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 3-cianofenilgrupa, 3-metoksifenilgrupa, 3-trifluormetoksifenilgrupa, 2-fluor-5-metoksifenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atomi un X ir 3-cianofenilatlikums, A nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₃ ir metilgrupa, R₂ un R₄ ir ūdeņraža atomi un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A atlikums nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atoms un X ir fenilatlikums, A nav fenilatlikums, 3-trifluormetilfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-etiloksifenilgrupa, 2-tiofenilgrupa, 4-metiltiofenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atoms un A ir 4-fluorfenilgrupa, X nav 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-etoksifenilgrupa vai 4-acetoksifenilgrupa, vai

kur R₅ ir H atoms, (C₂-C₄)alkilgrupa, CF₃ grupa, vai kur R₅ ir ciklopropilgrupa, ciklobutilgrupa, ciklopentilgrupa, cikloheksilgrupa vai (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₂)alkilgrupa,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R₅ nav ciklopropilgrupa, vai

kur R₅ ir (C₁-C₂)alkil-O- vai (C₁-C₂)alkil-S-, kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R₅ ir (C₁-C₄)alkil-O-metilgrupa, HO-(C₁-C₂)alkilgrupa, kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R₅ ir fenilgrupa, fenil(C₁-C₂)alkilgrupa, kur fenilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₂)alkilgrupas, (C₁-C₂)alkil-O-, CN grupas, metil-SO₂-, un

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R₅ nav 3-metilsulfonilfenilatlikums vai 4-metilsulfonilfenilatlikums, vai

kur R₅ ir R₇R₆N-, kur:
R₆ ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur viens alkilgrupas ūdeņraža atoms var būt aizstāts ar hidroksilgrupu, metoksiatlikumu vai etoksiatlikumu, un

R₇ ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa; vai

kur R₅ ir alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no oksetanilgrupas, tetrahidrofuranilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, un

kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₂)alkil-O- un (C₁-C₄)alkilgrupas, un kur viens vai vairāki alkilgrupu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R₅ nav 3-metiloksetan-3-ilgrupa, tetrahidrofuran-3-ilgrupa, tetrahidropiran-4-ilgrupa vai 1-metilpiperidin-4-ilgrupa;

un/vai savienojuma ar formulu (I) stereiozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceitiski pieņemami sāļi.

12. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1, 2 vai 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O- un (C₁-C₂)alkil-S-,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

X ir fenilgrupa,

kur fenilgrupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, (C₁-C₄)alkil-O-, (C₁-C₄)alkil-S-, (C₁-C₄)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₄)alkil-SO₂-,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu; un

R₁ ir R₅-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;

R₂ ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;

R₃ ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

R₄ ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

vai turklāt R₃ un R₄ kopā veido (C₂-C₃) alkilēngrupas tiltni;

un kur R₅ ir heteroarilgrupa vai heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, kur heteroarilatlikumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur heteroarilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R₅ nav pirimidin-4-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 1-metilpirazol-3-ilgrupa vai 1-metilimidazol-2-ilgrupa, vai

kur R₅ ir metilgrupa, ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atomi un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A nav piridin-3-ilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 3-cianofenilgrupa, 3-metoksifenilgrupa, 3-trifluormetoksifenilgrupa, 2-fluor-5-metoksifenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atomi un X ir 3-cianofenilatlikums, A nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₃ ir metilgrupa, R₂ un R₄ ir ūdeņraža atomi un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A atlikums nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atomi un X ir fenilatlikums, A nav fenilatlikums, 3-trifluormetilfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-etiloksifenilgrupa, 4-metiltiofenilgrupa, 2-tiofenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R₂, R₃ un R₄ ir ūdeņraža atomi un A ir 4-fluorfenilgrupa, X nav fenilgrupa, 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-etiloksifenilgrupa, 4-acetoksifenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad R₅ ir metilgrupa un R₂ ir metilgrupa, un R₃ un R₄ ir H atoms, un A ir 4-fluorfenilgrupa, atlikums X nav fenilgrupa, vai

kur R₅ ir H atoms, (C₂-C₆)alkilgrupa, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupa, kur alkilatlikuma viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir (C₃-C₆)cikloalkilgrupa vai (C₃-C₆)cikloalkil-(C₁-C₄)-alkilgrupa,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav ciklopropilgrupa, vai

kur R5 ir (C₁-C₄) alkil-O- vai (C₁-C₄)alkil-S-,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir (C₁-C₄)alkil-O-(C₁-C₂)alkilgrupa, HO-(C₁-C₄)alkilgrupa, vai

kur R5 ir fenilgrupa, fenil-(C₁-C₄)alkilgrupa,

kur fenilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-, un kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav 3-metilsulfonilfenilatlikums vai 4-metilsulfonilfenilatlikums, vai

kur R5 ir R₇R₆N-, kur:

R6 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur viens alkilgrupas ūdeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu, metoksiatlikumu vai etoksiatlikumu, un

R7 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa; vai

kur R5 ir alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no oksetanilgrupas, tetrahidrofuranilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, un

kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₄)alkil-O- un (C₁-C₄)alkilgrupas, un

kur viens vai vairāki alkilgrupu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav 3-metiloksetan-3-ilgrupa, tetrahidrofuran-3-ilgrupa, tetrahidropiran-4-ilgrupa vai 1-metil-piperidin-4-ilgrupa;

R6 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kur viens alkilgrupas ūdeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu vai (C₁-C₆)alkil-O-atlikumu, un

kur viens vai vairāki alkilgrupas ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R7 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa,

kur viens vai vairāki alkilgrupas ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu.

13. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R1 ir R5-C(=O)- vai metil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 ir H atoms, metilgrupa;

R4 ir H atoms, metilgrupa;

vai turklāt R3 un R4 kopā veido etilēngrupas tiltni;

un kur R5 ir heteroarilgrupa vai heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa,

kur heteroarilatlikumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridin-2-ilgrupas, piridin-3-ilgrupas, piridin-4-ilgrupas, tiofen-2-ilgrupas, tiofen-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, tiazol-4-ilgrupas, tiazol-5-ilgrupas, izotiazol-3-ilgrupas, izotiazol-4-ilgrupas, izotiazol-5-ilgrupas, pirazol-3-ilgrupas, pirazol-4-ilgrupas, imidazol-2-ilgrupas, imidazol-4-ilgrupas, pirimidin-2-ilgrupas, pirimidin-4-ilgrupas, pirimidin-5-ilgrupas, piridazin-3-ilgrupas, piridazin-4-ilgrupas, pirazin-2-ilgrupas un pirazin-3-ilgrupas, un

kur minētie atlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, metilgrupas, etilgrupas, metoksigrupas, etoksigrupas, CN grupas, metil-SO₂-, ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I)

A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav pirimidin-4-ilgrupa, piridin-2-ilgrupa, 1-metilpirazol-3-ilgrupa vai 1-metilimidazol-2-ilgrupa, vai

kur R5 ir metilgrupa,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir ūdeņraža atomi un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A nav piridin-3-ilgrupa, 2-fluorfenilgrupa, 3-fluorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 3-cianofenilgrupa, 3-metoksifenilgrupa, 3-trifluorometoksifenilgrupa, 2-fluor-5-metoksifenilgrupa, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir ūdeņraža atomi un X ir 3-cianofenilatlikums, A nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R3 ir metilgrupa, R2 un R4 ir ūdeņraža atomi un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, A nav 4-fluorfenilatlikums, un

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) R2, R3 un R4 ir ūdeņraža atomi un A ir 4-fluorfenilatlikums, X nav 2-hlorfenilgrupa, 3,4-dihlorfenilgrupa, 4-hlorfenilgrupa, 4-fluorfenilgrupa, 4-metilfenilgrupa, 4-metoksifenilgrupa, 4-etoksifenilgrupa vai 4-acetoksifenilgrupa, vai

kur R5 ir H atoms, (C₂-C₄)alkilgrupa, CF₃ grupa, vai

kur R5 ir ciklopropilgrupa, ciklobutilgrupa, ciklopentilgrupa, cikloheksilgrupa vai (C₃-C₆)cikloalkil-(C₁-C₂)alkilgrupa,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav ciklopropilgrupa, vai

kur R5 ir (C₁-C₂)alkil-O- vai (C₁-C₂)alkil-S-,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir (C₁-C₄)alkil-O-metilgrupa, HO-(C₁-C₂)alkilgrupa,

kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu, vai

kur R5 ir fenilgrupa, fenil(C₁-C₂)alkilgrupa,

kur fenilatlikumi ir neobligāti aizvietoti ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₂)alkilgrupas, (C₁-C₂)alkil-O-, CN grupas, metil-SO₂-, un kur alkildaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav 3-metilsulfonilfenilatlikums, 4-metilsulfonilfenilatlikums, vai kur R5 ir R7R6N-, kur:

R6 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, ciklopropilgrupa, kur viens alkilgrupas ūdeņraža atoms var būt aizstāts ar hidroksilgrupu, metoksiatlikumu vai etoksiatlikumu, un

R7 ir H atoms, metilgrupa, etilgrupa; vai

kur R5 ir alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no oksetanilgrupas, tetrahidrofuranilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas, un

kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₂)alkil-O- un (C₁-C₂)alkilgrupas, un

kur viens vai vairāki alkilgrupu ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu,

ar nosacījumu, ka gadījumā, kad savienojumos ar formulu (I) A ir 3-cianofenilatlikums un X ir 2,4-difluorfenilatlikums, R5 nav 3-metiloksetan-3-ilgrupa, tetrahidrofuran-3-ilgrupa, tetrahidropiran-4-ilgrupa vai 1-metilpiperidin-4-ilgrupa;

un/vai savienojuma ar formulu (I) stereoizomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

14. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt:

A ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir neobligāti aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₂)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas un (C₁-C₂)alkil-S-;

X ir fenilgrupa,

kur fenilatlikums ir aizvietots ar 1 vai 2 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, CF₃, CF₂H, CFH₂ grupas, metoksigrupas, etoksigrupas, OCF₃ grupas, (C₁-C₂)alkil-S-, (C₁-C₂)alkil-O-C(O)- un metil-SO₂-;

R1 ir R5-C(=O)-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₂)alkilgrupa, ciklopropilgrupa;

R3 ir H atoms, metilgrupa;
 R4 ir H atoms, metilgrupa;
 vai turklāt R3 un R4 kopā veido etilēngrupas tiltiņu;
 un kur R5 ir (C₂-C₄)alkilgrupa;
 un/vai savienojuma ar formulu (I) stereozomēra forma un/vai šo formu maisījumi, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

15. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

3-(3-cianofenil)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes izopropilamīda;
 3-(4-fluorfenil)-1-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes etilamīda;
 3-(4-fluorfenil)-1-[(R)-1-(4-fluorfenil)etil]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes etilamīda;
 3-(4-fluorfenil)-1-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes *terc*-butilamīda;
 3-(3-cianofenil)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes etilamīda;
 3-(3-cianofenil)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes metilamīda;
 3-(4-fluorfenil)-1-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il)-morfolin-4-il-metanaona;
 {3-(4-fluorfenil)-1-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il)-((S)-3-hidroksipirolidin-1-il)metanaona;
 3-(3-cianofenil)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes dimetilamīda;
 3-(3-cianofenil)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes-(2-hidroksietil)metilamīda;
 2-[5-acetil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]izonikotinonitrila;
 6-[5-acetil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]-piridin-2-karbonitrila;
 3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(2-hidroksiacetil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;
 3-[5-acetil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(3-metilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-metoksipiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2-metiliazol-4-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-tiazol-2-ilmetil-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-tiofen-2-il-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(5-hlortiofen-2-ilmetil)-3-*m*-tolil-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(5-hlortiofen-2-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 3-[5-acetil-1-(5-hlortiofen-2-ilmetil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;
 1-[3-(3-hlorfenil)-1-(5-hlortiofen-2-ilmetil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(5-hlortiofen-2-il)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-tiofen-3-il-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 4-[5-acetil-3-(3-trifluormetilfenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-1-ilmetil]benzonitrila;
 3-[5-acetil-1-[1-(4-fluorfenil)etil]-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;
 1-[1-[ciklopropil-(4-fluorfenil)metil]-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(3-trifluormetoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,6-difluorbenzil)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-{3-(4-fluorfenil)-1-[1-(4-fluorfenil)etil]-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(4-fluorfenil)-1-(4-trifluormetilbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(3-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;

1-[3-(4-fluorfenil)-1-(3-trifluormetilbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-[1-(4-fluorfenil)etil]-3-(3-trifluormetoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-fluor-3-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 3-[5-acetil-1-(2,5-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-*m*-tolil-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(6-hlorpiridin-3-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(3-hlorfenil)-1-(4-fluor-2-metilbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2-fluorbenzil)-3-*m*-tolil-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2-metoksibenil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(3-hlorfenil)-1-(3-metoksibenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(4-hlor-3-fluorbenzil)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(2-fluor-5-metoksifenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 5-[5-acetil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]-2-fluorbenzonitrila;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(3-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-[(R)-1-(4-hlorfenil)propil]-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-[(S)-1-(4-hlorfenil)propil]-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2-fluor-4-metilbenzil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(4-hlorpiridin-3-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(3-metilpiridin-2-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(4-fluorbenzil)-3-(6-trifluormetilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-trifluormetilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(6-trifluormetilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(4-brompiridin-2-il)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(2-brompiridin-4-il)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(5-brompiridin-3-il)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 3-[11-acetil-5-(2,4-difluorbenzil)-4,5,11-triazatriciklo[6,2,1,02,6]undeka-2(6),3-dien-3-il]benzonitrila;
 1-[5-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-fluorfenil)-4,5,11-triazatriciklo[6,2,1,02,6]undeka-2(6),3-dien-11-il]etanona;
 1-[1-(6-hlorpiridin-3-ilmetil)-3-*m*-tolil-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(4-metoksipiridin-2-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(4-hlorpiridin-3-ilmetil)-3-*m*-tolil-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(3-metoksipiridin-2-ilmetil)-3-(3-trifluormetilfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(3-hlorfenil)-1-(3-metilpiridin-2-ilmetil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-[1-(4-fluorfenil)etil]-3-(6-trifluormetilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(6-metilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;
 1-[3-(6-brompiridin-2-il)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;

1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-metilpiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;

1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(6-metoksipiridin-2-il)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;

1-[3-(6-hlor-5-metoksipiridin-2-il)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(3-metiloksetān-3-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-izobutiril-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-ciklopropānkarbonil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-(2-*terc*-butoksiacetil)-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(3-metānsulfoniilbenzoil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

[1-benzil-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]-(4-fluorfenil)metanona;

[1-benzil-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]-(4-metoksifenil)metanona;

[1-benzil-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]fenilmetanona;

3-[5-ciklobutānkarbonil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[5-ciklopentānkarbonil-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(4-metānsulfoniilbenzoil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(tetrahidropirān-4-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(tetrahidrofurān-3-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(2-metoksiacetil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(2,2-dimetilpropionil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-propionil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-((S)-2-hidroksipropionil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

1-[1-benzil-3-(4-fluorfenil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]-2-feniletanona;

3-[5-butiril-1-(2,4-difluorbenzil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(piridin-2-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

savienojuma ar trifluoretiķskābi;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(3-fluorpiridin-4-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(3-metil-3H-imidazol-4-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-[1-(2,4-difluorbenzil)-5-(1-metil-1H-pirazol-3-karbonil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridin-3-il]benzonitrila;

3-(3-cianofenil)-1-(2,4-difluorbenzil)-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-karbonskābes etilestera;

1-[1-(2,4-difluorbenzil)-3-(4-fluorfenil)-6-metil-1,4,6,7-tetrahidropirazolo[4,3-c]piridin-5-il]etanona;

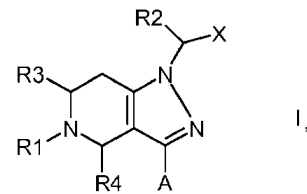
3-(4-fluorfenil)-1-((R)-1-(4-fluorfenil)etil)-5-metānsulfoniil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridīna;

3-(4-fluorfenil)-1-((S)-1-(4-fluorfenil)etil)-5-metānsulfoniil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo[4,3-c]piridīna;

to stereoizomērām formām un/vai to farmaceutiski pieņemamiem sāļiem.

16. Medikaments, kas satur savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai un/vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

17. Savienojums ar formulu (I) vai savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, un/vai to farmaceutiski pieņemami sāļi izmantošanai TASK-1 kanāla mediētu slimību ārstēšanā vai novēršanā:



kur:

A ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, kur alkidaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

X ir (C₆-C₁₀)arilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms,

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CN grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-C(O)- un (C₁-C₆)alkil-SO₂-,

kur alkidaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R1 ir R5-C(=O)- vai (C₁-C₆)alkil-SO₂-;

R2 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa;

R3 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

R4 ir H atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa;

vai R3 un R4 kopā veido (C₂-C₃)alkilēngrupas tiltni;

R5 ir (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, (C₁-C₆)alkil-O-, (C₁-C₆)alkil-S-, (C₁-C₆)alkil-O-(C₁-C₆)alkilgrupa, HO-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkil(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₆-C₁₀)arilgrupa, (C₆-C₁₀)aril(C₁-C₆)alkilgrupa, R7R6N-, heteroarilgrupa, heteroaril(C₁-C₆)alkilgrupa, alifātisks heterocikls,

kur alifātiskais heterocikls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no morfolinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolidinilgrupas un 4- līdz 7-locekļu alifātiskiem heterocikliem, kas satur skābekļa atomu, un kur alifātiskais heterocikls neobligāti var būt aizvietots ar 1 līdz 3 aizvietotājumiem, kas ir izvēlēti no F atoma, OH grupas, (C₁-C₆)alkil-O- un (C₁-C₆)alkilgrupas, un

kur heteroarilatlūkumi ir 5- vai 6-locekļu gredzena sistēmas, kas satur no 1 līdz 3 heteroatomiem, kas ir izvēlēti no grupas: N, O un S atoms, un

kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 3 atlikumiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no F, Cl, Br atoma, CF₃ grupas, (C₁-C₆)alkilgrupas, (C₁-C₆)alkil-O-, CN grupas, (C₁-C₂)alkil-SO₂-, un kur alkidaļu viens vai vairāki ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

R6 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa, kur viens alkilgrupas ūdeņraža atoms var būt aizstāts ar OH grupu vai (C₁-C₆)alkil-O-atlikumu, un kur viens vai vairāki alkilgrupas ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu;

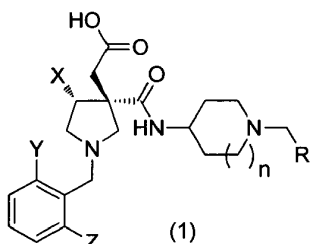
R7 ir H atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, kur viens vai vairāki alkilgrupas ūdeņraža atomi var būt aizstāti ar fluora atomu.

18. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, medikaments saskaņā ar 16. pretenziju vai savienojums saskaņā ar 17. pretenziju izmantošanai aritmiju, it īpaši priekškambara tahiaritmiju, priekškambaru fibrilācijas un priekškambaru mirgošanas, ārstēšanā vai novēršanā.

19. Savienojums ar formulu (I) un/vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, medikaments saskaņā ar 16. pretenziju vai savienojums saskaņā ar 17. pretenziju izmantošanai ar miegu saistītu elpošanas traucējumu, centrālas un obstruktīvas miega apnojas sindroma, augšējo elpceļu paaugstinātas rezistences sindroma, Čeina-Stoksa sindroma, krākšanas, traucētas elpošanas centra darbības, zīdaiņu pēkšņās nāves sindroma, pēcoperācijas hipoksijas un apnojas, elpošanas traucējumu, kas saistīti ar elpošanas muskuļiem, elpošanas traucējumu pēc atradināšanas no ilgstošas plaušu mākslīgās ventilācijas, elpošanas traucējumu, kas

rodas adaptācijas laikā augstu kalnos, akūtu elpošanas traucējumu, hronisku plaušu traucējumu ar hipoksiju un hiperkapniju, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS) un ar aptaukošanos saistīta hipoventilācijas sindroma ārstēšanā un novēršanā; vai izmantošanai par elpošanas stimulēšanas līdzekli respiratoras depresijas ārstēšanai vai novēršanai, kas ir asociēta ar anestēziju vai sedatīvām procedūrām nelielu operāciju laikā vai diagnostiskos nolūkos; vai izmantošanai par elpošanas stimulēšanas līdzekli respiratoras depresijas ārstēšanai vai novēršanai, kas ir izraisīta ar opioīdiem hronisku sāpju ārstēšanas laikā, it īpaši vēža vai paliatīvās aprūpes, vai sedatīvo procedūru gadījumā, un/vai atradināšanai no ilgstošas plaušu mākslīgās ventilācijas; vai izmantošana multiplās sklerozes un centrālās nervu sistēmas iekaisīgu vai deģeneratīvu traucējumu ārstēšanā vai novēršanā.

- (51) **C07D 207/16**^(2006.01) (11) **2757103**
C07D 401/12^(2006.01)
A61K 31/454^(2006.01)
A61P 1/00^(2006.01)
A61P 1/04^(2006.01)
A61P 43/00^(2006.01)
- (21) 12831085.1 (22) 11.09.2012
(43) 23.07.2014
(45) 06.01.2016
(31) 2011199482 (32) 13.09.2011 (33) JP
(86) PCT/JP2012/073171 11.09.2012
(87) WO2013/039057 21.03.2013
(73) Eisai R&D Management Co., Ltd., 6-10, Koishikawa 4-chome, Bunkyo-ku, Tokyo 112-8088, JP
(72) YOSHIDA Ichiro, JP
OKABE Tadashi, JP
MATSUMOTO Yasunobu, JP
WATANABE Nobuhisa, JP
OHASHI Yoshiaki, JP
ONIZAWA Yuji, JP
HARADA Hitoshi, JP
(74) HOFFMANN EITLE, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
(54) **PIROLIDIN-3-IL-ETIĶSKĀBES ATVASINĀJUMS
PYRROLIDINE-3-YLACETIC ACID DERIVATIVE**
(57) 1. Savienojums, kas attēlots ar formulu (1):



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, turklāt R apzīmē C₁₋₆alkilgrupu, kas ir neaizvietota vai satur no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no halogēna atomiem, C₃₋₈cikloalkilgrupu, kas ir neaizvietota vai satur no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no halogēna atomiem, vai C₃₋₈cikloalkenilgrupu, kas ir neaizvietota vai satur no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no halogēna atomiem; X apzīmē C₁₋₆alkilgrupu; Y un Z ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra un katrs apzīmē halogēna atomu vai C₁₋₆alkilgrupu, kas ir neaizvietota vai satur no 1 līdz 3 aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no halogēna atomiem; n apzīmē 0 vai 1.

2. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt R ir fluorbutilgrupa, pentilgrupa, cikloheksilgrupa, difluorcikloheksilgrupa, ciklopentenilgrupa vai cikloheksenilgrupa.

3. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt X ir metilgrupa.

4. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt Y ir hlora atoms.

5. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt Z ir hlora atoms, metilgrupa, difluormetilgrupa vai trifluormetilgrupa.

6. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt n ir 1.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- 2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(trifluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(2-fluorpentil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2,6-dihlorfenil)metil]-3-[[1-(4,4-difluorcikloheksil)metil]piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(trifluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-metilfenil)metil]-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes,
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(trifluormetil)fenil]metil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-metilfenil)metil]-3-[[1-(ciklopent-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(difluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(difluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(ciklopent-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(difluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(ciklopent-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes un
2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(difluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(cikloheksilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābes;
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

8. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai terapijā.

9. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai iekaisīgas zarnu trakta slimības ārstēšanā.

10. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt iekaisīgā zarnu trakta slimība ir čūlainais kolīts vai Krona slimība.

11. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai par fraktalkīna-CX3CR1 ceļa inhibitoru.

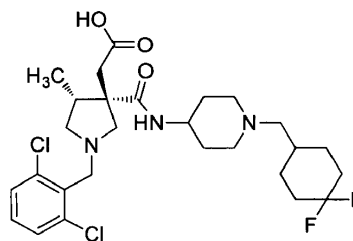
12. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai par fraktalkīna inhibitoru.

13. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai par CX3CR1 inhibitoru.

14. Medikaments, kas satur savienojumu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai.

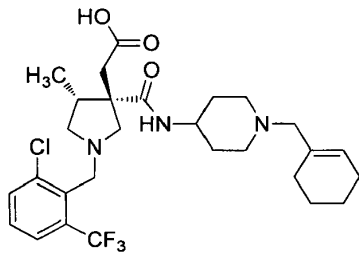
15. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ir ievadīta jebkura no grupām: (1) proteīna marķēšanas grupa, (2) sašķelams linkeris, (3) fluorescencētās *in situ* hibridizācijas (FISH) marķēšanas grupa, (4) detektējams marķieris un (5) grupa, kas ir saistīta ar cietās fāzes nesēju, izmantošana par ķīmisku zondi marķētu proteīnu identificēšanai.

16. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3S,4R)-1-[(2,6-dihlorfenil)metil]-3-[[1-(4,4-difluorcikloheksil)metil]piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



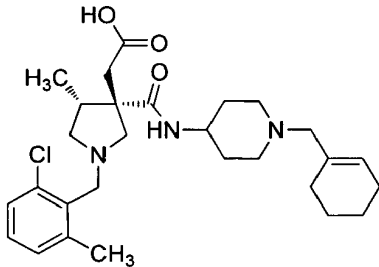
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

17. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3S,4R)-1-[(2-hlor-6-(trifluormetil)fenil]metil]-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



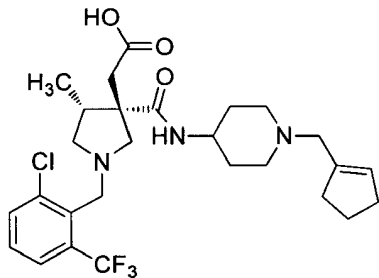
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

18. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3*S*,4*R*)-1-[(2-hlor-6-metilfenil)metil]-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



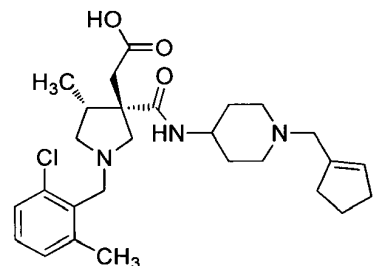
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

19. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3*S*,4*R*)-1-[(2-hlor-6-(trifluorometil)fenil)metil]-3-[[1-(ciklopent-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



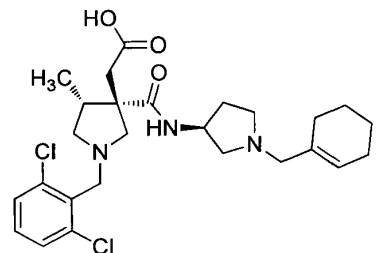
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls

20. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3*S*,4*R*)-1-[(2-hlor-6-metilfenil)metil]-3-[[1-(ciklopent-1-en-1-ilmetil)piperidin-4-il]karbamoil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



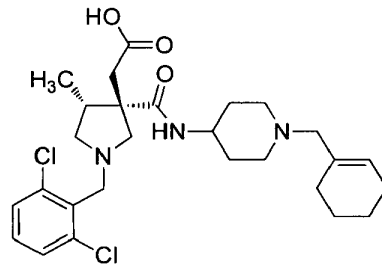
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

21. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3*S*,4*R*)-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)pirolidin-3-il]karbamoil]-1-[(2,6-dihlorfenil)metil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

22. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 2-[(3*S*,4*R*)-3-[[1-(cikloheks-1-en-1-ilmetil)pirolidin-4-il]karbamoil]-1-[(2,6-dihlorfenil)metil]-4-metilpirolidin-3-il]etiķskābe:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

- (51) **C08G 8/24**^(2006.01) (11) **2758457**
C08H 7/00^(2011.01)
C08G 8/20^(2006.01)
C09J 161/12^(2006.01)
C09J 197/00^(2006.01)
C08L 97/00^(2006.01)
C08L 97/02^(2006.01)
- (21) 13718606.0 (22) 28.03.2013
(43) 30.07.2014
(45) 09.03.2016
(31) 20125358 (32) 29.03.2012 (33) FI
(86) PCT/FI2013/050353 28.03.2013
(87) WO2013/144454 03.10.2013
(73) UPM-Kymmene Corporation, Alvar Aallon katu 1, 00100 Helsinki, FI
(72) PIETARINEN, Suvi, FI
RINGENA, Okko, DE
ESKELINEN, Kati, FI
VALKONEN, Sanna, FI
(74) Papula Oy, P.O. Box 981, 00101 Helsinki, FI
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
(54) **LIGNĪNA REAĢĒTSPĒJAS PAAUGSTINĀŠANAS PAŅĒMIENS**
A METHOD FOR INCREASING THE REACTIVITY OF LIGNIN

(57) 1. Lignīna reaģētspējas paaugstināšanas paņēmiens, kas raksturīgs ar to, ka tas satur šādus soļus:

- a) ūdeni saturošas dispersijas, kura satur sārmu un lignīnu, pie kam sārms satur sārmu metāla hidroksīdu, iegūšanu, karsējot 30 līdz 70 °C temperatūrā;
 - b) solī a) iegūtās dispersijas karsēšanu 50 līdz 95 °C temperatūrā, lai iegūtu alkilētu lignīnu.
2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka sārna koncentrācija ir 5 līdz 50 masas % no solī a) iegūtās dispersijas kopējās masas.
 3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka solī a) temperatūra ir 50 līdz 65 °C.
 4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka solī b) temperatūra ir 60 līdz 75 °C.
 5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas pirms soļa a) satur soli i), kurā lignīns reaģē ar savienojumu, kas izvēlēts no fenolu grupas.
 6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas pēc soļa b) satur soli ii), kurā pie solī b) iegūtās dispersijas tiek pievienots aldehīds, aldehīda atvasinājums vai to kombinācija.
 7. Lignīns, kas iegūts ar paņēmienu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai.
 8. Saistvielas kompozīcijas iegūšanas paņēmiens, kas raksturīgs ar to, ka tas satur šādu soli:
 - (iii) ūdeni saturošas kompozīcijas, kura satur reaģentu komponentus, tai skaitā lignīnu, kas iegūts ar paņēmienu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, polimerizēties spējīgu vielu un sašūšanas aģentu, karsēšanu katalizatora klātbūtnē 60 līdz 95 °C

temperatūrā reaģentu komponentu polimerizēšanai, līdz tiek iegūta saistvielas kompozīcija ar iepriekš noteiktu viskozitātes vērtību.

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka solis (iii) satur kompozīcijas karsēšanu 65 līdz 90 °C temperatūrā.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka sašūšanas aģents ir aldehīds.

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka polimerizēties spējīgā viela ir izvēlēta no rindas, kura ietver fenolu, krezolu, rezorcinolu un to kombinācijas.

12. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka katalizators ir izvēlēts no rindas, kura ietver nātrija hidroksīdu, kālija hidroksīdu un jebkuru to maisījumu.

13. Saistvielas kompozīcija, kas iegūta ar paņēmienu saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 12. pretenzijai.

14. Adhezīva kompozīcija, kas ietver saistvielas kompozīciju saskaņā ar 13. pretenziju.

15. Saistvielas kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju izmantošana impregnēšanas tehnoloģijās, par pārklājumu plastmasas izstrādājumu pastiprināšanai, zem spiediena lietu izstrādājumu, laminātu vai laku ražošanai, vai koka izstrādājumu līmēšanai.

16. Adhezīvas kompozīcijas saskaņā ar 14. pretenziju izmantošana koka izstrādājumu līmēšanai.

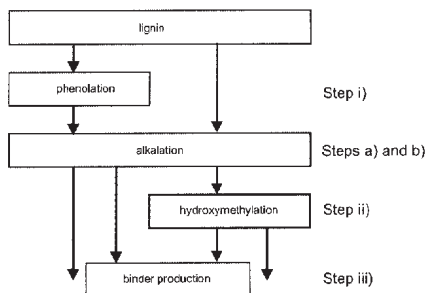
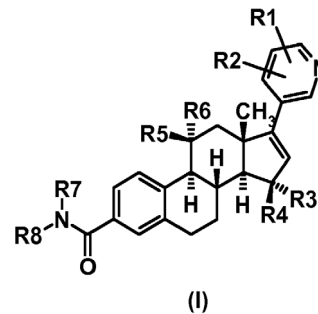


Fig. 1

- (51) **C07J 43/00**^(2006.01) (11) **2760878**
A61K 31/58^(2006.01)
A61P 5/24^(2006.01)
- (21) 12766636.0 (22) 24.09.2012
(43) 06.08.2014
(45) 28.10.2015
(31) 102011083725 (32) 29.09.2011 (33) DE
(86) PCT/EP2012/068803 24.09.2012
(87) WO2013/045407 04.04.2013
(73) Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, DE
Bayer Pharma Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, DE
- (72) BOTHE, Ulrich, DE
BARAK, Naomi, DE
BUSEMANN, Matthias, DE
FISCHER, Oliver Martin, DE
ROTGGERI, Andrea, DE
GASHAW, Isabella, US
HARTUNG, Ingo, DE
MARQUARDT, Tobias, DE
- (74) BIP Patents, c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Straße 10, 40789 Monheim am Rhein, DE
Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **ESTRA-1,3,5(10),16-TETRAĒN-3-KARBOKSAMĪDA ATVASINĀJUMI, TO IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS, TOS SATUROŠI FARMACEITISKIE PREPARĀTI, KĀ ARĪ TO IZMANTOŠANA MEDIKAMENTU IEGŪŠANAI**
ESTRA-1,3,5(10),16-TETRAĒNE-3-CARBOXAMIDE DERIVATIVES, PROCESS FOR PREPARATION THEREOF, PHARMACEUTICAL PREPARATIONS COMPRISING THEM, AND USE THEREOF FOR PRODUCTION OF MEDICAMENTS

(57) 1. Savienojumi ar formulu (I):



kurā:

R1 un R2 neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, hlora atomu, nitrilgrupu, trifluometilgrupu, pentafluoretilgrupu, metoksigrupu, etoksigrupu, trifluorometoksigrupu, -OCH₂CF₃, CH₃SO₂-, CH₃CH₂SO₂-, -(C=O)CH₃, karboksilgrupu, C₁₋₄alkilgrupu, hidroksilgrupu, -CH₂OH, -C(CH₃)₂OH, -CONH₂, -(C=O)NH-alkilgrupu, -(C=O)N(CH₃)₂, -SO₂NH₂, -SO₂NH(CH₃), -SO₂N(CH₃)₂ vai C-H grupas aizstāšanu piridīngredzenā ar slāpekļa atomu; un

R3 un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai R3 apzīmē hidroksilgrupu, fluora atomu, metoksigrupu vai etoksigrupu un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai R3 apzīmē ūdeņraža atomu un R4 apzīmē hidroksilgrupu, fluora atomu, metoksigrupu vai etoksigrupu; un

R5 un R6 apzīmē ūdeņraža atomu; vai R5 apzīmē fluora atomu, hidroksilgrupu, metoksigrupu vai etoksigrupu un R6 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R5 apzīmē ūdeņraža atomu un R6 apzīmē fluora atomu; un

R7 apzīmē ūdeņraža atomu, C₁₋₄alkilgrupu, C₃₋₆cikloalkilgrupu, ciklopropilmetilgrupu, trifluometilgrupu vai 2,2,2-trifluoretilgrupu; un

R8 apzīmē -CR^aR^b-COOH, kur:

R^a un R^b neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu, etilgrupu; vai

R^a un R^b kopā apzīmē -(CH₂)_n-, kur n ir 2, 3, 4 vai 5, kur līdz 4 ūdeņraža atomiem CH₂ grupās var būt aizvietoti ar fluora atomiem; vai

R^a un R^b kopā apzīmē -CH₂-O-CH₂-, -CH₂-NH-CH₂-, -CH₂-N(CH₃)-CH₂-, -CH₂CH₂-O-CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-NH-CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-N(CH₃)-CH₂CH₂-; vai

R^a apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu vai etilgrupu un R^b kopā ar R7 apzīmē -(CH₂)_n-, kur n ir 1, 2, 3, 4, kur līdz 4 ūdeņraža atomiem CH₂ grupās var būt aizvietoti ar fluora atomiem; vai

R^a kopā ar R7 apzīmē -CH₂-O-CH₂CH₂-, -CH₂-N(CH₃)-CH₂CH₂- un R^b apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu vai etilgrupu, vai -CR^cR^d-CR^eR^f-COOH, kur:

R^c, R^d, R^e, R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c, R^d neatkarīgi viens no otra apzīmē metilgrupu, etilgrupu vai kopā apzīmē -(CH₂)_n-, kur n ir 2, 3, 4, 5, vai -CH₂CH₂-O-CH₂CH₂-, un R^e, R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c, R^d apzīmē ūdeņraža atomu un R^e, R^f neatkarīgi viens no otra apzīmē metilgrupu, etilgrupu vai kopā apzīmē -(CH₂)_n-, kur n ir 2, 3, 4, 5, -CH₂CH₂-O-CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-NH-CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-N(CH₃)-CH₂CH₂- vai -CH₂-O-CH₂-; vai

R^c apzīmē metilgrupu, etilgrupu, trifluometilgrupu un R^d, R^e un R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c, R^d un R^f apzīmē ūdeņraža atomu un R^e apzīmē metilgrupu, etilgrupu, trifluorometilgrupu, hidroksilgrupu vai metoksigrupu; vai

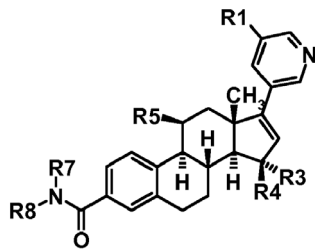
R^c un R^e kopā apzīmē -(CH₂)_n-, kur n ir 1, 2, 3 vai 4, un R^d un R^f apzīmē ūdeņraža atomu vai -CH₂-CH₂-CHR^g-COOH, kur:

R^g apzīmē ūdeņraža atomu; vai

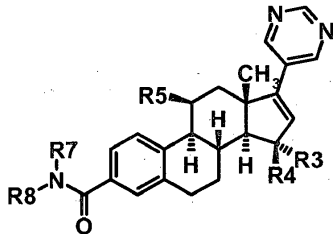
R^g un R7 kopā apzīmē -CH₂- vai -CH₂CH₂-;

un to sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

2. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (II) un ar formulu (III):



(II)



(III)

kurās:

R1 apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, hlora atomu, nitrilgrupu, metoksigrupu, etoksigrupu, trifluormetoksigrupu, metilgrupu, etilgrupu, trifluormetilgrupu, $-(C=O)CH_3$; un

R3 un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R3 apzīmē hidroksilgrupu un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R3 apzīmē ūdeņraža atomu un R4 apzīmē hidroksilgrupu; un

R5 apzīmē ūdeņraža atomu vai fluora atomu; un

R7 apzīmē ūdeņraža atomu vai C_{1-4} alkilgrupu; un

R8 apzīmē $-CR^aR^b-COOH$, kur:

R^a un R^b neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu vai etilgrupu; vai

R^a un R^b kopā apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 2, 3, 4 vai 5; vai

R^a apzīmē ūdeņraža atomu un R^b kopā ar R7 apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 3 vai 4, vai $-CR^cR^d-CR^eR^f-COOH$, kur:

R^c, R^d, R^e, R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c, R^d apzīmē ūdeņraža atomu un R^e, R^f neatkarīgi viens no otra apzīmē metilgrupu, etilgrupu vai kopā apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 2, 3, 4, 5, vai $-CH_2CH_2-O-CH_2CH_2-$; vai

R^c apzīmē metilgrupu vai etilgrupu un R^d, R^e un R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c un R^e kopā apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 1, 2, 3 vai 4, un R^d un R^f apzīmē ūdeņraža atomu vai $-CH_2-CH_2-CHR^g-COOH$, kur:

R^g apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^g un R7 kopā apzīmē $-CH_2CH_2-$;

un to sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

3. Savienojumi saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju ar formulu (II) un ar formulu (III), kurās:

R1 apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, hlora atomu, nitrilgrupu, metoksigrupu, trifluormetilgrupu; un

R3 un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R3 apzīmē hidroksilgrupu un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R3 apzīmē ūdeņraža atomu un R4 apzīmē hidroksilgrupu; un

R5 apzīmē ūdeņraža atomu vai fluora atomu; un

R7 apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu vai etilgrupu; un

R8 apzīmē $-CR^aR^b-COOH$, kur:

R^a un R^b neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu vai etilgrupu; vai

R^a apzīmē ūdeņraža atomu un R^b kopā ar R7 apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 3 vai 4, vai $-CR^cR^d-CR^eR^f-COOH$, kur:

R^c, R^d, R^e, R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c, R^d apzīmē ūdeņraža atomu un R^e, R^f neatkarīgi viens no otra apzīmē metilgrupu vai etilgrupu vai kopā apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 2, 4, 5, vai $-CH_2CH_2-O-CH_2CH_2-$; vai

R^c apzīmē metilgrupu un R^d, R^e un R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c un R^e kopā apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 3 vai 4, un R^d un R^f apzīmē ūdeņraža atomu vai $-CH_2-CH_2-CHR^g-COOH$, kur:

R^g apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^g un R7 kopā apzīmē $-CH_2CH_2-$;

un to sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

4. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai ar formulu (II) un ar formulu (III), kurās:

R1 apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, metoksigrupu, trifluormetilgrupu; un

R3 un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R3 apzīmē hidroksilgrupu un R4 apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R3 apzīmē ūdeņraža atomu un R4 apzīmē hidroksilgrupu; un

R5 apzīmē ūdeņraža atomu vai fluora atomu; un

R7 apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu; un

R8 apzīmē $-CR^aR^b-COOH$, kur:

R^a un R^b neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu; vai

R^a apzīmē ūdeņraža atomu un R^b kopā ar R7 apzīmē $-(CH_2)_3-$ vai $-CR^cR^d-CR^eR^f-COOH$, kur:

R^c, R^d, R^e, R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c un R^d apzīmē ūdeņraža atomu un R^e un R^f apzīmē metilgrupu vai kopā apzīmē $-(CH_2)_n-$, kur n ir 2 vai 4, vai $-CH_2CH_2-O-CH_2CH_2-$; vai

R^c apzīmē metilgrupu un R^d, R^e un R^f apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^c un R^e kopā apzīmē $-(CH_2)_3-$ un R^d un R^f apzīmē ūdeņraža atomu vai $-CH_2-CH_2-CHR^g-COOH$, kur:

R^g apzīmē ūdeņraža atomu; vai

R^g un R7 apzīmē $-CH_2CH_2-$;

un to sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

5. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai ar nosaukumiem:

4-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]metil]-3,4,5,6-tetrahydro-2H-pirān-4-karbonskābe;

N-[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-N-metil-β-alanīns;

1-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]metil]ciklopropān-1-karbonskābe;

1-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]metil]ciklopentān-1-karbonskābe;

3-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]-2,2-dimetilpropānskābe;

1-[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]piperidīn-4-karbonskābe;

N-[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-2-metilalanīns;

4-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]butānskābe;

N-[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-β-alanīns;

N-[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]glicīns;

(1R*,2S*)-2-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]ciklopentān-1-karbonskābe;

(S)-3-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]butānskābe;

(R)-3-[[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]butānskābe;

3-[[[17-(5-metoksipiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]-2,2-dimetilpropānskābe;

N-[[17-(5-metoksipiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-β-alanīns;

N-[[17-(5-metoksipiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-N-metil-β-alanīns;

N-[[17-(pirimidin-5-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-β-alanīns;

4-[[[17-(pirimidin-5-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]butānskābe;

N-metil-N-[[17-(pirimidin-5-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-β-alanīns;

2,2-dimetil-3-[[[17-(pirimidin-5-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]amino]propānskābe;

N-[[17-[5-(trifluormetil)piridin-3-il]estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-β-alanīns;

N-metil-N-[[17-[5-(trifluormetil)piridin-3-il]estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-β-alanīns;

N-[[17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il]karbonil]-L-prolīns;

N-{{17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil]-D-prolīns;

4-{{11β-fluor-17-(5-fluorpiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil}amino)butānskābe;

N-{{17-(5-fluorpiridin-3-il)-15α-hidroksiestra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil]-N-metil-β-alanīns;

N-{{17-(5-fluorpiridin-3-il)-15β-hidroksiestra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil]-N-metil-β-alanīns;

N-metil-N-{{17-(6-metilpiridazin-4-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil]-β-alanīns;

N-metil-N-{{17-(3-piridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil]-β-alanīns;

4-{{17-(5-metoksipiridin-3-il)estra-1,3,5(10),16-tetraen-3-il}karbonil}amino)butānskābe;

un to sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

6. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai slimību ārstēšanai un/vai profilaksei.

7. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai slimību ārstēšanai un/vai profilaksei.

8. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai endometriozes, dzemdes leiomiomu, traucējumu, kas saistīti ar dzemdes asiņošanu, dismenorejas, prostatas karcinomas, prostatas hiperplāzijas, pūtīšu, seborejas, matu izkrišanas, priekšlaicīga seksuālā brieduma, policistiskā olnīcu sindroma, krūts vēža, plaušu vēža, endometrija karcinomas, nieru šūnu karcinomas, urīnpūšļa karcinomas, ne-Hodžkina limfomas, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), aptaukošanās vai ar iekaisumu saistītu sāpju ārstēšanai un/vai profilaksei.

9. Medikaments, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai kombinācijā ar vienu vai vairākiem papildu aktīvajiem savienojumiem, it īpaši ar selektīviem estrogēna receptoru modulatoriem (SERMs), estrogēna receptoru (ER) antagonistiem, aromatāzes inhibitoriem, 17β HSD1 inhibitoriem, steroīdu sulfatāzes (STS) inhibitoriem, GnRH agonistiem un antagonistiem, kisspeptīna receptoru (KISSR) antagonistiem, selektīviem androgēna receptoru modulatoriem (SARMs), androgēniem, 5α-reduktāzes inhibitoriem, selektīviem progesterona receptoru modulatoriem (SPRMs), gestagēniem, antigestagēniem, perorālajiem kontracepcijas līdzekļiem, mitogēn-aktivētā proteīna (MAP) kināžu inhibitoriem, ka arī MAP kināžu kināžu (Mek3/6, Mek1/2, Erk1/2) inhibitoriem, proteīna kināžu B (PKBα/β/γ; Akt1/2/3) inhibitoriem, fosfoinozīdā-3 kināžu (PI3K) inhibītoriem, ciklīna atkarīgas kināzes (CDK1/2) inhibitoriem, hipoksijas inducētā signālu ceļa inhibitoriem (HIF1alfa inhibitoriem, prolilhidroksilāžu aktivatoriem), histonu deacetilāzes (HDAC) inhibitoriem, prostaglandīna F receptoru (FP) (PTGFR) antagonistiem un nesteroidiem pretiekaisuma līdzekļiem (NSAIDs).

2. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur taukainu aknu slimības ir izvēlētas nealkoholiskās taukaino aknu slimības un nealkoholiskā steatohepatīta.

3. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur 15-HEPE satur (C₁-C₅)alkilesteri.

4. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā 15-HEPE ir farmaceitiskas kompozīcijas formā.

5. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kur farmaceitiskā kompozīcija papildus ietver farmaceitiski pieņemamu pildvielu.

6. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur farmaceitiskā kompozīcija ir iekšīgi lietojama farmaceitiska kompozīcija.

7. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā 15-HEPE ir līdz 90 masas % no visām taukskābēm.

8. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā nav būtiska daudzuma jebkuru citu omega-3 taukskābju.

9. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā nav nevienas citas omega-3 taukskābes.

10. 15-HEPE izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur 15-HEPE ir aptuveni no 50 līdz 3000 mg.

(51) **F16F 9/512**^(2006.01)

F16F 9/516^(2006.01)

F16F 9/46^(2006.01)

(11) **2764274**

(21) 12780307.0

(22) 03.10.2012

(43) 13.08.2014

(45) 25.05.2016

(31) 2007530

(32) 04.10.2011

(33) NL

(86) PCT/NL2012/050692

03.10.2012

(87) WO2013/051934

11.04.2013

(73) KONI B.V., Langeweg 1, 3261 LJ Oud-Beijerland, NL

(72) DE KOCK, Paul, NL

(74) Nederlandsch Octrooibureau, P.O. Box 29720, 2502 LS The Hague, NL

Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **AR ŠĶĪDRUMU PIEPILDĪTS NO FREKVENCES ATKARĪGS SLĀPĒTĀJS**

FLUID-FILLED, FREQUENCY-DEPENDENT DAMPER

(57) 1. Ar šķidrums piepildīts no frekvences atkarīgs slāpētājs, kas satur: cilindru (2), kas savienots ar cilindra stiprinājuma elementu (30), virzuli (3), kas savienots ar virzuļa stiprinājuma elementu (31), turklāt virzulis ir pārvietojams cilindrā, pirmo galveno kameru (27; 28), otro galveno kameru (28; 5) un regulējošo elementu (25; 34), kas ir izveidots un novietots tā, lai ļautu šķidrumam plūst un ietekmētu tā plūsmu starp pirmo un otro galveno kameru slāpētāja iekšpusē, kad cilindra stiprinājuma elements un virzuļa stiprinājuma elements virzās prom un/vai pretī viens otram, kas raksturīgs ar to, ka regulējošais elements (25; 34) ietver papildu cilindru (8) un papildu virzuli (7), ar kuru ir aprīkots papildu cilindrs (7), turklāt papildu virzulis (7) papildu cilindru (8) sadala pirmajā papildu kamerā (15), kas satur pirmo atveri (9), kura nodrošina pirmās papildu kameras šķidruma plūsmas savienojumu ar vienu no abām galvenajām kamerām – pirmo vai otro (27, 28), turklāt pirmā atvere noslēdzas ar papildu cilindra (7) pirmo daļu (10), un otro atveri (20), kas nodrošina pirmās papildu kameras šķidruma plūsmas savienojumu ar otro no galvenajām kamerām – pirmo vai otro, un otrajā papildu kamerā (16), kas ar šķidruma plūsmu ir savienota ar otro no galvenajām kamerām – pirmo vai otro, caur regulējošu kanālu (14), turklāt pirmā atvere (9) miera stāvoklī noslēdzas ar papildu virzuli, bet atveras, virzulim pārvietojoties papildu cilindrā.

2. Slāpētājs saskaņā ar 1. pretenziju, kurā papildu virzulim (7) ir pakāpienveida konfigurācija, kas ietver pirmo daļu (10) ar pirmo šķērsriezumu, kas ir piemērots atveres (9) noslēgšanai, un otro daļu (12) ar otro šķērsriezumu, kas ir piemērots papildu cilindra (8) sadalīšanai papildu kamerās – pirmajā (15) un otrajā (16), turklāt otrais šķērsriezums ir lielāks par pirmo šķērsriezumu.

(51) **A61K 31/557**^(2006.01)

A61P 1/16^(2006.01)

(11) **2762143**

(21) 13176516.6

(22) 15.07.2013

(43) 06.08.2014

(45) 02.12.2015

(31) 201301626

(32) 30.01.2013

(33) GB

(73) Dignity Sciences Limited, Trintech Building 3rd Floor, South County Business Park, Leopardstown, Dublin 18, IE

(72) ROWE, Jonathan, US

DUFFY, Kevin, IE

CLIMAX, John, IE

(74) Wakerley, Helen Rachael, Reddie & Grose LLP, 16 Theobalds Road, London WC1X 8PL, GB

Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **KOMPOZĪCIJAS, KAS SATUR 15-HEPE UN TO IZMANTOŠANAS PAŅĒMIENI**
COMPOSITIONS COMPRISING 15-HEPE AND METHODS OF USING THE SAME

(57) 1. 15-HEPE izmantošanai taukaino aknu slimības ārstēšanā, kur 15-HEPE ir tā brīvas skābes, 15-hidroksiekosa-5,8,11,13,17-pentānskābes un/vai tā farmaceitiski pieņemama estera, konjugāta vai tā sāls vai to maisījumu formā.

3. Slāpētājs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā regulējošais kanāls (14) ir izveidots papildu virzulī (7), starp pirmo (15) un otro (16) papildu kameru.

4. Slāpētājs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā regulējošais kanāls (14) ir izveidots papildu cilindra (8) sienīnā, kura norobežo otro papildu kameru (16) un ir ar šķidrums plūsmu savienota ar otro no galvenajām kamerām – pirmo vai otro.

5. Slāpētājs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ietver atsperi (17), kura ir izveidota un novietota tā, lai papildu virzuli (7) atsperes iedarbības rezultātā aizvirzītu uz pirmo atveri (9).

6. Slāpētājs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur starp otro papildu kameru (16) un otro no galvenajām kamerām – pirmo vai otro – ir ievietots papildu pretvārsts (18), kas ir izveidots un novietots tā, lai ļautu šķidrumam no otrās no galvenajām kamerām – pirmās vai otrās – piepildīt otro papildu kameru (16), it īpaši kā papildu pretvārsta (18) atvere ir izveidots regulējošais kanāls (14).

7. Slāpētājs saskaņā ar 6. pretenziju, kur papildu pretvārsts (18) atrodas starp pirmo un otro papildu kameru (15, 16) papildu virzulī (7), papildu pretvārsts (18) ir izveidots un novietots tā, lai ļautu šķidrumam no pirmās papildu kameras (15) piepildīt otro papildu kameru (16).

8. Slāpētājs saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, kur papildu pretvārsts (18) ir izveidots papildu cilindra (8) sienīnā, kura norobežo otro papildu kameru (16) un ir ar šķidrums plūsmu savienota ar otro no galvenajām kamerām – pirmo vai otro.

9. Slāpētājs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur regulējošais elements (25) ir uzstādīts uz virzuļa (3), kas cilindra sadala cilindra pirmajā kamerā (27) kā pirmajā galvenajā kamerā un cilindra otrajā kamerā (28) kā otrajā galvenajā kamerā, turklāt cilindra pirmā kamera atrodas pie virzuļa virzuļa stiprinājuma daļas pusē, bet cilindra otrā kamera ir izveidota pie virzuļa cilindra stiprinājuma daļas pusē.

10. Slāpētājs saskaņā ar 9. pretenziju, kurā ir izveidots virzuļa kanāls (33), kura viens gals ir savienots ar cilindra pirmo kameru, bet otrs gals ir savienots ar pirmās papildu kameras (15) atveri (9) tā, lai nodrošinātu pirmās papildu kameras šķidrums plūsmas savienojumu ar cilindra pirmo kameru, it īpaši, ar virzuļa stieni (24), kas ir novietots starp virzuli (3) un virzuļa stiprinājuma elementu (31), turklāt virzuļa stienī ir izveidots virzuļa kanāls.

11. Slāpētājs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur virzulis (3) cilindra sadala cilindra pirmajā kamerā (27) un cilindra otrajā kamerā (28), bet slāpētājs ietver papildu kameru (5), turklāt regulējošais elements ir novietots starp cilindra pirmo (27) vai otro (28) kameru un papildu kameru (5) kā otro galveno kameru.

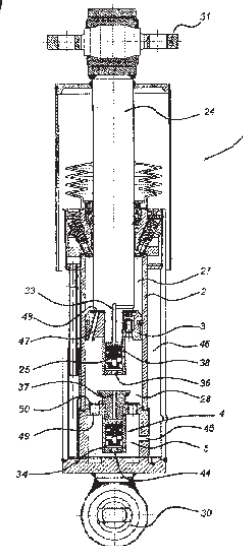
12. Slāpētājs saskaņā ar 11. pretenziju, kur cilindra pirmā kamera (27) atrodas pie virzuļa (3) virzuļa stiprinājuma daļas pusē, bet cilindra otrā kamera (28) atrodas pie virzuļa (3) cilindra stiprinājuma daļas pusē, regulējošais elements (34) ir novietots starp cilindra otro kameru (28) un papildu kameru (5) kā cilindra (2) apakšējais vārsts, it īpaši kā regulējošā elementa (34) pirmās papildu kameras (15) pirmā atvere (9), kas ir savienota ar cilindra otro kameru (28).

13. Vilciens (100), kas ietver slāpētāju (1) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām.

14. Vilciens saskaņā ar 13. pretenziju, kas ietver divus savstarpēji savienotus vagonus (120), kur starp vagoniem ir novietots slāpētājs (1).

15. Vilciens saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, kas ietver kustīgu šasiju (110), kura balsta viesmaz vienu augšējo rāmi (120), kur starp kustīgo šasiju un augšējo rāmi ir novietots slāpētājs (1).

Fig 1



- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) A01K 11/00 (2006.01) | (11) 2770819 | |
| (21) 12775042.0 | (22) 23.10.2012 | |
| (43) 03.09.2014 | | |
| (45) 06.01.2016 | | |
| (31) 2007671 | (32) 28.10.2011 | (33) NL |
| (86) PCT/EP2012/070989 | 23.10.2012 | |
| (87) WO2013/060690 | 02.05.2013 | |
| (73) Nehls, Reinhard, Siedlerstrasse 5, 46399 Bocholt, DE | | |
| (72) NEHLS, Reinhard, DE | | |
| (74) EP&C, P.O. Box 3241, 2280 GE Rijswijk, NL
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT,
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV | | |
- (54) **SISTĒMA BILOĢISKA OBJEKTA, KAS NAV CILVĒKS, MARKĒŠANAI UN PARAUĢA ŅĒMŠANAI NO BILOĢISKĀ OBJEKTA SYSTEM FOR MARKING A NON-HUMAN BIOLOGICAL OBJECT AND FOR TAKING A SAMPLE OF THE BIOLOGICAL OBJECT**

(57) 1. Sistēma bioloģiska objekta, kas nav cilvēks, marķēšanai un parauga iegūšanai no bioloģiskā objekta, kas ir īpaši ir dzīvnieks, turklāt sistēma satur:

- pirmo birkas daļu (1),
- otro birkas daļu (2),
- tapiņu (3) ar pirmo galu un otro galu, pie kam tapiņa ar savu pirmo galu ir savienota ar pirmo birkas daļu, un tapiņa savā otrajā galā ir aprīkota ar galviņu (4),
- parauga noņemšanas aizturi (20), kurš, kamēr birkas daļas tiek piestiprinātas pie bioloģiskā objekta un no tā tiek noņemts paraugs, atrodas uz tapiņas (3) galviņas (4), turklāt: aizturs priekšpusē ir gredzenveidīgs griezējs (21), vēlams apaļš ar, vēlams, no metāla izgatavots griešanas gredzenu; griezējs ierobežo priekšpusē vaļēju parauga uzņemšanas iedobumu (22); otrajā birkas daļā ir ierīkots kanāls (5) aizslēgam un tapiņas galviņai (4),
- parauga konteineru (10) ar ievadīšanas atveri (11), lai ievadītu parauga konteinerā aizslēgu un objekta paraugu, kas nogriezts ar griezēju, turklāt parauga konteiners (10) ir piestiprināts pie otrās birkas daļas (2) ar atbrīvojama savienojuma palīdzību tādā veidā, ka parauga konteinerā ievadīšanas atvere (11) un otrās birkas daļas kanāls (5) ir uz vienas līnijas;

turklāt: sistēma, to lietojot, ļauj tapiņu izspiest cauri bioloģiskā objekta daļai, it īpaši cauri dzīvnieka ausij, tādējādi no objekta ar griezēju nogriežot paraugu (8); minētais paraugs vismaz daļēji tiek uzņemts parauga uzņemšanas iedobumā (22), un aizslēgs un galviņa iziet cauri otrās birkas daļas (2) kanālam (5), kā rezultātā pirmā otrā birkas daļas ar tapiņu tiek piestiprinātas viena pie otras un pie bioloģiskā objekta, aizslēgs un paraugs tiek ievadīti parauga konteinerā, un minētais aizslēgs noslēdz parauga konteinerā ievadīšanas atveri,

kas raksturīga ar to, ka otrā birkas daļa otrās birkas daļas (2) kanāla (5) rajonā ir aprīkota ar parauga fiksēšanas dzelksni (30), kurš ir vērsts projām no parauga konteinerā, turklāt: parauga fiksēšanas dzelksnis savā sākumpozīcijā tiek nostiprināts pie otrās birkas daļas (2) tā, ka tad, kad griezējs (21) tiek spiests pie vienas objekta puses, smaile ir vērsta uz aizslēga (20) parauga uzņemšanas iedobumu (22) un iekabinās no objekta noņemamā parauga pretējā pusē, tādējādi fiksējot minēto noņemamo paraugu; parauga fiksēšanas dzelksnis (30) var tikt pārvietots projām no minētās sākumpozīcijas parauga konteinerā (10) zem parauga slodzes, kad griezējs tiek spiests pret objekta pretējo pusi.

2. Sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, turklāt parauga fiksēšanas dzelksnis (30) ir nostiprināts savā sākumpozīcijā pie otrās birkas daļas ar noturoša pagaidu savienojuma (32) palīdzību tā, ka tad, kad griezējs tiek spiests pret objekta vienu pusi un paraugs spiežas pie dzelkšņa, minētais dzelksnis tiek spiests projām no savas sākumpozīcijas, lai ieslīdētu parauga konteinerā.

3. Sistēma atbilstoši 1. vai 2. pretenzijai, turklāt parauga konteineram ir vaļēja noslēgta ievadīšanas atvere un dzelksnis (30) ir izveidots kā kanāla noslēgums otrajā birkas daļā, kad dzelksnis atrodas savā sākumpozīcijā.

4. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnim ir korpuss ar pamatu (30a) un ar smaili (30b), un sākumpozīcijā, attiecībā pret minētā kanāla (5) ieejas atveri aizslēgam un galviņai, pamats (30a) ir iegremdēts kanālā (5).

5. Sistēma atbilstoši 4. pretenzijai, turklāt sākumpozīcijā dzelkšņa smaile (30b) atrodas ieejas atveres plaknē vai tuvu tai, t.i., 2 milimetrus pirms vai aiz minētās plaknes, vēlams nedaudz priekšā minētajai plaknei.

6. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnim ir pamats (30a), kas piemērots, lai slīdoši pārvietotos parauga konteinerā.

7. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnis (30) ir izveidots kā atverama kapsula, kurā ir vismaz viens noslēgts nodalījums (31), kas papildīts ar funkcionālu savienojumu, turklāt minētā kapsula ir piemērota, lai tiktu atvērta, ievadot dzelksni, paraugu un aizslēgu parauga konteinerā un tādējādi novedot minēto funkcionālo savienojumu saskarē ar paraugu (8).

8. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt sākumpozīcijā dzelksnis (30) ir nostiprināts caur vienu vai vairākiem salaužamiem tiltiņiem (33), piem., ar otrajā birkas daļā ieguldītu atturošo gredzenu (32) vai starp otro birkas daļu un parauga konteineru iespīlētu atturošo gredzenu (32), turklāt minētais viens vai vairāki salaužamie tiltiņi salūst, lai ļautu dzelksnim pārvietoties projām no tā sākumpozīcijas.

9. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt sākumpozīcijā dzelksnis (30) iespīlētā veidā tiek noturēts kanāla atverē un/vai parauga konteinerā.

10. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt sākumpozīcijā dzelksnis tiek nostiprināts ar vienu vai vairākiem deformējamiem savienošanas elementiem, piem., ar deformējamu riņķveida atloku, kas iespīlēts starp otro birkas daļu un parauga konteineru, turklāt minētais viens vai vairāki deformējamie savienošanas elementi deformējas zem slodzes, ko paraugs pieliek dzelksnim, un tādējādi atbrīvo dzelksni.

11. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnis (30) vismaz daļēji ir izgatavots no caurspīdīgas plastmasas.

12. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnim (30) ir korpuss ar pamatu un smaili, turklāt dzelkšņa efektīvais augstums virs pamata ir vismaz 3 milimetri, vēlams robežās no 4 līdz 7 milimetriem.

13. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnim (30) ir koniska daļa, kuras ārējais diametrs samazinās virzienā uz dzelkšņa smaili.

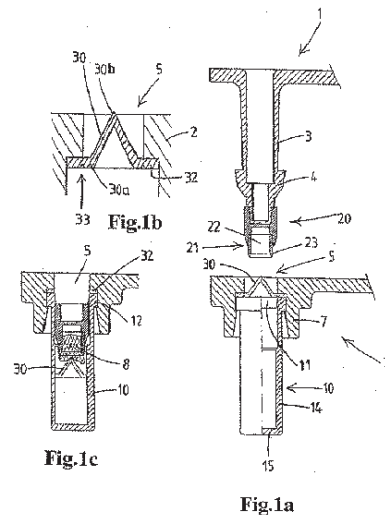
14. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnim ir pamats un parauga konteineram ir balsts minētajam pamatam, turklāt, ievadot dzelksni, paraugu un aizslēgu parauga konteinerā, dzelksni var pārvietot virzienā uz minēto balstu, lai pamats nonāktu saskarē ar minēto balstu.

15. Sistēma atbilstoši 7. un 14. pretenzijai, turklāt minētā kapsula ir izveidota tā, lai atvērtos, kad dzelksnis nonāk saskarē ar minēto balstu.

16. Sistēma atbilstoši vismaz 7. pretenzijai, turklāt minētais parauga konteinerā satur vienu vai vairākus caurduršanas elementus (16), kas ir izveidoti tā, lai caurdurtu minēto kapsulu, kad dzelksnis, paraugs un aizslēgs tiek ievadīti parauga konteinerā.

17. Sistēma atbilstoši vismaz 7. pretenzijai, turklāt: minētā kapsula ir iemontēta minētajā parauga konteinerā slīdošā veidā un ir izveidota tā, lai atvērtos uz dzelksnim pretējo pusi; starp kapsulu un parauga konteineru ir izveidota viena vai vairākas savienojošas spraugas, piem., viena vai vairākas gropes parauga konteinerā sienas daļā, tādējādi izveidojot savienojumu starp paraugu vienā dzelkšņa pusē un funkcionālo kompaundu.

18. Sistēma atbilstoši vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, turklāt dzelksnis (30) ir izveidots kā trausls komponents, kas parauga pieliktās spiedes slodzes dēļ sairst vai salūst pēc tam, kad sākotnēji minēto slodzi ir izturējis.



(51) **B01J 20/04**^(2006.01) (11) **2773453**
B01J 20/32^(2006.01)
C02F 1/28^(2006.01)
C02F 11/14^(2006.01)
C02F 1/56^(2006.01)
C02F 1/66^(2006.01)
C02F 103/28^(2006.01)

(21) 12778745.5 (22) 30.10.2012
(43) 10.09.2014
(45) 16.03.2016
(31) 11187987 (32) 04.11.2011 (33) EP
201161558146 P 10.11.2011 US
(86) PCT/EP2012/071471 30.10.2012
(87) WO2013/064492 10.05.2013
(73) Omya International AG, Baslerstrasse 42, 4665 Oftringen, CH

(72) GERARD, Daniel E., CH
HARTAN, Hans-Georg, DE
SCHOELKOPF, Joachim, CH
SKOVBY, Michael, CH
GANE, Patrick A. C., CH

(74) Boos, Melanie, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstraße 3, 80335 München, DE
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **VIRSMAPSTRĀDĀTA KALCIJA KARBONĀTA IZMANTOŠANA ŪDENS ATTĪRĪŠANAI UN DŪŅU UN NOGULŠŅU ATŪDEŅOŠANAI UN TĀS REZULTĀTĀ IEGŪTS KOMPOZĪTMATERĪĻS**
USE OF A SURFACE-TREATED CALCIUM CARBONATE IN WATER PURIFICATION AND FOR THE DEWATERING OF SLUDGES AND SEDIMENTS AND RESULTING COMPOSITE MATERIAL

(57) 1. Virsmapstrādāta kalcija karbonāta izmantošana ūdens attīrīšanai un/vai dūņu, un/vai nogulšņu atūdeņošanai, kur vismaz

1 % no pieejamās kalcija karbonāta virsmas platības ir pārklāts ar pārklājumu, kas satur vismaz vienu katjonu polimēru, kur virsmapstrādātais kalcija karbonāts satur kalcija karbonātu ar modificētu virsmu, kas ir apstrādāta ar katjonu polimēriem papildu apstrādes posmā, un kur kalcija karbonāts ar modificētu virsmu ir iegūts, dabīgam kalcija karbonātam un/vai nogulsņētam kalcija karbonātam reaģējot ar skābi un ar oglekļa dioksīdu pirms virsmapstrādātā kalcija karbonāta pagatavošanas, kur oglekļa dioksīds ir iegūts *in situ*, apstrādājot ar skābi, un/vai ir piegādāts no ārēja avota.

2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kur kalcija karbonāta daļiņas no vismaz viena virsmapstrādātā kalcija karbonāta ir ar vidējos svērto daļiņas diametru d_{50} , kura lielums ir starp 0,01 un 250 μm , labāk starp 0,06 un 225 μm , vēl labāk starp 1 un 200 μm , pat vēl labāk starp 1 un 150 μm , un vislabāk starp 1 un 100 μm , un/vai kalcija karbonāta daļiņas no vismaz viena virsmapstrādātā kalcija karbonāta ir ar īpatnējo virsmas platību no 1 līdz 250 m^2/g , vēl labāk no 2 līdz 200 m^2/g , pat vēl labāk no 30 līdz 150 m^2/g , un vislabāk no 30 līdz 100 m^2/g .

3. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. vai 2. pretenzijas, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru ar pozitīvā lādiņa blīvumu diapazonā starp 1 un 15 mEq/g , vēl labāk diapazonā starp 2,5 un 12,5 mEq/g , un vislabāk diapazonā starp 5 un 10 mEq/g , un/vai virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kurā vismaz 60 % no monomēra vienībām ir katjonu lādiņš, labāk vismaz 70 %, vēl labāk vismaz 80 %, pat vēl labāk vismaz 90 %, un vislabāk vienāds ar 100 %.

4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru ar vidējo svērto molekulu masu M_w zem 100000 g/mol , vēl labāk no 50000 līdz 75000 g/mol , pat vēl labāk no 50000 līdz 65000 g/mol , un vislabāk no 100000 līdz 300000 g/mol .

5. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kas ir homopolimērs uz monomēra vienību bāzes, kas izvēlētas no rindas, kas sastāv no dialildialkilamonija sāļiem; terciāriem un kvartarizētiem amīniem; kvartarizētiem imīniem; labāk dialildialkilamonija sāļiem.

6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kas ir kopolimērs uz monomēra vienību bāzes, kas izvēlētas no dialildialkilamonija sāļiem, un komonomēra vienību bāzes, kas izvēlētas no rindas, kas sastāv no akrilamīda; metakrilamīda; N,N-dimetilakrilamīda; akrilskābes; metakrilskābes; vinilsulfonskābes; vinilpirolidona; hidroksiletilakrilāta; stiroļa; metilmetakrilāta; vinilacetāta un to maisījumiem.

7. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur vismaz 10 % no pieejamās kalcija karbonāta virsmas platības ir pārklāti ar pārklājumu, kas satur katjonu polimēru, labāk vismaz 20 % no pieejamās virsmas platības, vēl labāk vismaz 30 %, pat vēl labāk vismaz 40 %, un vislabāk vismaz 50 % no pieejamās virsmas platības.

8. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur virsmapstrādātais kalcija karbonāts ir pulvera veidā un/vai granulu veidā, vai duļķu veidā.

9. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur virsmapstrādātais kalcija karbonāts ir izmantots kombinācijā ar vismaz vienu flokulācijas polimēru palīg līdzekli.

10. Izmantošana saskaņā ar 9. pretenziju, kur flokulācijas polimēru palīg līdzeklim vidējā svērtā molekulu masa M_w ir diapazonā no 100000 līdz 1000000 g/mol , labāk diapazonā no 300000 līdz 500000 g/mol , vēl labāk diapazonā no 300000 līdz 1000000 g/mol , un vislabāk diapazonā no 300000 līdz 800000 g/mol , un/vai flokulācijas polimēru palīg līdzeklis ir nejonu vai jonu, labāk katjonu vai anjonu polimērs, kas tiek izvēlēts no poliakrilamīdiem, poliakrilātiem, poli(dialildimetilamonija hlorīda), polietilēnimīniem, poliamīniem, cietēm un to maisījumiem.

11. Kompozītmateriāls, kas satur virsmapstrādātu kalcija karbonātu un piesārņojumus, kas iegūti ūdens attīrīšanas un/vai dūņu, un/vai nogulšņu atūdeņošanas procesā, process satur šādus posmus:

a) piesārņojumus saturoša attīrāmā ūdens un/vai atūdeņojamo dūņu un/vai nogulšņu sagādāšanu, b) vismaz viena virsmapstrā-

dāta kalcija karbonāta sagādāšanu, kur vismaz 1 % no pieejamās kalcija karbonāta virsmas platības ir pārklāts ar pārklājumu, kas satur vismaz vienu katjonu polimēru, c) a) posmā minētā ūdens un/vai dūņu, un/vai nogulšņu kontaktēšanu ar vismaz vienu b) posmā minēto virsmapstrādāto kalcija karbonātu virsmapstrādātā kalcija karbonāta un piesārņojumu kompozītmateriāla iegūšanai, kur vismaz viens virsmapstrādātais kalcija karbonāts satur kalcija karbonātu ar modificētu virsmu, kas apstrādāts ar katjonu polimēriem papildu apstrādes posmā, un kur kalcija karbonāts ar modificētu virsmu ir iegūts, dabīgam kalcija karbonātam un/vai nogulsņētam kalcija karbonātam reaģējot ar skābi un ar oglekļa dioksīdu pirms virsmapstrādātā kalcija karbonāta pagatavošanas, kur oglekļa dioksīds ir iegūts *in situ*, apstrādājot ar skābi, un/vai ir piegādāts no ārēja avota.

12. Kompozītmateriāls saskaņā ar 11. pretenziju, kur a) posmā minētais ūdens un/vai dūņas un/vai nogulsnes ir izvēlētas no rūpnieciskā notekūdens, dzeramā ūdens, sadzīves notekūdens, dūņām tādām kā ostas dūņas, upes dūņas, piekrastes dūņas vai fermentētās dūņas, notekūdeņi vai tehnoloģiskie ūdeņi no alus darītavām vai citām dzērienu ražotnēm, notekūdeņi vai tehnoloģiskie ūdeņi no papīrrūpniecības, krāsošanas, krāsu vai pārklājumu rūpniecības, lauksaimnieciskie notekūdeņi, lopkautuvju notekūdeņi, ādu rūpniecības notekūdeņi un ādu miecēšanas rūpniecības notekūdeņi.

13. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. vai 12. pretenzijas, kur kalcija karbonāta daļiņas no vismaz viena virsmapstrādātā kalcija karbonāta ir ar vidējo svērto daļiņas diametru d_{50} , kura lielums ir starp 0,01 un 250 μm , labāk starp 0,06 μm un 225 μm , vēl labāk starp 1 μm un 200 μm , pat vēl labāk starp 1 μm un 150 μm , un vislabāk starp 1 μm un 100 μm , un/vai kalcija karbonāta daļiņas no vismaz viena virsmapstrādātā kalcija karbonāta ir ar īpatnējo virsmas platību no 1 līdz 250 m^2/g , vēl labāk no 20 līdz 200 m^2/g , pat vēl labāk no 30 līdz 150 m^2/g , un vislabāk no 30 līdz 100 m^2/g .

14. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kam pozitīvā lādiņa blīvums ir diapazonā starp 1 un 15 mEq/g , vēl labāk diapazonā starp 2,5 un 12,5 mEq/g , un vislabāk diapazonā starp 5 un 10 mEq/g , un/vai virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kurā vismaz 60 % no monomēra vienībām ir katjonu lādiņš, labāk vismaz 70 %, vēl labāk vismaz 80 %, pat vēl labāk vismaz 90 %, un vislabāk vienāds ar 100 %.

15. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 14. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kam vidējā svērtā molekulu masa M_w ir zem 100000 g/mol , vēl labāk no 50000 līdz 75000 g/mol , pat vēl labāk no 50000 līdz 65000 g/mol , un vislabāk no 100000 līdz 300000 g/mol .

16. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kas ir homopolimērs uz monomēra vienību bāzes, kas ir izvēlētas no rindas, kas sastāv no dialildialkilamonija sāļiem; terciāriem un kvartarizētiem amīniem; kvartarizētiem imīniem; labāk dialildialkilamonija sāļiem.

17. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai, kur virsmapstrādātā kalcija karbonāta pārklājums satur vismaz vienu katjonu polimēru, kas ir kopolimērs uz monomēra vienību bāzes, kas ir izvēlētas no dialildialkilamonija sāļiem, un komonomēra vienību bāzes, kas ir izvēlētas no rindas, kas sastāv no akrilamīda; metakrilamīda; N,N-dimetilakrilamīda; akrilskābes; metakrilskābes; vinilsulfonskābes; vinilpirolidona; hidroksiletilakrilāta; stiroļa; metilmetakrilāta; vinilacetāta un to maisījumiem.

18. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 17. pretenzijai, kur vismaz 10 % no pieejamās kalcija karbonāta virsmas platības ir pārklāti ar pārklājumu, kas satur katjonu polimēru, labāk vismaz 20 % no pieejamās virsmas platības, vēl labāk vismaz 30 %, pat vēl labāk vismaz 40 %, un vislabāk vismaz 50 % no pieejamās virsmas platības.

19. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 18. pretenzijai, kur virsmapstrādātais kalcija karbonāts ir pulvera veidā un/vai granulu veidā, vai duļķu veidā.

20. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 19. pretenzijai, kur process satur arī d) posmu, kurā a) posmā minētais attīrāmā ūdens un/vai atūdeņojamās dūņas un/vai nogulsnes ir

pakļautas kontaktam ar vismaz vienu flokulācijas polimēru palīg-līdzekli.

21. Kompozītmateriāls saskaņā ar 20. pretenziju, kur flokulācijas polimēru palīg-līdzeklim vidējā svērtā molekulmasa M_w ir diapazonā no 100000 līdz 1000000 g/mol, labāk diapazonā no 300000 līdz 500000 g/mol, vēl labāk diapazonā no 300000 līdz 1000000 g/mol, un vislabāk diapazonā no 300000 līdz 800000 g/mol, un/vai flokulācijas polimēru palīg-līdzeklis ir nejonu vai jonu, labāk katjonu vai anjonu polimērs, kas tiek izvēlēts no poliakrilamīdiem, poliakrilātiem, poli(dialildimetilamonija hlorīda), polietilēnīmiem, poliamīniem, cietēm un to maisījumiem.

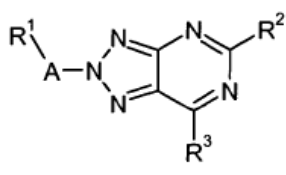
22. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 20. vai 21. pretenzijas, kur c) posms un d) posms ir veikti vienlaicīgi vai atsevišķi, labāk vienlaicīgi.

23. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 22. pretenzijai, kur c) posms un/vai d) posms ir veikts, a) posmā minētā apstrādājamā ūdens un/vai dūņu, un/vai nogulšņu virsmu vismaz daļēji pārklājot ar vismaz vienu b) posmā minēto virsmapstrādāto kalcija karbonātu un/vai a) posmā minēto apstrādājamo ūdeni un/vai dūņas, un/vai nogulsnes samaisot ar vismaz vienu b) posmā minēto virsmapstrādāto kalcija karbonātu.

24. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 23. pretenzijai, kur c) posms un/vai d) posms ir atkārtots vienu vai vairākas reizes.

25. Kompozītmateriāls saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 24. pretenzijai, kur kompozītmateriāls no vismaz viena virsmapstrādātā kalcija karbonāta un piesārņojumiem no ūdens un/vai dūņu, un/vai nogulšņu fāzes izņemts ar filtrāciju, sedimentāciju un/vai centrifugēšanu.

- (51) **C07D 487/04**^(2006.01) (11) **2782915**
A61K 31/519^(2006.01)
A61K 9/00^(2006.01)
A61K 47/10^(2006.01)
A61K 47/12^(2006.01)
A61K 9/48^(2006.01)
A61K 9/20^(2006.01)
- (21) 12794684.6 (22) 22.11.2012
(43) 01.10.2014
(45) 30.09.2015
(31) 11190777 (32) 25.11.2011 (33) EP
(86) PCT/EP2012/073315 22.11.2012
(87) WO2013/076182 30.05.2013
(73) F.Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
(72) BISSANTZ, Caterina, FR
GRETHER, Uwe, DE
KIMBARA, Atsushi, JP
NETTEKOVEN, Matthias, DE
ROEVER, Stephan, DE
ROGERS-EVANS, Mark, CH
(74) Pomeranc, Didier, F. Hoffmann-La Roche AG, Patent Department, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(54) **[1,2,3]TRIAZOLO[4,5-d]PIRIMIDĪNA ATVASINĀJUMI KĀ KANNABINOĪDA RECEPTORA 2 AGONISTI**
[1,2,3]TRIAZOLO[4,5-d]PYRIMIDINE DERIVATIVES AS AGONISTS OF THE CANNABINOID RECEPTOR 2 AGONISTS
(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



turklāt

A ir alkilēngrupa, hidroksialkilēngrupa, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})-$ grupa, $-\text{C}(\text{O})-$ grupa, $-\text{SO}_2-$ grupa vai nav;

R¹ ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkoksigrupa, halogēnalkoksigrupa, fenilgrupa, halogēnfenilgrupa, alkoksifenilgrupa, halogēnalkilfenilgrupa, halogēnalkoksifenilgrupa, cianofenilgrupa, hidroksialkoksifenilgrupa, alkilsulfonilfenilgrupa, alkilsulfonilaminofenilgrupa, (halogēn)(halogēnalkil)fenilgrupa, (halogēn)(alkoksi)fenilgrupa, cianogrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkil-alkoksigrupa, aminogrupa, heterociklgrupa, alkilheterociklgrupa, hidroksiheterociklgrupa, alkilheterociklgrupa, heteroarilgrupa, halogēnheteroarilgrupa, alkilheteroarilgrupa, (alkil)(alkilsulfonil)heteroarilgrupa, (halo)(alkilamino)heteroarilgrupa, halogēnalkil-heteroarilgrupa, cikloalkilheteroarilgrupa vai nitro-benzo[1,2,5]oksadiazolilaminoheteroarilgrupa, turklāt heterociklgrupa ir 3- līdz 8-locekļu karbociklisks gredzens, kas ietver vismaz vienu slāpekļa vai skābekļa atomu, un turklāt heteroarilgrupa ir piridinilgrupa, pirazolilgrupa, oksadiazolilgrupa, furazanilgrupa, tetrazolilgrupa, triazolilgrupa vai oksipiridinilgrupa; R² ir alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, hidroksialkilgrupa, alkoksialkilgrupa, cikloalkoksialkilgrupa, cikloalkilalkoksigrupa, halogēnalkoksigrupa, alkoksigrupa vai alkilaminogrupa; R³ ir halogēna atoms vai $-\text{NR}^4\text{R}^5$ grupa; viens no R⁴ un R⁵ ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa un otrs ir alkilgrupa vai cikloalkilgrupa; vai R⁴ un R⁵ kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tās ir pievienotas, veido heterociklgrupu vai aizvietotu heterociklgrupu, turklāt heterociklgrupa ir morfolinilgrupa, piperidinilgrupa, piperazinilgrupa, piroolidinilgrupa, 2-oksā-6-azaspiro[3,3]heptilgrupa, azetidīnigrupa, tiazolidinilgrupa, tiomorfolinilgrupa, dioksotiomorfolinilgrupa, oksazepanilgrupa, 2-oksā-6-azaspiro[3,4]oktilgrupa, 6-oksā-1-azaspiro[3,3]heptilgrupa, 2-oksā-5-aza-spiro[3,4]oktilgrupa, izoksoazolidinilgrupa, aziridinilgrupa vai dioksoizotiazolidinilgrupa un turklāt aizvietota heterociklgrupa ir heterociklgrupa aizvietota ar 1 līdz 4 aizvietotājiem, kas ir neatkarīgi izvēlēti no alkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, hidroksialkilgrupas, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, cianogrupas un alkilkarbonilaminogrupas; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai esters.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt A ir alkilēngrupa, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})-$ grupa vai nav.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt A ir alkilēngrupa.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt A ir metilēngrupa, etilēngrupa vai $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ grupa.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt R¹ ir alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkoksigrupa, fenilgrupa, halogēnfenilgrupa, alkoksifenilgrupa, halogēnalkilfenilgrupa, halogēnalkoksifenilgrupa, cianofenilgrupa, cikloalkilgrupa, heterociklgrupa, halogēnheteroarilgrupa vai alkilheteroarilgrupa, turklāt heterociklgrupa ir oksetanilgrupa, un turklāt heteroarilgrupa ir piridinilgrupa vai furazanilgrupa.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt R¹ ir alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkoksigrupa, fenilgrupa, halogēnfenilgrupa, alkoksifenilgrupa, halogēnalkilfenilgrupa, halogēnalkoksifenilgrupa, cianofenilgrupa, cikloalkilgrupa, oksetanilgrupa, piridinilgrupa, halogēnpiridinilgrupa vai alkilfurazanilgrupa.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt R¹ ir trifluormetilgrupa, fenilgrupa, hlorfenilgrupa, bromfenilgrupa, cianofenilgrupa, cikloheksilgrupa, piridinilgrupa, hlorpiridinilgrupa, metilfurazanilgrupa vai trifluormetilfenilgrupa.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt R² ir alkilgrupa.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt R² ir *tert*-butilgrupa.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt R³ ir $-\text{NR}^4\text{R}^5$ grupa.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, turklāt R⁴ un R⁵ kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tās ir pievienotas, veido morfolinilgrupu, halogēnpiroolidinilgrupu vai hidroksipiroolidinilgrupu.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, turklāt R⁴ un R⁵ kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tās ir pievienotas, veido morfolinilgrupu, difluorpiroolidinilgrupu vai hidroksipiroolidinilgrupu.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, kas ir izvēlēts no sekojošiem:

5-*terc*-butil-2-(2-hlorbenzil)-7-morfolin-4-il-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-4-fluorbenzil)-7-morfolin-4-il-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-etil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-metoksietil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-etanons;
5-*terc*-butil-2-cikloheksilmetil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(3-hlorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(4-hlorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,3-dihlorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,4-dihlorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,5-dihlorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,6-dihlorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-4-fluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-6-fluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-piridin-2-ilmetil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-piridin-3-ilmetil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-piridin-4-ilmetil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2,2,2-trifluoretīl)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-4,5-difluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-3,6-difluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-(2-brombenzil)-5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-trifluormetilbenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-metoksibenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-trifluormetoksibenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-ilmetil]-benzonitrils;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-fentil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-1-fenil-etanons;
5-*terc*-butil-2-[(*R*)-1-(2-hlorfenil)-etil]-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-[(*S*)-1-(2-hlorfenil)-etil]-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-3-fluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-5-fluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-oksetan-3-il-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,6-dihlor-3-fluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlorpiridin-3-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(4-hlorpiridin-3-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(3-hlorpiridin-2-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,5-dihlorpiridin-3-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(3,6-dihlorpiridin-2-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(4-metilfurazan-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(3-metil-[1,2,4]oksadiazol-5-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-[2-(4-hlorfenil)-etil]-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-[2-(3-hlorfenil)-etil]-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-[2-(4-hlorfenil)-etil]-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,4-dihlorpiridin-3-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(*R*)-tetrahidrofuran-3-il-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(*S*)-tetrahidrofuran-3-il-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-1-(2-hlorfenil)-etanons;
5-*terc*-butil-2-(2,3-dihlor-6-fluorbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-metānsulfonilbenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-piridin-2-il-etil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(3-metiloksetan-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-1-(3-hlorfenil)-etanons;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-1-(4-hlorfenil)-etanons;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-1-piridin-3-il-etanons;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2,3,6-trihlorbenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-3-trifluormetilbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2-hlor-6-fluor-3-metoksibenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-piridin-3-il-etil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-piridin-4-il-etil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(2,3-dihlor-6-trifluormetilbenzil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(3,4-dihlorpiridin-2-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(1,1-diokso-1λ6-tietan-3-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(1,1-diokso-1λ6-tiofen-3-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
2-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-il]-1-piridin-2-il-etanons;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(5-metil-[1,3,4]oksadiazol-2-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-2-(3-hlorpiridin-4-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(5-metil-[1,2,4]oksadiazol-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(1-metil-1H-tetrazol-5-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2-metil-2H-[1,2,4]triazol-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(5-metānsulfonil-4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
{3-[5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-ilmetil]-5-hlor-piridin-4-il}-dimetilamīns;
5-*terc*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(3-trifluormetil-1H-pirazol-4-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
(*S*)-1-[5-*terc*-butil-2-(4-metilfurazan-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-ols;
(*S*)-1-[5-*terc*-butil-2-(3-metil-[1,2,4]oksadiazol-5-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-ols;

tert-butil-[7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(1-metil-1H-tetrazol-5-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]-amīns;
tert-butil-[7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(4-metilfurazan-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-5-il]-amīns;
 N-((S)-1-[2-(2-hlorbenzil)-5-((S)-2,2,2-trifluor-1-metiletoksi)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-il]-acetamīds;
 N-((S)-1-[2-(2-trifluorometilbenzil)-5-((S)-2,2,2-trifluor-1-metiletoksi)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-il]-acetamīds;
 N-((S)-1-[2-(2-metānsulfonilbenzil)-5-((S)-2,2,2-trifluor-1-metiletoksi)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-il]-acetamīds;
 N-((S)-1-[5-*tert*-butilamino-2-(2-hlorbenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-il]-acetamīds;
 un

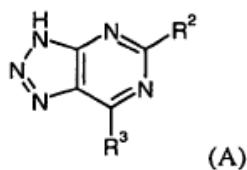
(S)-1-[5-*tert*-butilamino-2-(1-metil-1H-tetrazol-5-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-ols.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, kas ir izvēlēts no sekojošiem:

5-*tert*-butil-2-(2-hlorbenzil)-7-morfolin-4-il-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-2-cikloheksilmetil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-piridin-4-ilmetil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(2,2,2-trifluoretil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 2-(2-brombenzil)-5-*tert*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 2-[5-*tert*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-2-ilmetil]-benzonitrīls;
 5-*tert*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-feniletil-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-2-[(R)-1-(2-hlorfenil)-etil]-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-2-(4-hlorpiridin-3-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-2-(3-hlorpiridin-2-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2-(4-metilfurazan-3-ilmetil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 5-*tert*-butil-2-(3-hlorpiridin-4-ilmetil)-7-(3,3-difluorpirolidin-1-il)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidīns;
 un

(S)-1-[5-*tert*-butil-2-(2-trifluorometilbenzil)-2H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidin-7-il]-pirolidin-3-ols.

15. Process savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (A) reakciju



R¹-A-X un bāzes klātbūtnē, vai R¹-A-OH klātbūtnē Mitsunobu reakcijas apstākļos, turklāt A un R¹ līdz R³ ir saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai un turklāt X ir halogēna atoms vai SO₂ grupa.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai pielietošanai kā terapeitiski aktīva viela.

17. Farmaceutiska kompozīcija kas ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, un terapeitiski inerti nesēji.

18. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai pielietošanai sekojošu slimību vai traucējumu: sāpes, ateroskleroze, vecuma izraisīta tīklenes plankuma deģenerācija, diabētiska retinopātija, glaukoma, cukura diabēts, iekaisums, iekaisīga zarnu slimība, išēmija, reperfūzijas trauma, akūta aknu mazspēja, aknu fibroze, plaušu fibroze, nieru fibroze, sistēmiska fibroze, akūta transplantāta atgrūšana, hroniska transplantāta nefropātija, diabētiska nefropātija, glomerulonefropātija, kardiomiopātija, sirds mazspēja, miokarda išēmija, miokarda infarkts, sistēmiska skleroze, termiska trauma, apdegums, hipertrofas rētas, keloīdi, smaganu iekaisums ar drudzi, aknu ciroze vai audzēji, kaulu masas regulācija, neiroleģenerācija, insults, pārejoša išēmiska lēkme vai uveīts, ārstēšanā vai profilaksē.

(51) **E05D 11/06**^(2006.01) (11) **2785940**
E05F 1/12^(2006.01)
E05F 3/20^(2006.01)
E05F 3/12^(2006.01)

(21) 13792484.1 (22) 04.10.2013
 (43) 08.10.2014
 (45) 17.02.2016
 (31) VI20120249 (32) 04.10.2012 (33) IT
 VI20120250 04.10.2012 IT
 (86) PCT/IB2013/059121 04.10.2013
 (87) WO2014/054029 10.04.2014
 (73) In & Tec S.r.l., Via Guglielmo Oberdan 1/A, 25128 Brescia, IT

(72) BACCHETTI, Luciano, IT
 (74) Autuori, Angelo, et al, EUREKA IP Consulting, Borgo Santa Lucia, 31, 36100 Vicenza, IT
 Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **ENĢES IERĪCE DURVĪM, SLĒĢIEM UN TAMLĪDŽIEM OBJEKTIEM HINGE DEVICE FOR DOORS, SHUTTERS AND THE LIKE**

(57) 1. Enģes ierīce, lai aizvēršanas un/vai atvēršanas laikā rotējoši pārvietotu un/vai regulētu aizverošo elementu (D), piemēram, durvis, slēģus vai tamlīdzīgi, kas piestiprināts pie stacionāras balstkonstrukcijas (S), piem., rāmja vai sienas, pie kam ierīces sastāvā ir:

- nekustīgs elements (10), kas piestiprināts pie stacionāras balstkonstrukcijas (S),

- kustīgs elements (11), kas piestiprināts pie slēģelementa (D), pie tam: viens no minētajiem nekustīgajiem elementiem (10) un kustīgais elements (11) ietver pirmo cauruļveida pusapvalku (12), kas ietver darba kameru (20), kura nosaka longitudinālo asi (X); cits minētais nekustīgais elements (10) un kustīgais elements (11) ietver otro cauruļveida pusapvalku (13), pie tam pēdējais pusapvalks no minētajiem pusapvalkiem un minētais pirmais cauruļveida pusapvalks (12) ir savietoti viens uz otra, lai savstarpēji rotētu ap minēto longitudinālo asi (X) starp vaļējo un noslēgto stāvokli,

- šarnīrs (50), kas novietots līdzās minētajai asij (X) minētās darba kameras (20) ārpusē, pie tam: minētais šarnīrs (50) un minētais otrais cauruļveida pusapvalks (13) ir stingri savienoti, un minētais šarnīrs (50) satur cauruļveida korpusu (52),

- plunžera elements (30), kas ir operatīvi savienots ar minēto šarnīru (50) un ir ievietots minētajā darba kamerā (20), lai slīdētu gar minēto asi (X) starp virzuļa gājienu gala pozīciju, kas ir proksimālā pozīcija minētajam šarnīram (50), un pozīciju, kas atbilst kustīgā elementa (11) vienai vaļējai vai noslēgtajai pozīcijai, un starp distālo virzuļa gājienu gala pozīciju, kas atbilst otrai kustīgā elementa vaļējai un noslēgtajai pozīcijai (11),

- iegarens cilindrisks elements (60), kas stiepjas gar minēto asi (X), kuras pirmā gala daļa (61) ir ievietota darba kamerā (20), kas ir savstarpēji savienota ar minēto plunžera elementu (30), un otrā gala daļa (62) ir ārpus darba kameras (20) un slīd minētā šarnīra (50) cauruļveida korpusā (52),

- cauruļveida vadieliktnis (80), kuram ir virzošo izciļņu gropju (81) pāris, kas telpiski ir izkārtots 180° leņķī, pie tam minētais cauruļveida vadieliktnis (80) koaksiāli atrodas ārpus minētā šarnīra (50) cauruļveida korpusa (52); pie tam:

- minētā darba kamera ietver elastīgu pret darbības līdzekli (40), kas iedarbojas uz minēto plunžera elementu (30), lai to atgrieztu no vienas minētās proksimālās vai distālās virzuļa gājienu gala pozīcijas otrā minētajā proksimālajā vai distālajā virzuļa gājienu gala pozīcijā, pie tam minētais elastīgais pret darbības līdzeklis (40) ir pārvietojams gar minēto asi (X) starp maksimālā un minimālā izvērsuma pozīcijām,

- minētais šarnīrs (50) ietver vismaz vienu rievu pāri (70', 70''), kas savstarpēji leņķiski vienādi ir izkārtotas 180° leņķī, pie tam: katra minētā rievu (70', 70'') sastāv vismaz no vienas spirālveida daļas (71', 71''), kas ir aptīta ap minēto asi (X), un minētās rievu (70', 70'') savstarpēji savienojas, lai veidotu vienotu caurejošu darbināšanas elementu (72),

- minētā iegarenā elementa (60) minētā otra gala daļa (62) ietver tapu (73), kas ievietota caur minēto caurejošo iedarbināšanas elementu (72) minētajās vadotnes izciļņu gropēs (81), slīdot cauri

tādā veidā, lai savstarpēji saķertos ar minēto šarnīru (50), minēto iegareno cilindrisko elementu (60) un minēto vadieliktņi (80),

minētais vadieliktņis (80) un minētais cauruļveida pusapvalks (12) ir unitāri savstarpēji savienoti, lai ļautu minētajām izciļņu gropēm (81) virzīt minētās tapas (73) slīdēšanu, ko iedarbina minētais caurejošais iedarbināšanas elements (72), pie tam minētais vadieliktņis (80) un minētais otrais cauruļveida pusapvalks (13) ir koaksiāli savienoti tādā veidā, ka veido viens otra rotācijas asi,

kas raksturīgs ar to, ka minētais elastīgais pret darbības līdzeklis (40) un minētais plunžera elements (30) ir savstarpēji savienoti tā, ka pret darbības līdzeklis (40) ir maksimāli attālinātā pozīcijā atbilstoši distālajai plunžera (30) gājienu gala pozīcijai, un minētais elastīgais pret darbības līdzeklis (40) ir iestarpināts starp minētā šarnīra (50) minēto cilindrisko daļu (52) un minēto plunžera elementu (30), un ar to, ka minētais pirmais cauruļveida pusapvalks (12) ietver gala daļu (16) operatīvā savienojumā ar minēto šarnīru (50), kā arī ar to, ka vismaz viens pirmais pretberzes elements (110), kas ir iestarpināts starp minēto šarnīru (50) un minētā pirmā cauruļveida pusapvalka (12) minēto gala daļu (16), papildus ir aprīkots tā, lai minimizētu berzi elastīgā pret darbības līdzekļa (40) iedarbības dēļ uz minēto šarnīru (50).

2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētais vadieliktņis (80) un minētais otrais cauruļveida pusapvalks (13) ir koaksiāli savienoti atvienojamā veidā, savstarpēji slīdot gar minēto asi (X) tā, lai ļautu lietotājam atkabināt noslēgšanas elementu (D), to paceļot, no stacionārās balststruktūras (S).

3. Ierīce saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam: minētā šarnīra (50) minētajai cauruļveida daļai (52) iekšējais diametrs (Di') būtībā sakrīt ar minētā iegareno cilindriskā elementa (60) diametru (D''), bet ārējais diametrs (De') ir mazāks par vai būtībā vienāds ar minētā vadieliktņa (80) iekšējo diametru (Di''); otrajam cauruļveida pusapvalkam (13) ir iekšējā sānu sienu (13'), kas vērsta pret minētā vadieliktņa (80) ārējo sānu sienu (82), kad tā ir savienota ar pirmo cauruļveida pusapvalku (12); minētā pirmā cauruļveida pusapvalka (12) minētā gala daļa (16) ietver būtībā gredzenveida papildinājumu (18) ar ārējo diametru (De), kas ir lielāks par vai būtībā vienāds ar minētā šarnīra (50) minētās cauruļveida daļas (52) ārējo diametru (De'), bet iekšējais diametrs (Di) būtībā sakrīt ar minētā šarnīra (50) minētās cauruļveida daļas (52) iekšējo diametru (Di''); minētais būtībā gredzenveida papildinājums (18) satur pirmo gala virsmu (21), kas norobežo minētās darba telpas (20) gala sienu; otrā gala virsma (19'), kas atrodas pretī minētajai pirmajai gala virsmai (21), ir vērsta pret minētā šarnīra (50) minētās cauruļveida daļas (52) apakšējo daļu (54), lai to atbalstītu; iekšējā sānu virsma (19'') ir vērsta pret minētā iegareno cilindriskā elementa (60) sānu sienu (63), un ārējā sānu virsma (19''') ir vērsta pret minētā vadieliktņa (80) iekšējo sienu (83).

4. Ierīce saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu apturēšanas skrūvi (90) ierīces augšējā vai apakšējā gala (2, 3) tuvumā, pie kam: minētā vismaz viena apturēšanas skrūve (90) ietver pirmo galu (91), kas ir pakļauts selektīvai mijiedarbībai ar minētā iegareno cilindriskā elementa (60) minēto otro beigu daļu (62), bet apturēšanas skrūves (90) otro galu (92) lietotājs darbina no ārpusē, lai regulētu minēto virzuļa gājienu gar minēto asi (X); minētā vismaz viena apturēšanas skrūve (90) ir ievietota minētā šarnīra (50) minētajā gala daļā (51), lai slīdētu gar minēto asi (X) starp miera stāvokļa pozīciju prom no iegareno cilindriskā elementa (60) otrās beigu daļas (62) gala un darba stāvokļa pozīciju, esot savstarpējā kontaktā.

5. Ierīce saskaņā ar vienu vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētais pirmais un/vai otrais cauruļveida pusapvalki (12, 13) ir izgatavoti no polimēru materiāla, un minētais šarnīrs (50) un/vai minētais vadieliktņis (80) ir izgatavoti no metāliska materiāla.

6. Ierīce saskaņā ar vienu vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, pie kam: minētajam vadieliktņim (80) augšējā daļā (87) ir centrālā atvere (86); minētais vadieliktņis (80) un minētais šarnīrs (50) ir savstarpēji konfigurēti tā, ka minētā šarnīra (50) gala daļa (51) iet caur vadieliktņa (80) centrālo atveri (86); minētais šarnīrs (50) atrodas minētajā vadieliktņī (80) un ir iestarpināts starp minēto vismaz vienu pretberzes elementu (110) un tā paša vadieliktņa (80) minēto augšējo daļu (87); vismaz viens otrais pretberzes elements (112) ir izvietots ārpus minētā vadieliktņa (80) starp minēto augšējo daļu (87) un minēto otro cauruļveida pus-

apvalku (13) tā, ka noslēdzošais elements (D) neneslogo minēto šarnīru (50).

7. Ierīce saskaņā ar vienu vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētais vadieliktņis (80) un otrais cauruļveida pusapvalks (13) ir savstarpējā telpiskā saistībā tā, ka minētais pusapvalks (13) ir telpiski distancēts no minētā pirmā cauruļveida pusapvalka (12).

8. Ierīce saskaņā ar vienu vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, pie kam: minētais fiksētais elements (10) ietver pirmo cauruļveida pusapvalku (12); minētais kustīgais elements (11) ietver minēto otro cauruļveida pusapvalku (13), kurš ir uzlikts virsū uz minētā pirmā cauruļveida pusapvalka (12); minētā pirmā cauruļveida pusapvalka (12) minētā gala daļa (16) rotējoši atbalsta minēto šarnīru (50); minētais vadieliktņis (80) nosaka minētā otrā cauruļveida pusapvalka (13) rotācijas asi.

9. Ierīce saskaņā ar vienu vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, pie kam: minētā darba kamera (20) ietver minēto darba fluīdu un ir aprīkota vismaz ar vienu blīvējošo elementu (22), lai novērstu minētā darba fluīda noplūdi no minētās darba kameras (20); minētais plunžera elements (30) pieļauj minētās darba kameras (20) sadalīšanu vismaz vienā pirmajā un otrajā mainīga tilpuma nodalījumos (23, 24), kas fluidāli komunikē cits ar citu un, vēlams, atrodas blakus; minētais plunžera elements (30) satur caurejošu atveri (31), lai novestu fluidālā komunikācijā minēto pirmo un minēto otro mainīga tilpuma nodalījumus (23, 24), un ventiļa līdzekli (32), kas mijiedarbojas ar minēto atveri (31), lai ļautu darba fluīdam pārvietoties starp minēto pirmo nodalījumu (23) un minēto otro nodalījumu (24) pēc viena noslēdzošā elementa (D) atvēršanas vai aizvēršanas un lai novērstu fluīda pretplūsmu pēc otra noslēdzošā elementa atvēršanas vai tā paša noslēdzošā elementa (D) aizvēršanas; papildus ir izveidots hidrauliskais kontūrs (100), lai ļautu darba fluīdam pārvietoties starp minēto pirmo nodalījumu (23) un minēto otro nodalījumu (24) pēc otra noslēdzošā elementa (D) atvēršanas vai aizvēršanas.

10. Ierīce saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, pie kam: minētais plunžera elements (30) ir cieši iestarpināts minētajā darba kamerā (20); minētais pirmais cauruļveida pusapvalks (12) vismaz daļēji ietver minēto hidraulisko kontūru (100), kuram ir vismaz viena pirmā atvere (101) minētajā pirmajā nodalījumā (23) un vismaz viena otrā atvere (106) minētajā otrajā nodalījumā (24).

11. Ierīce saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, pie kam minētais hidrauliskais kontūrs (100) ietver trešo atveri (102) minētajā otrajā nodalījumā (24); minētais plunžera elements (30) ir telpiskā saistībā ar minētā kontūra (100) minēto otro un trešo atveri (102, 106) tā, lai tas paliktu fluidāli atvienots no minētās trešās atveres (102) visā plunžera elementa (30) virzuļa gājienu laikā un lai priekš pirmās minētā virzuļa gājienu daļas tas paliktu fluidāli savienots ar minēto otro atveri (106), bet priekš otrās minētā virzuļa gājienu daļas tas paliktu fluidāli atvienots no tās.

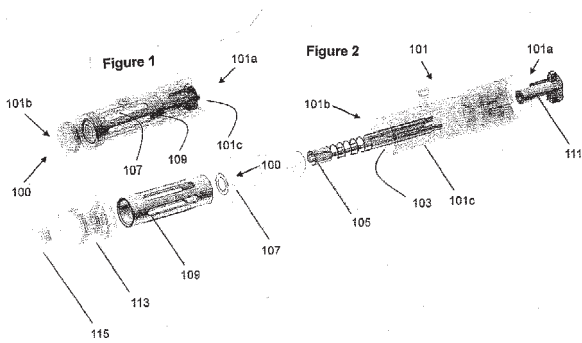
12. Ierīce saskaņā ar jebkuru iepriekš minēto pretenziju, pie kam: minēto rievu (70', 70'') spirālveida daļas (71', 71'') attiecīgi labēji un kreisi orientētas; minētās izciļņu gropes (81) ietver vismaz vienu pirmo daļu (84'), kas būtībā plešas paralēli minētajai asij (X) vai nedaudz slīpi attiecībā pret asi (X) ar slīpumu, kas ir pretējs minētā šarnīra (50) minēto rievu (70', 70'') slīpumam; minētās izciļņu gropes (81) papildus ietver vismaz vienu otro daļu (84''), kas plešas būtībā tām perpendikulāri, kad minētā tapa (73) slīd gar minēto izciļņu gropju (81) vismaz vienu pirmo daļu (84'); minētie elastīgie pret darbības līdzekļi (40) pārvietojas starp maksimālā un minimālā izvērsuma pozīcijām; minētais elastīgās pret darbības līdzeklis (40) paliek minētajā minimālajā izvērsuma pozīcijā, kad tapa (73) slīd gar minēto izciļņu gropju (81) vismaz vienu otro daļu (84'').

13. Ierīce saskaņā ar iepriekš minēto pretenziju, pie kam minētais elastīgās pret darbības līdzeklis (40) ir iepriekš noslogots tā, lai maksimizētu ierīces aizvēršanas vai atvēršanas spēku un/vai lai samazinātu tās masivumu.

14. Ierīce saskaņā ar 12. vai 13. pretenziju, pie kam minēto izciļņu gropju (81) minētā vismaz viena pirmā un vismaz viena otrā daļas (84', 84'') ir savstarpēji secīgas.

15. Ierīce saskaņā ar 12., 13. vai 14. pretenziju, pie kam: minētā vismaz viena pirmā daļa (84') plešas būtībā paralēli minētajai asij (X); minētais plunžera elements (30) slīd starp pirmo un otro virzuļa gājienu gala pozīciju, kad minētā tapa (73) slīd gar minēto izciļņu gropju (81) minēto vismaz vienu pirmo daļu (84'), paliekot

porainu interfeisu (107), kas vismaz daļēji izklāj iekšējo eju aerosola veidošanas substrāta pārvietošanai no uzglabāšanas daļas uz iztvaicētāju.



- (51) **A24F 47/00**^(2006.01) (11) **2814342**
A24D 3/04^(2006.01)
A24D 3/10^(2006.01)
- (21) 12818792.9 (22) 28.12.2012
 (43) 24.12.2014
 (45) 09.03.2016
 (31) 12155248 (32) 13.02.2012 (33) EP
 (86) PCT/EP2012/077086 28.12.2012
 (87) WO2013/120565 22.08.2013
 (73) Philip Morris Products S.A., Quai Jeanrenaud 3, 2000 Neuchâtel, CH
 (72) ZUBER, Gérard, CH
 MEYER, Cédric, CH
 SANNA, Daniele, IT
 LOUVET, Alexis, CH
 (74) Bates, Alan Douglas Henry, Reddie & Grose LLP, 16 Theobalds Road, London WC1X 8PL, GB
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (54) **AEROSOLA ĢENERĒŠANAS IZSTRĀDĀJUMS, KAM IR AEROSOLA DZESĒŠANAS ELEMENTS**
AEROSOL-GENERATING ARTICLE HAVING AN AEROSOL-COOLING ELEMENT

(57) 1. Uzsildāms aerosola ģenerēšanas izstrādājums (10), kas satur vairākus elementus, kas kopā samontēti stienīša (11) formā, turklāt: vairāki elementi satur aerosola veidošanas substrātu (20), aerosola dzesēšanas elementu (40), kas izvietots stienītī (11) plūsmas virzienā aiz aerosola veidošanas substrāta (20), un filtru, kas izvietots stienītī (11) plūsmas virzienā aiz aerosola dzesēšanas elementa; aerosola dzesēšanas elements (40) ir izveidots no gofrētas loksnes, kas satur vairākus longitudināli esošus kanālus, raksturīgs ar to, ka aerosola dzesēšanas elements (40) ir izveidots no gofrētas un kopā savāktas polimēra loksnes tādā veidā, ka aerosola dzesēšanas elements longitudinālā virzienā satur vairākus longitudināli esošus kanālus ar longitudinālo porainību no 50 % līdz 90 %, turklāt longitudinālā porainība ir iegūta, attiecinoši materiāla šķēsgriezuma laukumu, kas veido aerosola dzesēšanas elementu, pret aerosola ģenerēšanas izstrādājuma šķēsgriezuma laukumu daļā, kas satur aerosola dzesēšanas elementu.

2. Uzsildāms aerosola ģenerēšanas izstrādājums (10) saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt aerosola dzesēšanas elementa (40) kopējais virsmas laukums ir robežās no 300 mm² uz aerosola dzesēšanas elementa garuma vienu mm līdz 1000 mm² uz aerosola dzesēšanas elementa garuma vienu mm.

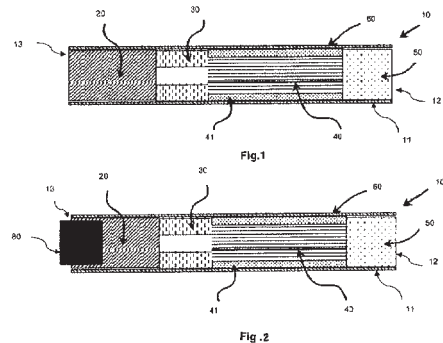
3. Uzsildāms aerosola ģenerēšanas izstrādājums (10) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā aerosola dzesēšanas elements (40) satur polimērloksnes materiālu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no polietilēna, polipropilēna, polivinilhlorīda, polietilēntereftalāta, polipienskābes un celulozes acetāta.

4. Uzsildāms aerosola ģenerēšanas izstrādājums (10) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā aerosola dzesēšanas elementa (40) garums ir robežās no 7 mm līdz 28 mm.

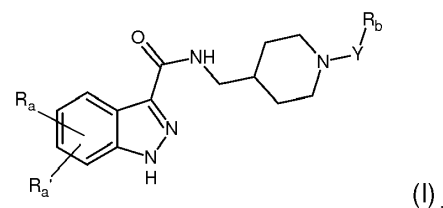
5. Uzsildāms aerosola ģenerēšanas izstrādājums (10) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā aerosola dzesēšanas

elements (40) satur materiālu, kas iziet fāžu pāreju, kad aerosols, kas rodas no aerosola veidošanas substrāta (40), tiek vilkts caur aerosola dzesēšanas elementu (40).

6. Uzsildāms aerosola ģenerēšanas izstrādājums (10) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur starplikas elementu (30), kas stienītī (11) ir izvietots starp aerosola veidošanas substrātu (20) un aerosola dzesēšanas elementu (40).



- (51) **C07D 401/12**^(2006.01) (11) **2817301**
C07D 401/14^(2006.01)
A61K 31/454^(2006.01)
A61K 31/4545^(2006.01)
A61P 3/00^(2006.01)
A61P 25/00^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
C07D 405/14^(2006.01)
C07D 413/14^(2006.01)
C07D 417/14^(2006.01)
- (21) 13703799.0 (22) 08.02.2013
 (43) 31.12.2014
 (45) 23.12.2015
 (31) 12156298 (32) 21.02.2012 (33) EP
 (86) PCT/EP2013/052523 08.02.2013
 (87) WO2013/124169 29.08.2013
 (73) AZIENDE CHIMICHE RIUNITE, ANGELINI FRANCESCO - A.C.R.A.F. - S.p.A., Viale Amelia, 70, 00181 Roma, IT
 (72) ALISI, Maria, Alessandra, IT
 CAZZOLLA, Nicola, IT
 GAROFALO, Barbara, IT
 FURLOTTI, Guido, IT
 MAGARO', Gabriele, IT
 OMBRATO, Rosella, IT
 MANCINI, Francesca, IT
 (74) Allaix, Roberto, et al, Marchi & Partners Srl, Via Pirelli 19, 20124 Milano, IT
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (54) **1H-INDAZOL-3-KARBOKSAMĪDA SAVIENOJUMU IZMANTOŠANA PAR GLIKOGĒNA SINTĀZES KINĀZES 3 BETA INHIBITORIEM**
USE OF 1H-INDAZOLE-3-CARBOXAMIDE COMPOUNDS AS GLYCOGEN SYNTHASE KINASE 3 BETA INHIBITORS
- (57) 1. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi ar šādu vispārīgo formulu (I):



kur:
 R_a un R_a', kas ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra, ir ūdeņraža atoms; halogēna atoms; (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₂-C₆)alkenilgrupa, (C₂-C₆)alkinilgrupa un (C₁-C₆)alkoksigrupa, kas neobligāti ir aizvietota

ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, $-NH_2$ un (C_1-C_3) alkoksigrupa; karbociklisks vai heterociklisks gredzens, alifātisks vai aromātisks, kuram ir no 3 līdz 12 locekļiem, kas neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, (C_1-C_6) alkilgrupa, (C_1-C_6) alkoksigrupa, $-NR_1R_2$, $-C(O)OH$, $-C(O)OR_1$ un $-C(O)NR_1R_2$;

Y ir saite, (C_1-C_6) alkilgrupa, (C_2-C_6) alkenilgrupa vai (C_2-C_6) alkinilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, $-NH_2$ un (C_1-C_3) alkoksigrupa;

R_b ir karbociklisks vai heterociklisks gredzens, alifātisks vai aromātisks, kuram ir no 3 līdz 12 locekļiem, kas ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, nitrogrupa, ciāngrupa, $-CF_3$, (C_1-C_6) alkoksigrupa, benziloksigrupa, (C_1-C_4) alkilgrupa, (C_2-C_4) alkenilgrupa un (C_2-C_4) alkinilgrupa, $-NHSO_2CH_3$, $-SO_2NH_2$, $-Z-C(O)OH$, $-Z-C(O)OR_1$ un $-Z-C(O)NR_1R_2$, kur Z ir σ -saite vai (C_1-C_3) alkilgrupa;

R_1 un R_2 neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, (C_1-C_4) alkilgrupa, (C_2-C_4) alkenilgrupa, (C_2-C_4) alkinilgrupa un fenilgrupa; un to pievienotās skābes sāļi ar farmaceitiski pieņemamām organiskām vai neorganiskām skābēm in bāzēm;

izmantošanai slimības ārstēšanā, kuru izraisa nekontrolēta GSK-3 β aktivācija un/vai pārmērīga ekspresija, turklāt slimība ir izvēlēta no šādas rindas: (i) insulīna rezistences izraisīti traucējumi; (ii) neiroleģeneratīvas slimības; (iii) garastāvokļa traucējumi; (iv) šizotipiski traucējumi; (v) vēzis; (vi) iekaisums, (vii) ar vielas atkarību saistīti traucējumi; un (viii) epilepsija.

2. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētie insulīna rezistences izraisītie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: 2. tipa diabēts, X sindroms, aptaukošanās un policistisko olnīcu sindroms.

3. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētās neiroleģeneratīvās slimības ir izvēlētas no šādas rindas: Pārkinsona slimība, Alzheimerā slimība, Hantingtona slimība un muguras neiroleģeneratīvie traucējumi.

4. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt minētie muguras neiroleģeneratīvie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: amiotrofiskā laterālā skleroze, multiplā skleroze, muguras muskuļu atrofija un neiroleģenerācija, kas saistīta ar muguras smadzeņu bojājumu.

5. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētie garastāvokļa traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: bipolārie traucējumi un depresīvie traucējumi.

6. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētie bipolārie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: bipolārie traucējumi I, bipolārie traucējumi II, ciklotīmija un neprecizēti bipolārie traucējumi (BD-NOS).

7. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētie depresīvie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: smagi depresīvie traucējumi (MDD), atipiska depresija (AD), melanoliskā depresija, smaga psihotiska depresija (PMD), katoniska depresija, pēcdzemdību depresija (PPD), sezonāli afektīvi traucējumi (SAD), distīmija un neprecizēti depresīvie traucējumi (DD-NOS).

8. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētie ar vielas atkarību saistītie traucējumi ir izvēlēti no atkarības traucējumu rindas, kurus izraisa psihostimulanti.

9. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētie šizofrēnijas traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: paranoīdā šizofrēnija, dezorganizētā šizofrēnija, katatoniskā šizofrēnija, vienkāršā šizofrēnija, reziduālā šizofrēnija un neprecizēta šizofrēnija.

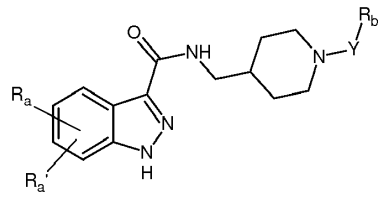
10. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais vēzis ir izvēlēts no šādas rindas: prostatas, aizkuņģa dziedzera, olnīcu un taisnās zarnas vēzis un ar MLL saistīta leukēmija.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vismaz vienu savienojumu ar formulu (I), kā definēts 1. pretenzijā, efektīvu daudzumu, tā sāļi ar farmaceitiski pieņemamu organisku vai neorganisku skābi vai bāzi, vai tā estera priekštečvielu, un vismaz vienu inerti farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, izmantošanai patoloģiska stāvokļa ārstēšanā, kuru izraisījusi nekontrolēta GSK-3 β aktivācija un/vai pārmērīga ekspresija, turklāt patoloģiskais stāvoklis ir izvēlēts no

šādas rindas: (i) insulīna rezistences izraisīti traucējumi, piemēram, 2. tipa diabēts, X sindroms, aptaukošanās un policistisko olnīcu sindroms; (ii) neiroleģeneratīvas slimības, piemēram, Pārkinsona slimība, Alzheimerā slimība, Hantingtona slimība, un mugurkaula neiroleģeneratīvie traucējumi; (iii) garastāvokļa traucējumi, piemēram, bipolārie traucējumi un depresīvie traucējumi; (iv) šizotipiski traucējumi; (v) vēzis, piemēram, prostatas, aizkuņģa dziedzera, olnīcu un taisnās zarnas vēzis un ar MLL saistīta leukēmija; (vi) iekaisums, (vii) ar vielas atkarību saistīti traucējumi; un (viii) epilepsija.

12. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi ar formulu:
- N-{{1-(2,4-dihlorbenzil)piperidin-4-il}metil}-5-metoksi-1H-indazol-3-karboksamīds un
- N-{{1-[4-(benziloksi)benzil]piperidin-4-il}metil}-5-metoksi-1H-indazol-3-karboksamīds.

- (51) **C07D 401/12**^(2006.01) (11) **2817302**
C07D 401/14^(2006.01)
A61K 31/454^(2006.01)
A61K 31/4545^(2006.01)
A61P 3/00^(2006.01)
A61P 25/00^(2006.01)
A61P 29/00^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)
C07D 405/14^(2006.01)
C07D 413/14^(2006.01)
- (21) 13704910.2 (22) 07.02.2013
(43) 31.12.2014
(45) 30.12.2015
(31) 12156292 (32) 21.02.2012 (33) EP
(86) PCT/EP2013/052400 07.02.2013
(87) WO2013/124158 29.08.2013
(73) Aziende Chimiche Riunite Angelini, Francesco A.C.R.A.F. S.p.A., Viale Amelia, 70, 00181 Roma, IT
(72) ALISI, Maria Alessandra, IT
CAZZOLLA, Nicola, IT
DRAGONE, Patrizia, IT
FURLOTTI, Guido, IT
MAUGERI, Caterina, IT
OMBRATO, Rosella, IT
MANCINI, Francesca, IT
(74) Allaix, Roberto, et al, Marchi & Partners Srl, Via Pirelli 19, 20124 Milano, IT
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
(54) **1H-INDAZOL-3-KARBOKSAMĪDA SAVIENOJUMI KĀ GLIKOGĒNA SINTĀZES KĪNĀZES 3 BETA INHIBITORI**
1H-INDAZOLE-3-CARBOXAMIDE COMPOUNDS AS GLYCOGEN SYNTHASE KINASE 3 BETA INHIBITORS
(57) 1. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi ar šādu vispārīgo formulu (I):



kur:

R_a un R_a' , kas ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra, ir ūdeņraža atoms; halogēna atoms; hidroksilgrupa; (C_1-C_6) alkilgrupa, (C_2-C_6) alkenilgrupa, (C_2-C_6) alkinilgrupa un (C_1-C_6) alkoksigrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, $-NH_2$ un (C_1-C_3) alkoksigrupa; karbociklisks vai heterociklisks gredzens, kas ir alifātisks vai aromātisks, kuram ir no 3 līdz 12 locekļiem, kas neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, (C_1-C_6) alkilgrupa, (C_1-C_6) alkoksigrupa, $-NR_1R_2$, $-C(O)OH$, $-C(O)OR_1$ un $-C(O)NR_1R_2$;
Y ir saite, (C_1-C_6) alkilgrupa, (C_2-C_6) alkenilgrupa vai (C_2-C_6) alkinilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa,

-NH₂ un (C₁-C₃)alkoksigrupa;

R_b ir (C₁-C₆)alkoksigrupa; -C(O)OH; -C(O)OR₁; NO₂; -NHC(O)OR₁;

R₁ un R₂ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₂-C₄)alkenilgrupa, (C₂-C₄)alkinilgrupa un fenilgrupa;

un to pievienotās skābes sāļi ar farmaceitiski pieņemamām organiskām vai neorganiskām skābēm un bāzēm.

2. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt R_a un R_a' , kas ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra, ir ūdeņraža atoms; halogēna atoms, kas izvēlēts no hlora, broma un joda atoma; hidroksilgrupa; (C₁-C₆)alkilgrupa un (C₁-C₆)alkoksigrupa, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, -NH₂ vai (C₁-C₃)alkoksigrupa; karbociklisks vai heterociklisks gredzens, kas ir piesātināts vai nepiesātināts, kuram ir no 4 līdz 10 locekļiem, kas neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, -NR₁R₂, -C(O)OH, -C(O)OR₁ un -C(O)NR₁R₂; un R₁ un R₂ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₂-C₄)alkenilgrupa, (C₂-C₄)alkinilgrupa un fenilgrupa.

3. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 2. pretenziju, turklāt R_a un R_a' , kas ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra, ir halogēna atoms, kas izvēlēts no hlora atoma vai broma atoma; hidroksilgrupa; (C₁-C₆)alkilgrupa; (C₁-C₆)alkoksigrupa; vai karbociklisks vai heterociklisks gredzens, kas ir piesātināts vai nepiesātināts, kam ir no 5 līdz 6 locekļiem, kas neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, -NR₁R₂ un -COOH; un R₁ un R₂ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₂-C₄)alkenilgrupa, (C₂-C₄)alkinilgrupa un fenilgrupa.

4. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt R_a un R_a' , kas ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra, ir broma atoms, hidroksilgrupa; (C₁-C₃)alkoksigrupa; vai nepiesātināts karbociklisks vai heterociklisks gredzens, kuram ir 6 locekļi, neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, (C₁-C₃)alkilgrupa, (C₁-C₃)alkoksigrupa, -NR₁R₂ un -COOH; un R₁ un R₂ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₂-C₄)alkenilgrupa, (C₂-C₄)alkinilgrupa un fenilgrupa.

5. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt Y ir saite, (C₁-C₆)alkilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri ir izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, -NH₂ un (C₁-C₃)alkoksigrupa.

6. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt Y ir (C₁-C₆)alkilgrupa.

7. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt Y ir (C₁-C₃)alkilgrupa.

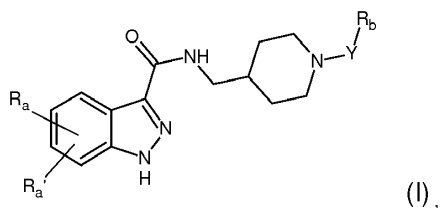
8. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt R_b ir (C₁-C₆)alkoksigrupa; -C(O)OH; -C(O)OR₁; -NHCOR₁.

9. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt R_b ir (C₁-C₆)alkoksigrupa; -C(O)OH.

10. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt R_b ir (C₁-C₃)alkoksigrupa, -C(O)OH.

11. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt R₁ un R₂ neatkarīgi viens no otra ir (C₁-C₃)alkilgrupa.

12. 1H-indazol-3-karboksamīda savienojumi ar šādu vispārīgo formulu (I):



kur:

R_a un R_a' , kas ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra, ir ūdeņraža atoms; halogēna atoms; hidroksilgrupa; (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₂-C₆)alkenilgrupa, (C₂-C₆)alkinilgrupa un (C₁-C₆)alkoksigrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri

ir izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, -NH₂ un (C₁-C₃)alkoksigrupa; karbociklisks vai heterociklisks gredzens, alifātisks vai aromātisks, kuram ir no 3 līdz 12 locekļiem, kas neobligāti ir aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, -NR₁R₂, -C(O)OH, -C(O)OR₁ un -C(O)NR₁R₂;

Y ir saite, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₂-C₆)alkenilgrupa vai (C₂-C₆)alkinilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no šādas rindas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, -NH₂ un (C₁-C₃)alkoksigrupa;

R_b ir (C₁-C₆)alkoksigrupa; -C(O)OH; -C(O)OR₁; -NO₂; -NHC(O)R₁;

R₁ un R₂ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₂-C₄)alkenilgrupa, (C₂-C₄)alkinilgrupa un fenilgrupa;

un to pievienotās skābes sāļi ar farmaceitiski pieņemamām organiskām vai neorganiskām skābēm un bāzēm;

izmantošanai slimības ārstēšanā, kuru izraisa nekontrolēta GSK-3β aktivācija un/vai pārmērīga ekspresija, turklāt slimība ir izvēlēta no šādas rindas: (i) insulīna rezistences izraisīti traucējumi; (ii) neirodeģeneratīvas slimības; (iii) garastāvokļa traucējumi; (iv) šizotipiski traucējumi; (v) vēzis; (vi) iekaisums; (vii) ar vielas atkarību saistīti traucējumi; (viii) epilepsija un (ix) neiroipātiskas sāpes.

13. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētie insulīna rezistences izraisītie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: 2. tipa diabēts, X sindroms, aptaukošanās un policistisko olnīcu sindroms.

14. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētās neirodeģeneratīvās slimības ir izvēlētas no šādas rindas: Pārkinsona slimība, Alcheimera slimība, Hantingtona slimība un muguras neirodeģeneratīvie traucējumi.

15. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt minētie muguras neirodeģeneratīvie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: amiotrofiskā laterālā skleroze, multiplā skleroze, muguras muskuļu atrofija un neirodeģenerācija, kas saistīta ar muguras smadzeņu bojājumu.

16. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētie garastāvokļa traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: bipolārie traucējumi un depresīvie traucējumi.

17. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 16. pretenziju, turklāt minētie bipolārie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: bipolārie traucējumi I, bipolārie traucējumi II, ciklotīmija un neprecizēti bipolārie traucējumi (BD-NOS).

18. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 16. pretenziju, turklāt minētie depresīvie traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: smagi depresīvie traucējumi (MDD), atipiska depresija (AD), melanoliskā depresija, smaga psihotiska depresija (PMD), katatoniska depresija, pēcdzemību depresija (PPD), sezonāli afektīvi traucējumi (SAD), distīmija un neprecizēti depresīvie traucējumi (DD-NOS).

19. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētie ar vielas atkarību saistītie traucējumi ir izvēlēti no atkarības traucējumu rindas, kurus izraisa psihostimulanti.

20. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētie šizofrēnijas traucējumi ir izvēlēti no šādas rindas: paranoīdā šizofrēnija, dezorganizētā šizofrēnija, katatoniskā šizofrēnija, vienkāršā šizofrēnija, reziduālā šizofrēnija un neprecizēta šizofrēnija.

21. 1H-indazol-3-karboksamīda izmantošana saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētais vēzis ir izvēlēts no šādas rindas: prostatas, aizkuņģa dziedzera, olnīcu un taisnās zarnas vēzis un ar MLL saistīta leukēmija.

22. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur efektīvu daudzumu vismaz viena savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, tā sāls ar farmaceitiski pieņemamu organisku vai neorganisku skābi vai bāzi vai tā estera priekštečvielas, kā arī vismaz vienu inerti farmaceitiski pieņemamu palīgvielu.

(51) G03B 17/02^(2006.01)

G03B 17/08^(2006.01)

G03B 17/55^(2006.01)

G08G 1/017^(2006.01)

(21) 13174138.1

(43) 31.12.2014

(45) 11.05.2016

(11) 2818922

(22) 27.06.2013

- (73) VITRONIC Dr.-Ing. Stein Bildverarbeitungssysteme, GmbH, Hasengartenstrasse 14, 65189 Wiesbaden, DE
- (72) HOFFMANN, Burghard, DE
BOBAK, Reiner, DE
- (74) Müller, Thomas Michael, et al, Neumann Müller Oberwalleney & Partner, Patentanwälte, Overstolzenstrasse 2a, 50677 Köln, DE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **SATIKSĒSMES NOVĒROŠANAS IERĪCE**
TRAFFIC MONITORING DEVICE

(57) 1. Satiksmes novērošanas ierīce ar apvalku (1), kurā ir vairāki gareniskie profili (2, 3, 4, 5), kas novietoti paralēli augstuma asij (H) un sakārtoti pa perimetru, un aptver apvalka iekšpusi (18), kur vismaz vienam garenvirziena profilam (2, 3, 4, 5) ir ārējā siena (6), veidojot ārējo skaldni (8), un iekšējā siena (7), veidojot iekšējo skaldni (9), kas vērsta uz apvalka iekšpusi (18).

2. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka vismaz vienai garenvirziena profila (2, 3, 4, 5) iekšējās sienas (7) iekšējai skaldnei (9) ir līdzena virsma, kas vērsta pret apvalka iekšpusi (18).

3. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka vismaz viens garenvirziena profils (2, 3, 4, 5) ir veidots kā dobs profils.

4. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka garenvirziena profili (2, 3, 4, 5) ir presēti.

5. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka vismaz vienam garenvirziena profilam (2, 4, 5) ir vismaz viens dzesēšanas kanāls (13, 19, 20), pa kuru virzīt dzesēšanas līdzekli.

6. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka vismaz viens dzesēšanas kanāls (13, 19, 20) ir izveidots starp vismaz viena garenvirziena profila (2, 4, 5) iekšējo sienu (7) un ārējo sienu (6).

7. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka divi dzesēšanas kanāli (19, 20), kas ir cits no cita atdalīti ar starpsienu (21), ir izveidoti starp ārējo sienu (6) un iekšējo sienu (7).

8. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka starpsienu (21) ir veidojumi, īpaši spraišļi (22, 23), kas palielina virsmu un veicina siltuma apmaiņu starp abiem dzesēšanas kanāliem (19, 20).

9. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka starpsienu (21) ir izveidota kā atsevišķa sastāvdaļa un ir ievietota garenvirziena profilā (2, 4) starp ārējo sienu (6) un iekšējo sienu (7).

10. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka apvalks (1) ir aizsargāts no svešķermeņu, putekļu un/vai šķidrums iekļūšanas tajā.

11. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka garenvirziena profili (2, 3, 4, 5) ir atvienojami savienoti viens ar otru.

12. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka garenvirziena profilu (2, 3, 4, 5) ārējās skaldnes (8) kopā veido vienu apvalka (1) ārējo virsmu, kas ir slēgta pa perimetru, turklāt starp atsevišķu garenvirziena profilu (2, 3, 4, 5) ārējām skaldnēm (8) ir vienmērīga pāreja starp vienu un otru.

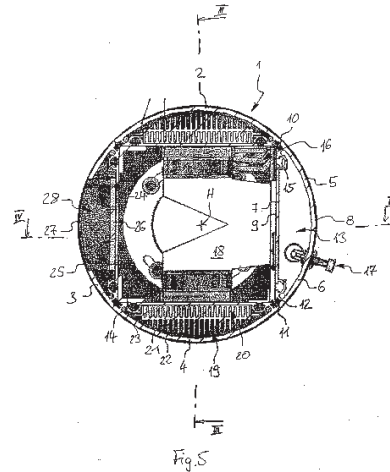
13. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka garenvirziena profiliem (2, 3, 4, 5) ir ārējās malas (10, 11), kas vērstas paralēli augstuma asij (H), un pret kurām balstās attiecīgie divi blakus esošie garenvirziena profili (2, 3, 4, 5), kur starp divu blakus esošu garenvirziena profilu (2, 3, 4, 5) garenvirziena malām (10, 11) ir novietotas blīves, lai izolētu apvalka iekšpusi (18) no ārpuses.

14. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka viens no garenvirziena profiliem (5) ir savienots ar eņģēm (16) ar blakus esošo garenvirziena profilu (2).

15. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka apvalks (1), ko veido garenvirziena profili (2, 3, 4, 5), ir nesošs.

16. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka satiksmes novērošanas elektroniskās ierīces ir izvietotas apvalka (1) iekšpusē (18).

17. Satiksmes novērošanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka vismaz viens garenvirziena profils (2, 3, 4, 5) ir aprīkots ar vismaz vienu atveri (24, 25) fotoaparātam, LIDAR-sistēmai vai sensoriem satiksmes novērošanai.



Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas

(Publikācijas saskaņā ar 2007. gada 15. februāra Patentu likuma 71. panta trešo un piekto daļu)

- (51) **B65B 31/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1935789**
B65D 81/20⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07021861.5 (22) 10.11.2007
 (43) 25.06.2008
 (45) 07.10.2009
 (45) 29.06.2016 (publikācija pēc iebilduma)
 (31) 102006061309 (32) 22.12.2006 (33) DE
 (73) Jörg von Seggern Maschinenbau GmbH, An der Kolckwiese 10, 26133 Oldenburg, DE
 (72) SEGGERN, Jörg von, DE
 (74) Jabbusch, Matthias et al, Jabbusch Siekmann & Wasiljeff Patentanwälte, Hauptstrasse 85, 26131 Oldenburg, DE
 Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **PAŅĒMIENS UN IERĪCE PRIEKŠMETU HERMĒTISKAI IEPAKOŠANAI**
METHOD AND APPARATUS FOR GAS-TIGHT PACKAGING OF ARTICLES

(57) 1. Paņēmiens priekšmetu (7) hermētiskai iepakojšanai ar priekšmetiem cieši pieguļošas aizsargplēves (4) palīdzību, izmantojot vakuumu, pie kam: priekšmeti tiek ievietoti apvalkā (6) un apvalka hermetizācijai tiek ietīti stingri nostiepjāmā plēvē; iepakojuma veidošanai tiek izmantota plēve ar vienu vai vairākām apliecamām apmalēm; stingri nostiepjāmā aizsargplēve (4) tiek nogriezta pēc apliecamās apmales izmēra un pēc tam stingri nostiepjāmā plēve hermētiski tiek uzklāta uz apliecamās apmales (20),

kas raksturīgs ar to, ka stingri nostiepjāmās aizsargplēves (4) uzklāšanas laikā vai pēc tās uzklāšanas papildu aizsargplēve (10) tiek nogriezta pēc apliecamās apmales (20) izmēra un pēc tam tā tiek uzklāta uz apliecamās apmales (20).

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka papildu aizsargplēve (10) tiek sametināta ar apliecamo apmali (20).

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka papildu aizsargplēve (10) tiek sametināta ar stingri nostiepjamo aizsargplēvi (4) apliecamās apmales (20) zonā.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka telpā starp stingri nostiepjamo aizsargplēvi (4) un papildu aizsargplēvi (10) tiek ievadīta aizsarggāze.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka par aizsarggāzi tiek izmantots skābeklis, slāpeklis vai ogļskābe gāze.

6. Paņēmiens saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka starptelpā un apkārtējā vidē ap papildu aizsargplēvi (10) pusē, kas vērsta prom no apvalka (6), var tikt radīts normāls spiediens.

7. Ierīce priekšmetu hermētiskai iepakojšanai ar priekšmetiem cieši pieguļošu aizsargplēvi, izmantojot vakuumu, paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai, kas vismaz vienam apvalkam satur vismaz vienu stingri nostiepjāmās aizsargplēves metināšanas aparātu un papildus satur vismaz vienu stingri nostiepjāmās aizsargplēves nogriešanas ierīci,

kas raksturīga ar to, ka minētā ierīce satur vismaz vēl otru papildu aizsargplēves (10) metināšanas aparātu, kā arī vismaz vēl otru papildu aizsargplēves (10) nogriešanas ierīci (3).

8. Ierīce saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka otrā nogriešanas ierīce (3) satur nažu asmeņus.

9. Ierīce saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka otrā nogriešanas ierīce (3) ir telpiski salāgota ar papildu aizsargplēves (10) metināšanas aparātu (2).

10. Ierīce saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka otrā nogriešanas ierīce (3) pagriež metināšanas aparātu (2).

11. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka apvalka (6) un/vai metināšanas ierīces (2) balstvirsmi ir regulējams augstums.

12. Ierīce saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka balstvirsmas satur vismaz vienu atbalsta līdzekli apvalka (6) apliecamajai apmalei (20).

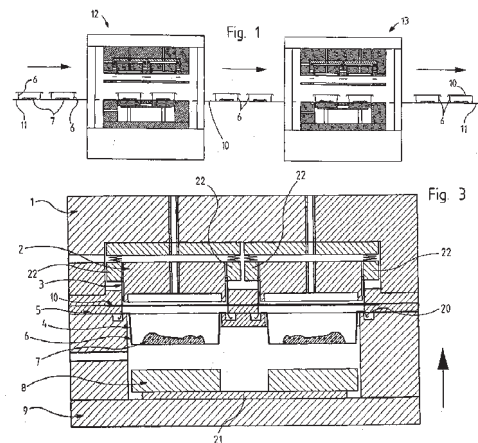
13. Ierīce saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka starp apvalku (6) un papildu aizsargplēvi (10) ir izvietota distancējošā plāksne (5), pie tam minētā distancējošā plāksne ir novietota uz apliecamās apmales (20) atbalsta līdzekļa, un apliecamā apmale (20) vismaz dažos sektoros paliek brīva.

14. Ierīce saskaņā ar 13. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka pārklājuma slāni ar tilpni (6) ir izveidota vismaz viena atvere (23).

15. Ierīce saskaņā ar 14. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka metināšanas aparātam (2) ir izmēri, kas atbilst atverei (23) distancējošā plāksnē (5).

16. Ierīce saskaņā ar 15. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka nogriešanas ierīce (3), kas ir saistīta ar metināšanas aparātu (2), var virzīties cieši garām distancējošās plāksnes (5) atveres (23) malai.

17. Ierīce saskaņā ar 16. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka nogriešanas ierīce (3) ir atdalīta no metināšanas aparāta (2) un ir uzmontēta elastīgi.



- (51) **A61K 31/573⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2049123**
A61K 9/28⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 19/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07801510.4 (22) 03.08.2007
 (43) 22.04.2009
 (45) 28.11.2012
 (45) 24.08.2016 (publikācija pēc iebilduma)
 (31) 835093 P (32) 03.08.2006 (33) US
 (86) PCT/EP2007/006894 03.08.2007
 (87) WO2008/015018 07.02.2008
 (73) Horizon Pharma AG, Kägenstrasse 17, 4153 Reinach, CH
 (72) SCHÄFFLER, Achim, DE
 (74) Marshall, Cameron John, et al, Carpmals & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB
 Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **REIMATOĪDO SASLIMŠANU ĀRSTĒŠANA AR GLIKOKORTIKOĪDU AR PROLONGĒTU IEDARBĪBU**
DELAYED-RELEASE GLUCOCORTICOID TREATMENT OF RHEUMATOID DISEASE

(57) 1. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai pacientu ārstēšanā, kas cieš no pazīmēm un simptomiem, kuru pamatā ir reimatiskas saslimšanas un/vai osteoartrīts, pie kam minētā ārstēšana tiek nozīmēta vienreiz dienā vakarā vismaz divas nedēļas.

2. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai pacientu ārstēšanā, kas cieš no rīta stīvuma un sāpēm, kuru pamatā ir reimatiskas saslimšanas un/vai osteoartrīts, pie kam minētā ārstēšana tiek nozīmēta vienreiz dienā vakarā vismaz divas nedēļas.

3. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam minētā ārstēšana tiek nozīmēta vienreiz dienā vakarā vismaz četras nedēļas, vismaz astoņas nedēļas vai vismaz divpadsmit nedēļas.

4. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām,

pie kam reimatiskā saslimšana ir reimatoīdais artrīts, ankilozējošais spondilīts un/vai reimatiskā polimialģija.

5. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētais pacients ir vai nav iepriekš ārstēts ar NSAID, DMARD, TNF α inhibitoru, pretsāpju līdzekli vai to kombināciju.

6. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam ārstēšana ietver arī efektīva daudzuma NSAID, DMARD, TNF α inhibitora, pretsāpju līdzekļa vai to kombinācijas nozīmēšanu minētajam pacientam.

7. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētā ārstēšana sastāv no efektīva daudzuma glikokortikoīda, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, nozīmēšanas minētajam pacientam, un minētā ārstēšana ir nozīmēta vienreiz dienā vakarā vismaz divas nedēļas.

8. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam prolongētas iedarbības dozas formai aiztures laiks pēc ievadīšanas ir no 2 stundām līdz 6 stundām, labāk no 3 stundām līdz 5 stundām.

9. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam prolongētas iedarbības dozas forma ir tablete.

10. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam glikokortikoīds ir kortizons, hidrokortizons, prednizons, prednizolons, metilprednizolons, budezonīds, deksametazons, fludrokortizons, fluokortolons, kloprednols, deflazakorts, triamcinolons, labāk prednizons, un to atbilstošie sāļi un esteri.

11. Glikokortikoīds, kas ietverts prolongētas iedarbības dozas formā, lietošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētā prolongētas iedarbības zāļu doza ir efektīva pie mazākas glikokortikoīda devas salīdzinājumā ar minētā glikokortikoīda ievadīšanu ar ātras iedarbības devas formu.

Pieteikumi papildu aizsardzības sertifikātiem

(Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 469/2009 (06.05.2009) par papildu aizsardzības sertifikātu zālēm 9. pants; un Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 1610/96 (23.06.1996) par papildu aizsardzības sertifikāta ieviešanu attiecībā uz augu aizsardzības līdzekļiem 9. pants). Pieteikuma numurā „z” nozīmē zāles, bet „a” – augu aizsardzības līdzekli.

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2016/0025/z | (22) 28.07.2016 |
| (54) S-triazolil-alfa-merkaptacetanilīdi kā HIV reversās transkriptāzes inhibitori | |
| (71) ARDEA BIOSCIENCES, INC., 4939 Directors Place San Diego, CA 92121, US | |
| (74) Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV | |
| (92) EU/1/15/1080, | 22.02.2016 |
| (93) EU/1/15/1080, | 22.02.2016 |
| (95) lesinurads (ZURAMPIC) | |
| (96) 09170772.9, | 25.08.2005 |
| (97) EP2135608, | 12.10.2011 |

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2016/0026/a | (22) 09.08.2016 |
| (54) Uzglabāšanas laikā stabili herbicīdu maisījumi ar metazahloru | |
| (71) BASF SE, 67056 Ludwigshafen, DE | |
| (74) Baiba KRAVALE, Patentu birojs ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV | |
| (92) LV 0523, | 11.02.2016 |
| (93) LT A1-480, | 01.07.2015 |
| (95) Metazahlora, dimetēnamīda-P un klomazona kombinācija (NIMBUS GOLD) | |
| (96) 04763249.2, | 15.07.2004 |
| (97) EP1656021, | 24.04.2013 |

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2016/0027/z | (22) 17.08.2016 |
| (54) Antivielas pret IL-17 | |
| (71) ELI LILLY AND COMPANY, Indianapolis, IN 46285, US | |
| (74) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV | |
| (92) EU/1/15/1085, | 28.04.2016 |
| (93) EU/1/15/1085, | 28.04.2016 |
| (95) Iksekizumabs (TALTZ) | |
| (96) 06846464.3, | 05.12.2006 |
| (97) EP1963368, | 18.07.2012 |

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2016/0028/z | (22) 22.08.2016 |
| (54) Antigēnu saistoši proteīni pie proproteīnu konvertāzes subtilizīna keksīna veida 9 (PCSK9) | |
| (71) AMGEN INC., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320-1799, US | |
| (74) Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV | |
| (92) EU/1/15/1031, | 25.09.2015 |
| (93) EU/1/15/1031, | 25.09.2015 |
| (95) Alirokumabs (PRALUENT) | |
| (96) 08798550.3, | 22.08.2008 |
| (97) EP2215124, | 24.02.2016 |

Papildu aizsardzības sertifikāti

(Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 469/2009 (06.05.2009) par papildu aizsardzības sertifikātu zālēm 11. panta pirmā daļa; un Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 1610/96 (23.06.1996) par papildu aizsardzības sertifikāta ieviešanu attiecībā uz augu aizsardzības līdzekļiem 11. pants). Sertifikāta numurā „z” nozīmē zāles, bet „a” – augu aizsardzības līdzekli.

- | | |
|--|------------------------|
| (21) C/LV2015/0044/z | (22) 15.12.2015 |
| (54) Vietējai lietošanai paredzēta ivemektīna kompozīcija dermatoloģisku saslimšanu ārstēšanai | |
| (73) GALDERMA S.A., Zugerstrasse 8, 6330 Cham, CH | |
| (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV | |
| (92) LV 15-0136, | 13.07.2015 |
| (93) MA117/01101, | 02.04.2015 |
| (94) 22.04.2029 | |
| (95) Ivermektīns (SOOLANTRA) | |
| (96) 04728811.3, | 22.04.2004 |
| (97) EP1620113, | 13.07.2011 |

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2015/0045/z | (22) 16.12.2015 |
| (54) Cilvēka monoklonālas antivielas, lai programmētu nāves-1 (PD-1), un paņēmieni vēža ārstēšanai, izmantojot vienīgi anti-PD-1 antivielas vai kombinācijā ar citiem imūnterapeitiskiem līdzekļiem | |
| (73) ONO PHARMACEUTICAL CO., Ltd., 1-5, Doshomachi 2-chome Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-8526, JP | |
| (74) E.R. SQUIBB & SONS, L.L.C., Route 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 8540, US | |
| (74) Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV | |
| (92) EU/1/15/1014, | 24.06.2015 |
| (93) EU/1/15/1014, | 24.06.2015 |
| (94) 24.06.2030 | |
| (95) Nivolumabs (OPDIVO) | |
| (96) 09013687.0, | 02.05.2006 |
| (97) EP2161336, | 31.07.2013 |

Pieteicēju, izgudrotāju un īpašnieku alfabētiskais rādītājs

(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase	(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase	(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase
Izgdrojumu pieteikumu publikācijas			S			Izgdrojumu patentu publikācijas		
			SALENIECE, Kristīne	P-15-24	C12P19/34	B		
B			Ž			BEZRUKOVŠ, Valērijs	P-15-10	F24J2/04
BĒRZIŅŠ, Andrejs	P-15-24	C12P19/34	ŽALUBOVSKIS, Raivis	P-15-37	C07D487/08	-	-	G05D23/00
BLUMBERGA, Dagnija	P-15-38	C02F11/04	-	-	A61K31/529	BEZRUKOVŠ, Vladislavs	P-15-10	F24J2/04
BYCHKOV, Evgeny	P-16-60	F03B1/00				-	-	G05D23/00
-	-	F03B3/00						
D						F		
DOMRAČEVA, Ilona	P-15-37	C07D487/08				FIZIKĀLĀS		
-	-	A61K31/529				ENERĢĒTIKAS		
E						INSTITŪTS	P-15-10	F24J2/04
ENTINS, Vītālijs	P-16-60	F03B1/00				-	-	G05D23/00
-	-	F03B3/00				G		
F						GALIŅŠ, Lauris	P-15-27	B27M3/00
FELDMANE, Guna	P-15-24	C12P19/34				-	-	E04C3/42
FELDMANIS, Roberts	P-15-24	C12P19/34				I		
I						IVANOV, Vyacheslav	P-15-26	H03B9/10
IVANOV, Vyacheslav	P-15-31	B01D1/06				IVANOVŠ, Semjons	P-16-11	F24J2/06
-	-	H05B6/64				J		
-	-	C01B31/36				JANSONŠ, Jānis	P-15-27	B27M3/00
J						-	-	E04C3/42
JAUDZEMS, Kristaps	P-15-37	C07D487/08				JASINSKAS, Algirdas	P-16-11	F24J2/06
-	-	A61K31/529				K		
K						KANCEVIČA, Liene	P-16-11	F24J2/06
KAIRIS, Ivo	P-16-53	A24B15/16				KRAVTSOVŠ, Anatoly	P-15-08	C30B15/02
-	-	A24B15/26				-	-	C30B15/20
KALNAČŠ, Ansis	P-16-60	F03B1/00				-	-	B01J19/08
-	-	F03B3/00				L		
KALNAČŠ, Jānis	P-16-60	F03B1/00				LATVIJAS		
-	-	F03B3/00				LAUKSAIMNIECĪBAS		
KOLEŠŅIKOVŠ, Andris	P-15-24	C12P19/34				UNIVERSITĀTE	P-16-11	F24J2/06
L						LIBAVA SERVISS, SIA	P-15-26	H03B9/10
LATVIJAS						P		
ORGANISKĀS						PELĒCE, Ilze	P-16-11	F24J2/06
SINTĒZES INSTITŪTS	P-15-37	C07D487/08				PIEKALNĪTIS, Ivars	P-15-27	B27M3/00
-	-	A61K31/529				-	-	E04C3/42
LAUKA						POPOVŠ, Aleksandrs	P-15-26	H03B9/10
(ex. EIHALDE), Dace	P-15-38	C02F11/04				PUTĀNS, Henriks	P-16-11	F24J2/06
LIBAVA SERVISS, SIA	P-15-31	B01D1/06				R		
-	-	H05B6/64				RĪŽIKOVŠ, Sergejs	P-15-26	H03B9/10
-	-	C01B31/36				S		
M						SŅEGIRJOVŠ, Andrejs	P-15-10	F24J2/04
MUIŽNIECE, Indra	P-15-38	C02F11/04				-	-	G05D23/00
N						Š		
NOVIKOVA, Ariadna	P-16-60	F03B1/00				ŠĪPKOVŠ, Jānis	P-15-10	F24J2/04
-	-	F03B3/00				-	-	G05D23/00
NOVIKOVŠ, Aleksandrs	P-16-60	F03B1/00				ŠĪPKOVŠ, Pēteris	P-15-10	F24J2/04
-	-	F03B3/00				-	-	G05D23/00
P						Z		
PELŠŠ, Jānis	P-15-37	C07D487/08				ZIEMELIS, Imants	P-16-11	F24J2/06
-	-	A61K31/529						
POPOVŠ, Aleksandrs	P-15-31	B01D1/06						
-	-	H05B6/64						
-	-	C01B31/36						
R								
RĪŽIKOVŠ, Sergejs	P-15-31	B01D1/06						
-	-	H05B6/64						
-	-	C01B31/36						
RĪGAS TEHNISKĀ								
UNIVERSITĀTE	P-15-38	C02F11/04						

Izgdrojumu pieteikumu un patentu numuru rādītājs

(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase	(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase
Izgdrojumu pieteikumu publikācijas			Izgdrojumu patentu publikācijas		
P-15-24	15162	C12P19/34	P-15-08	15148	C30B15/02
P-15-31	15159	B01D1/06	-		C30B15/20
-		H05B6/64	-		B01J19/08
-		C01B31/36	P-15-10	15149	F24J2/04
P-15-37	15161	C07D487/08	-		G05D23/00
-		A61K31/529	P-15-26	15157	H03B9/10
P-15-38	15160	C02F11/04	P-15-27	15154	B27M3/00
P-16-53	15158	A24B15/16	-		E04C3/42
-		A24B15/26	P-16-11	15142	F24J2/06
P-16-60	15163	F03B1/00			
-		F03B3/00			

Reģistrētās preču zīmes

Publikācijas par reģistrētajām preču zīmēm sakārtotas to reģistrācijas numuru secībā. Katra publikācija satur visus datus, kas reģistrācijas brīdī iekļauti Preču zīmju reģistra ziņās.

Preču zīmes reģistrācija ir spēkā 10 gadus, skaitot no pieteikuma datuma, ja tā netiek pirms šā termiņa dzēsta pēc preču zīmes īpašnieka iniciatīvas, atzīta par spēkā neesošu vai atcelta (likums „Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm”, 21. panta pirmā daļa). Ar dienu, kad publicēts paziņojums par preču zīmes reģistrāciju (datums, kas norādīts katras lappuses lappuses augšmalā), pilnā apjomā stājas spēkā izņēmuma tiesības uz reģistrēto zīmi, ieskaitot izņēmuma tiesības attiecībā pret citām personām (šā likuma 4. panta divpadsmitā daļa).

Ar publikācijas dienu iestājas arī iebildumu periods. Ieinteresētās personas, samaksājot attiecīgu maksu, triju mēnešu laikā no šīs dienas var iesniegt Patentu valdei iebilduma iesniegumu pret zīmes reģistrāciju, to pienācīgi argumentējot un pamatojot ar atsaucēm uz likuma noteikumiem saskaņā ar likuma „Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm” 18. pantu un Rūpnieciskā īpašuma institūciju un procedūru likuma 60., 61. un 62. pantu.

Starptautiski pieņemtie kodi (INID kodi), kas izmantoti preču zīmju datu identificēšanai:

- (111) Reģistrācijas numurs
Registration number
- (116) Reģistrācijas atjaunojuma numurs, ja tas atšķiras no sākotnējā reģistrācijas numura
Renewal number where different from initial registration number
- (141) Reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums
Date of the termination of the registration
- (151) Reģistrācijas datums
Registration date
- (210) Pieteikuma numurs
Application number
- (220) Pieteikuma datums
Filing date of the application
- (230) Izstādes prioritātes dati
Exhibition priority data
- (300) Konvencijas prioritātes dati:
pieteikuma numurs, pieteikuma datums, valsts kods
Convention priority data:
application number, filing date, code of country
- (350) Senioritātes dati (attiecībā uz Latviju):
reģistrācijas numurs, reģistrācijas datums
Seniority data (in relation to Latvia):
registration number, registration date
- (399) Ziņas par pārreģistrēto dokumentu, kas bija spēkā PSRS (pārreģistrētajām zīmēm)
Data relating to the registration previously in force in SU (for re-registered marks)
- (511) Preču un pakalpojumu starptautiskās klasifikācijas (Nicas klasifikācijas) indeksi; preču un/vai pakalpojumu saraksts
Indication of the International Classification of Goods and Services (Nice Classification); list of goods and/or services
- (526) Zīmes elementi, kas izslēgti no aizsardzības (disklamācija)
Elements excluded from protection (disclaimer)
- (531) Zīmju figurālo elementu starptautiskās klasifikācijas (Vīnes klasifikācijas – CFE) indeksi
Indication of the International Classification of the Figurative Elements of Marks (Vienna Classification – CFE)
- (540) Zīmes attēls
Reproduction of the mark
- (551) Norāde, ka šī zīme ir kolektīvā preču zīme
Indication that the mark is a collective mark
- (554) Telpiska zīme
Three-dimensional mark
- (555) Hologrāfiska zīme
Hologram mark
- (556) Skaņu zīme, tās raksturojums
Sound mark, including characteristics
- (571) Zīmes apraksts
Description of mark

- (580) Reģistrācijas grozījumu ieraksta datums (īpašumtiesību pāreja, grozījumi vārdos, nosaukumos vai adresēs, reģistrācijas darbības pārtraukšana u.tml.)
Date of recording of a transaction in respect of the registration (change in ownership, change in name or address, termination of protection, etc.)
- (591) Norāde par zīmes aizsardzību krāsās
Indication concerning colours claimed
- (600) Juridiski saistītu pieteikumu dati, piemēram, dati par bij. PSRS pieteikumu, uz kuru saskaņā ar LR Ministru Padomes 1992. gada 28. februāra lēmumu Nr. 72 pamatots Latvijas pieteikums, vai Eiropas Savienības preču zīmes pieteikumu
References to legally related applications, e.g., data of the SU application, on which LV application is based according to the provisions of the Decision of the Council of Ministers of the Republic of Latvia No. 72, adopted on February 28, 1992, or a European Union Trade Mark application
- (641) Sākotnējā pieteikuma dati (sadalīta pieteikuma gadījumā)
Initial application data (in case of divided application)
- (646) Sākotnējās reģistrācijas dati (sadalītas reģistrācijas gadījumā)
Initial registration data (in case of divided registration)
- (732) Zīmes īpašnieks, adrese, valsts kods
Name and address of the owner of the mark, code of country
- (740) Patentpilnvarnieks vai cits pārstāvis, adrese
Patent attorney or other representative, address
- (791) Licenciāts, adrese, valsts kods
Name and address of the licensee, code of country
- (881) Nacionālās reģistrācijas, kas aizstāta ar starptautisko reģistrāciju, numurs un datums
Number and date of the national registration replaced by an international registration
- (885) Starptautiskās reģistrācijas, kas pārveidota par nacionālo reģistrāciju, numurs un datums
Number and date of the international registration transformed into a national registration

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 287
- (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
- (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1147
- (220) **Pieteik.dat.** 26.08.2015

SIVO

- (732) **Īpašn.** HINDUSTAN PENCILS PRIVATE LIMITED; 510 Himalaya House, 79 Palton Road, Mumbai, 400001, IN
- (740) **Pārstāvis** Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra "INTELS LATVIJA"; Akadēmijas laukums 1, Rīga, LV-1050, LV
- (511) **16** kancelejas preces, kas ietvertas šajā klasē, arī matemātikas nolūkiem; dzēšamgumijas; taisnstūra lineāli, arī zīmēšanas un rasēšanas nolūkiem; zīmuļi, to skaitā mehāniskie zīmuļi, krāsu zīmuļi, ķīmiskie zīmuļi

kopēšanai un zīmuļi pārbaudes darbu veikšanai; ūdenī šķīstošas zīmuļkrāsas; zīmuļu asināmie; mehānisko zīmuļu serdeni; vaska krītiņi; eļļas pastelkrītiņi; permanentie marķieri; teksta marķieri; marķieri baltajām tāfelēm; stikla marķieri; rakstāmkrišs; lodīšu pildspalvas; gela pildspalvas; lodīšu pildspalvu un gela pildspalvu kasetnes; piederumu komplekti matemātikas nolūkiem, tostarp komplekti ar cirkuļiem zīmēšanas un rasēšanas nolūkiem; rasēšanas piederumi, to skaitā mērcirkuļi, transportieri, stūreņi un trīsstūri

(111) **Reģ. Nr.** M 70 288 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1108 (220) **Pieteik.dat.** 24.08.2015

Storvision

- (732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
- (511) **9** datori; datoru programmatūra; ar datoriem saistītās ierīces, kas ietvertas šajā klasē; elektroniskās datu apstrādes iekārtas; datortīklu aparatūra; visu iepriekšminēto preču daļas un piederumi
- 45** juridiskie pakalpojumi; drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai; privātie un sabiedriskie pakalpojumi personu individuālo vajadzību apmierināšanai, proti, konsultāciju pakalpojumi uzņēmumiem un privātpersonām imigrācijas jomā

(111) **Reģ. Nr.** M 70 289 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1206 (220) **Pieteik.dat.** 09.09.2015
(531) **CFE ind.** 26.4.4; 26.4.5; 26.4.22; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** zaļš, dzeltenīgi zaļš, balts
- (732) **Īpašn.** Zemgus LIEPA; Lāčplēša iela 27-3, Rīga, LV-1011, LV
- (511) **6** parastie metāli un to sakausējumi; būvmateriāli no metāla; pārvietojamas metāla būves; sliežu ceļu materiāli no metāla; metāla troses un stieples (ne elektriskiem nolūkiem); būvapakalumi, atslēdznieku izstrādājumi; metāla caurules; seifi; izstrādājumi no parastiem metāliem, proti, durvis, vārti, logi un logu aizsegi no metāla; alumīnija durvis un logi; rūdas nemetāliski būvmateriāli; nemetāliskas cietas caurules celtniecības vajadzībām; asfalts, darva un bitums; pārvietojamas nemetāliskas būves; ēku norobežojošās konstrukcijas; stiklotas fasādes; polivinilhlorīda (PVC) durvis un logi; pieminekļi (izņemot metāla)
- 35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
- 36** apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas
- 37** būvniecība; remonts un labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi, proti, stikloto būvkonstrukciju uzstādīšana un remonts, durvju un logu uzstādīšana, iestiklošana un remonts, stiklu, logu un žalūziju uzstādīšana un remonts
- 39** transporta pakalpojumi; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 290 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1227 (220) **Pieteik.dat.** 14.09.2015

KATRS PIESKĀRIENS IR SOLIS UZ PRIEKŠU

- (732) **Īpašn.** JOHNSON & JOHNSON; One Johnson & Johnson Plaza, New Brunswick, NJ 08933-7001, US
- (740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
- (511) **5** testa strēmeles glikozes līmeņa mērīšanai un kontrolei asinīs; diagnostiskie reaģenti (kontrolšķīdumi), kas paredzēti glikozes līmeņa kontrolei asinīs un insulīna ievadīšanas ierīcēm
- 9** programmatūra ierīcēm glikozes līmeņa mērīšanai un kontrolei asinīs, insulīna infūzijas sūkņiem ar plāksteri
- 10** ierīces glikozes līmeņa mērīšanai un kontrolei asinīs, to daļas un piederumi; lancetes, skarifikācijas ierīces un citas ierīces pirkstu pārdušanai, kuras lieto asins paraugu ņemšanai un izmantošanai ierīcēs, kas kontrolē glikozes līmeni asinīs vai citiem medicīniskiem nolūkiem; insulīna ievadīšanas ierīces, proti, insulīna infūzijas sūkņi ar plāksteri, katetri, pildspalvveida adatas, šļirces, adatu ievadītāji un pārnēsājamā aparatūra, kas kontrolē medikamentu ievadīšanu caur ādu, plāksteri insulīna ievades ierīcēm, kas tiek pārdoti bez receptes; medicīnas ierīces, proti, ierīces, kas kontrolē medikamentu ievadi, izmantojot brīdinājumus un atgādinājumus; medicīnas ierīces medikamentu ievadīšanai caur ādu; medicīnas ierīču daļas, proti, kanulas, kuras pārdod atsevišķi vai kopā ar medicīnas aparāturu, kas paredzēta medikamentu ievadei caur ādu
- 16** publikācijas, reklāmas materiāli, lietošanas instrukcijas un informatīvas brošūras par glikozes līmeņa kontroli asinīs, insulīna ievadīšanas ierīcēm un diabētu
- 41** izglītojoši pakalpojumi saistībā ar ierīcēm glikozes līmeņa mērīšanai un kontrolei asinīs, insulīna ievadīšanas ierīcēm un diabētu; informācijas sniegšana par ierīcēm glikozes līmeņa mērīšanai un kontrolei asinīs, insulīna ievadīšanas ierīcēm un diabētu

(111) **Reģ. Nr.** M 70 291 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1299 (220) **Pieteik.dat.** 17.03.2016

Pharma Liq

- (732) **Īpašn.** ALP-LIQ SA; Rue du Lac 36, Clarens, 1815, CH
- (740) **Pārstāvis** Ilmārs ŠATOVŠ; Dagdas iela 3-10, Rīga, LV-1003, LV
- (511) **5** elektronisko cigarešu, cigarillu, cigāru un pīpju uzpildīšanas šķīdumi bez tabakas medicīniskiem nolūkiem; elektronisko cigarešu, cigarillu, cigāru un pīpju bez tabakas medicīniskiem nolūkiem kasetnes, ampulas, rezervuāri, kārtidži un filtri; elektronisko cigarešu bez tabakas smēķēšanas piederumi medicīniskiem nolūkiem
- 9** baterijas (strāvas avoti); elektriskie akumulatori un adapteri elektroniskajām cigaretēm, cigāriem, cigarillām un pīpēm

(111) **Reģ. Nr.** M 70 292 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1354 (220) **Pieteik.dat.** 04.04.2016
(531) **CFE ind.** 11.7.4; 29.1.14



Одежда
ДЛЯ ВСЕЙ СЕМЬИ

Торговля
НА ВЕС

Каждый день
СНИЖЕНИЕ ЦЕНЫ

Каждую неделю
ОБНОВЛЕНИЕ ТОВАРА

- (526) **Disklamācija** zīme tiek aizsargāta kopumā; vārdiskie apzīmējumi atsevišķi netiek aizsargāti
- (591) **Krāsu salikums** sarkans, violets, zaļš, balts
- (732) **Īpašn.** ECONOM CLASS, SIA; Elizabetes iela 22-4, Rīga, LV-1050, LV
- (511) **35** apģērbu tirdzniecības, arī mazumtirdzniecības, pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 293 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1595 (220) **Pieteik.dat.** 03.11.2015
(531) **CFE ind.** 24.9.7; 29.1.13



SALDUMU IMPĒRIJA

- (591) **Krāsu salikums** oranžs, melns, balts
- (732) **Īpašn.** AMILI, SIA; Mirdzas Ķempes iela 7-40, Rīga, LV-1014, LV
- (511) **30** kafija, tēja, kakao; milti; konditorejas izstrādājumi; cepumi; šokolāde; saldējums; cukurs, medus

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 294 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1602 (220) **Pieteik.dat.** 14.12.2015
(531) **CFE ind.** 25.1.19; 29.1.15; 4.5.5; 5.7.2; 8.7.8



- (591) **Krāsu salikums** jūraszaļš, sarkans, zaļš, dzeltens, violets, zils, brūns, balts, pelēks, melns
- (732) **Īpašn.** MILZU!, SIA; "Miķeļi", Rumbas pag., Kuldīgas nov., LV-3301, LV
- (740) **Pārstāvis** Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra "KDK"; Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV
- (511) **30** brokastu pārslas no graudaugiem; musli, kas sastāv galvenokārt no graudaugiem; minētās preces vai to izejvielas ir bioloģiskās lauksaimniecības produkti

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 295 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1633 (220) **Pieteik.dat.** 16.11.2015

Smarteo

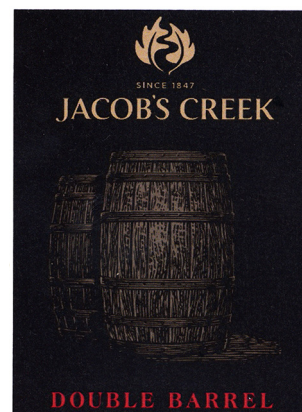
- (732) **Īpašn.** X INFOTECH, SIA; Daugavas iela 38-3, Mārupe, Mārupes nov., LV-2167, LV
- (511) **9** daudzmoduļu programmatūras platformas identifikācijas dokumentu un bankas karšu izdošanai

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 296 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1675 (220) **Pieteik.dat.** 26.11.2015
(531) **CFE ind.** 11.1.5; 26.1.2; 26.1.3; 26.1.16; 27.3.15; 9.7.19



- (732) **Īpašn.** Sigita BIANKI; Jaunatnes iela 1-11, Sigulda, Siguldas nov., LV-2150, LV
- (511) **43** apgāde ar uzturu

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 297 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1707 (220) **Pieteik.dat.** 02.12.2015
(531) **CFE ind.** 19.1.1; 19.1.6; 19.1.7; 25.1.15; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** smilškrāsa, sarkans, melns
- (732) **Īpašn.** PERIOD RICARD WINEMAKERS PTY LTD; Level 3, 167 Fullarton Road, Dulwich, South Australia, 5065, AU
- (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
- (511) **33** vīns un vīna dzērieni

(111) **Reģ. Nr.** M 70 298 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1789 (220) **Pieteik.dat.** 22.12.2015

Sajūti sevī spēku

- (732) **Īpašn.** JOHNSON & JOHNSON; One Johnson & Johnson Plaza, New Brunswick, NJ 08933, US
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **3** mutes skalošanas līdzekļi, ne medicīniskiem nolūkiem; šķīstošas plāksnītes mutes kopšanai, ne medicīniskiem nolūkiem; šķīstošas plāksnītes elpas atsvaidzināšanai, ne medicīniskiem nolūkiem; elpas atsvaidzināšanas līdzekļi, ne medicīniskiem nolūkiem
5 mutes skalošanas līdzekļi medicīniskiem nolūkiem
21 zobu diegi; rīki zobu tīrīšanai ar zobu diegu; nomaināmas galviņas zobu tīrīšanai ar zobu diegu paredzētiem rīkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 70 299 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-19 (220) **Pieteik.dat.** 07.01.2016

SAVA CARD

- (732) **Īpašn.** VIA SMS, SIA; 13. janvāra iela 3, Rīga, LV-1050, LV
 (511) **36** aizdevumu, kredītu un izpirkumnomas finansēšanas pakalpojumi; attālināto norēķinu pakalpojumi; finansējuma nodrošināšana; finansēšanas pakalpojumi; kredītēšanas pakalpojumi; finanšu investīciju pakalpojumi; finanšu pakalpojumi; finanšu plānošana un pārvaldība; finanšu risku pārvaldības konsultācijas; finanšu risku vadība; finanšu risku novērtēšanas pakalpojumi; finanšu starpniecības pakalpojumi; patēriņa kredīta pakalpojumi; naudas kontu finanšu pārvaldība; naudas pārvedumi un darījumi, maksājumu pakalpojumi; norēķinu kontu finanšu pārvaldība; norēķinu kontu nodrošināšana; banku pakalpojumi ar bankas kartēm; ar maksājumu kartēm veikto maksājumu apstrāde; atlaižu karšu pakalpojumi jaunatnei kultūras pasākumiem; atlaižu karšu pakalpojumi jaunatnei atpūtas pasākumiem; atlaižu karšu pakalpojumi jaunatnei ceļojumiem; automatizēti bankas pakalpojumi saistībā ar kredītkaršu darījumiem; automatizēti banku pakalpojumi saistībā ar maksājumu karšu darījumiem; bankas karšu, kredītkaršu, debetkaršu, elektronisko maksājumu karšu pakalpojumi; bankas norēķinu karšu pakalpojumi; debetkaršu validācijas pakalpojumi; debetkaršu maksājumu apstrāde; elektroniski darījumi ar kredītkartēm; elektronisko maksājumu karšu izdošana saistībā ar atlaižu un balvu programmām; finanšu informācijas pakalpojumi saistībā ar pazaudētām kredītkartēm; finanšu informācijas pakalpojumi saistībā ar nozagtām kredītkartēm; finanšu karšu apstrādes iekārtu iznomāšana un izīrēšana; finanšu pakalpojumi ar bankas kartēm; finanšu pakalpojumi kredītkaršu pārvaldības jomā; finanšu pakalpojumi saistībā ar kredītkartēm; finanšu pakalpojumi saistībā ar bankas karšu un debetkaršu izdošanu; finanšu pakalpojumi saistībā ar bankas kartēm; informācijas nodrošināšana saistībā ar kredītkaršu darījumiem; konsultāciju pakalpojumi saistībā ar kredītkartēm; kredītkaršu aizsardzības un reģistru pakalpojumi; kredītkaršu darījumu apstrādes pakalpojumi; kredītkaršu nodrošināšana; kredītkaršu pārvaldības pakalpojumi; kredītkaršu un debetkaršu izsniegšana; kredītkaršu un debetkaršu pakalpojumi; maksājumu karšu pakalpojumi; kredītkaršu vadības pakalpojumi; kredītkaršu validācijas pakalpojumi; kredītkaršu verificācija; maksājumu karšu pakalpojumu pārvaldība; maksājumu apstrāde saistībā ar maksājumu kartēm; naudas aizvietošana ar kredītkartēm; naudas līdzekļu pārskaitījumi, izmantojot elektroniskās kartes

(111) **Reģ. Nr.** M 70 300 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-24 (220) **Pieteik.dat.** 08.01.2016
 (531) **CFE ind.** 24.15.21; 24.17.4; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** violets, melns, balts
 (732) **Īpašn.** LATVIJAS TELEVĪZIJA, Valsts SIA; Zaķusalas krastmala 33, Rīga, LV-1050, LV
 (511) **35** reklāma ar Interneta starpniecību; komercinformācijas sniegšana ar Interneta starpniecību
38 telesakaru pakalpojumi; ziņu pārraide ar Interneta starpniecību; datu un attēlu pārraide ar datoru starpniecību
41 izklaides raidījumu veidošana
42 datorprogrammēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 301 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-53 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2016

AMCHAM LATVIA

- (732) **Īpašn.** AMERIKAS TIRDZNICĪBAS PALĀTA LATVIJĀ, Biedrība; Krišjāņa Barona iela 11-55, Rīga, LV-1050, LV
 (740) **Pārstāvis** Ingrida KARIŅA-BĒRZIŅA, Zvērinātu advokātu birojs "COBALT"; Krišjāņa Valdemāra iela 20, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **41** apmācība; izpriecās; kultūras pasākumu rīkošana; konferenču organizēšana un vadīšana; izglītojošu semināru rīkošana; elektroniskās publikācijas (izmērot lejupielādējamas publikācijas); izglītojošu, kultūras un izklaides pasākumu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 302 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-78 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016
 (531) **CFE ind.** 27.5.1

GIORDANO

- (732) **Īpašn.** WALTON INTERNATIONAL LTD.; P.O.Box 1589, George Town, Grand Cayman, KY1-1110, KY
 (740) **Pārstāvis** Inese LEIMANE, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **25** apģērbi, apavi, galvassegas; dūnu/spalvu apģērbi; ādas apģērbi; apakšbikses, to skaitā īsās apakšbikses; jakas, to skaitā vilnas jakas; džinsi; bikses; šorti; manšetes; krekli, to skaitā ikdienas krekli; ikdienas virsdrēbes; T-krekli, to skaitā T-krekli bez piedurknēm; apakškrekli; apakšveļa; apakšveļas izstrādājumi; blūzes; svārki; vestes, to skaitā uzvalku vestes; mēteļi; sporta krekli, to skaitā sporta krekli ar garām piedurknēm un bez piedurknēm; treniņtērpi; džemperī; kombinezoni; vingrošanas tērpi; kleitas, to skaitā garās kleitas; puloveri; svīteri; topi ar lencītēm; ūdenscaurlaidīgi apģērbi; trikotāžas izstrādājumi; leģingi (stilbikses); zeķbikses; krūšturi; pončo; kurpes; zābaki; čības; ap galvu sienamas saites; cepures; platmales; šalles; kaklasaites; zeķes, to skaitā garās zeķes; jostas; getras; cimdi, arī dūraiņi
35 reklāma; tiešā pasta reklāma; adresātu sarakstu vākšana; tādu pasūtījumu pieņemšana, kas veikti pa pastu, telefonu un izmantojot citu veidu sakaru un

telesakaru līdzekļus; uzņēmējdarbības konsultēšana un uzņēmējdarbības vadības pakalpojumi; preču demonstrēšana tirdzniecības veicināšanai; mārketinga un tā veicināšanas pakalpojumi; tirgus izpēte un analīze; importa-eksporta aģentūru pakalpojumi; uzņēmumu preču iepirkšana un iegāde; veikalu skatlogu noformēšana; mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi attiecībā uz šādām precēm: ādas un ādas imitācijas izstrādājumi, futrāji, somas, pludmales somas, rokassomas, mantu somas, jostas somas, maisiņi, ceļasomas, ceļojumu somas un koferi, apģērbu somas, nelieli koferi, portfeļi, to skaitā dokumentu portfeļi, plakanie dokumentu portfeļi un kabatas portfeļi, maki, atslēgu maki, bagāžas somas un čemodāni, naudasmaki, kabatas portfeļi, atslēgu piekariņi, lietussargi, saulesargi, spieķi, pastaigu spieķi, kredītkaršu maki, kredītkaršu ietvari, mugursomas, skolas mugursomas, plecu somas, skolas somas, skolēnu mugursomas, ietilpīgas mīkstās somas, sporta somas, grāmatu somas, cilindriskas ceļojumu somas, naudas pārnēsāšanas somas, plecu somas, plecu siksnas, atslēgu maciņi, čeku grāmatiņu futrāji un iepriekšminēto preču daļas un piederumi, apģērbi, apavi, galvassegas, modes aksesuāri, kas ietverti šajā klasē, jakas, to skaitā vilnas jakas, džinsi, bikses, apakšbikses, šorti, manšetes, krekli, to skaitā ikdienas krekli, ikdienas virsdrēbes, T-krekli, to skaitā T-krekli bez piedurknēm, apakškrekli, apakšveļa, blūzes, svārkī, vestes, uzvalku vestes, mēteļi, sporta krekli, to skaitā sporta krekli ar garām piedurknēm un bez piedurknēm, treniņtērpi, džemperī, kombinezoni, kleitas, puloveri, svīteri, topi ar lencītēm, apakšveļas izstrādājumi, ūdensnecaurīdīgi apģērbi, trikotāžas izstrādājumi, legingi (stilbbikses), zeķbikses, krūšturi, pončo, kurpes, zābaki, čības, ap galvu sienamas saites, cepures, platmales, šalles, kaklasaites, zeķes, to skaitā garās zeķes, jostas, getras, cimdi, arī dūraiņi; iepriekšminēto preču tirdzniecības pakalpojumi ar Interneta un globālo sakaru tīklu starpniecību

(111) **Reģ. Nr.** M 70 304
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-85

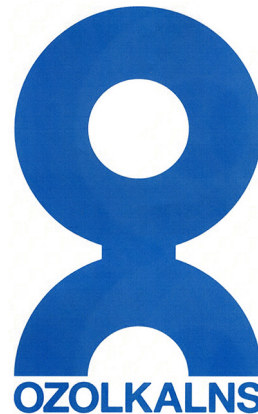
(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(220) **Pieteik.dat.** 21.01.2016

BLOOM atelier

- (732) **Īpašn.** FLORENS INTERNATIONAL, SIA; Krišjāņa Barona iela 52-6, Rīga, LV-1011, LV
(511) **35** mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību, attiecībā uz šādām precēm: ziedi, interjera priekšmeti, mīkstās rotaļlietas, parfimērijas izstrādājumi, kosmētikas līdzekļi, vāzes, rotaslietas, lietussargi, sveces, mājas dizaina priekšmeti, spilveni, gultasveļa, lakati, šalles, segas, apsveikuma kartītes, rakstāmpiederumi, trauki, galda piederumi, augļi, konservi, ievārījumi, šokolāde, konfektes, cepumi, bulciņas, siers, dāvanu grozi, tortes un kūkas

(111) **Reģ. Nr.** M 70 305
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-130
(531) **CFE ind.** 2.1.23; 29.1.11

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(220) **Pieteik.dat.** 04.02.2016



(111) **Reģ. Nr.** M 70 303
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-79
(531) **CFE ind.** 2.1.1; 2.1.4; 24.1.3; 24.1.8; 24.1.13; 29.1.14

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016



- (591) **Krāsu salikums** zils
(732) **Īpašn.** OZOLKALNS, Slēpošanas un atpūtas parks, SIA; Ģertrūdes iela 10-5, Rīga, LV-1010, LV
(511) **41** izpriecās; sporta un kultūras pasākumi; visu sezonu sporta un atpūtas pasākumu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 306
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-141
(531) **CFE ind.** 27.5.1

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(220) **Pieteik.dat.** 08.02.2016

Milla Nova
wedding fashion

- (591) **Krāsu salikums** sarkans, zeltains, balts, melns
(732) **Īpašn.** AS NŌO LIHATŌŌSTUS; Voika 18, Nōo alevik, Nōo vald, Tartu maakond, 61601, EE
(740) **Pārstāvis** Inese LEIMANE, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV
(511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki

- (732) **Īpašn.** Katerīna BUŠA; Pulkveža Brieža iela 7-520C, Rīga, LV-1010, LV
(511) **35** kāzu kleitu un aksesuāru tirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 70 307
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-159
(531) **CFE ind.** 19.7.12; 26.1.2; 26.1.3; 29.1.15; 5.7.13; 5.9.1; 5.9.14

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(220) **Pieteik.dat.** 09.02.2016



(554) **Telpiska zīme**

(591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, zaļš, gaiši zaļš, oranžs, dzeltens, balts

(732) **Īpašn.** CIDO GRUPA, SIA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV

(740) **Pārstāvis** Anete KUPČA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV

(511) **32** minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

(111) **Reģ. Nr.** M 70 308

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016

(210) **Pieteik. Nr.** M-16-179

(220) **Pieteik.dat.** 15.02.2016

(531) **CFE ind.** 1.15.15; 29.1.15; 7.5.15



(591) **Krāsu salikums** tumši brūns, brūns, tumši zils, zils, gaiši zils, zaļš, gaiši zaļš, balts

(732) **Īpašn.** CIDO GRUPA, SIA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV

(740) **Pārstāvis** Anete KUPČA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV

(511) **32** minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai; alus

(111) **Reģ. Nr.** M 70 309

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016

(210) **Pieteik. Nr.** M-16-168

(220) **Pieteik.dat.** 11.02.2016

(531) **CFE ind.** 27.5.4; 27.5.19; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts

(732) **Īpašn.** Alberts VAĢELIS; Stirnu iela 7-15, Rīga, LV-1035, LV

(740) **Pārstāvis** Baiba KRAVALE, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV

(511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi

38 telesakari; ziņojumu pārraide; radioraidīšana; radioaprāide, arī ar interneta un citu globālo sakaru tīklu starpniecību; elektroniskā datu un informācijas pārraide ar datortīklu, sakaru tīklu un interneta starpniecību; skaņas, attēlu un grafisko datu pārraide, izmantojot internetu; elektronisko plašsaziņas līdzekļu programmu apraide ar interneta starpniecību

41 audzināšana; apmācība; izpriecās; radioraidījumu un radioprogrammu veidošana; sporta un kultūras pasākumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 310

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016

(210) **Pieteik. Nr.** M-16-171

(220) **Pieteik.dat.** 12.02.2016

(531) **CFE ind.** 27.5.1

Cafetaine R

(732) **Īpašn.** BŪVALTS R, SIA; Skolas iela 9-13, Rīga, LV-1010, LV

(740) **Pārstāvis** Natālija CITCERE; Svīres iela 6-12, Rīga, LV-1076, LV

(511) **6** pārvietojamas metāla būves

43 kafejnīcu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 311

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016

(210) **Pieteik. Nr.** M-16-174

(220) **Pieteik.dat.** 12.02.2016

TRIOBET SPORTS BAR

(732) **Īpašn.** BML GROUP LIMITED; The Experience Centre, Ta' Xbiex Seafront, Ta' Xbiex, XBX 1027, MT

(740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(511) **41** audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi; nodrošināšana ar sporta ziņām un informāciju; sporta pasākumu organizēšana; publicēšanas pakalpojumi; tekstu, ilustrāciju, iespaidmateriālu publicēšana (izņemot reklāmas materiālu publicēšanu); neļūpīelādējamas elektroniskās jeb digitālās publikācijas; tekstu rediģēšanas pakalpojumi; reportieru pakalpojumi; tulkošanas pakalpojumi

43 apgāde ar pārtiku un dzērieniem; bāru pakalpojumi, kafejnīcu pakalpojumi, restorānu pakalpojumi; sanāksmju telpu noma

(111) **Reģ. Nr.** M 70 312

(151) **Reģ. dat.** 20.10.2016

(210) **Pieteik. Nr.** M-16-175

(220) **Pieteik.dat.** 12.02.2016

TRIOBET SPORTS

(732) **Īpašn.** BML GROUP LIMITED; The Experience Centre, Ta' Xbiex Seafront, Ta' Xbiex, XBX 1027, MT

(740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(511) **41** audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi; nodrošināšana ar sporta ziņām un informāciju; sporta pasākumu organizēšana; publicēšanas pakalpojumi; tekstu, ilustrāciju, iespaidmateriālu publicēšana (izņemot reklāmas materiālu publicēšanu); neļūpīelādējamas

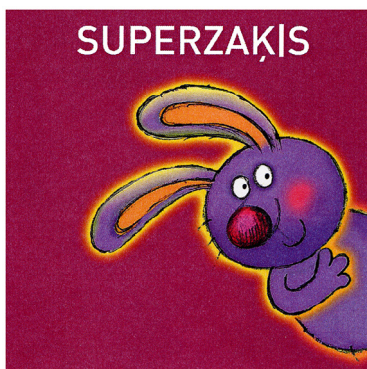
elektroniskās jeb digitālās publikācijas; tekstu rediģēšanas pakalpojumi; reportieru pakalpojumi; tulkošanas pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 313 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-187 (220) **Pieteik.dat.** 17.02.2016
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.1.15; 26.1.19; 29.1.13; 5.9.10



- (591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, gaiši zaļš, balts
 (732) **Īpašn.** DALANS, SIA; Krustpils iela 60, Rīga, LV-1063, LV
 (511) **31** lauksaimniecības, dārzkopības, mežkopības produkcija; neapstrādāti graudi un sēklas; svaigi augļi un dārzeņi; augi un ziedi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 314 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-219 (220) **Pieteik.dat.** 24.02.2016
 (531) **CFE ind.** 29.1.15; 3.5.1; 3.5.24



- (591) **Krāsu salikums** violets, rozā, dzeltens, oranžs, sarkans, melns, balts
 (732) **Īpašn.** VR PACKING, SIA; Rubeņu iela 96, Jūrmala, LV-2011, LV
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 315 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-739 (220) **Pieteik.dat.** 21.06.2016
 (531) **CFE ind.** 24.15.2; 24.15.13; 26.1.16; 26.1.18; 27.5.24; 29.1.14



- (526) **Disklamācija** aizsardzība neattiecas uz burtu 'B' īpašā izpildījumā, vārdiskajiem elementiem 'BTC', 'Bitcoin' un 'Exchange'
 (591) **Krāsu salikums** zils, pelēks, melns, balts

- (732) **Īpašn.** SOFT-FX HOLDINGS LTD; Saffrey Square, 2nd Floor, Suite 201B, Bank Lane, Nassau, P.O.Box FH-14587, BS
 (740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, "FORAL INTELEKTUĀLĀ ĪPAŠUMA AĢENTŪRA", SIA; Kalēju iela 14-7, Rīga, LV-1050, LV
 (511) **36** finanšu analīze; krājbanku pakalpojumi; kredītkaršu izsniegšana; vērtspapīru emisija; finanšu pakalpojumi, proti, darījumu vadīšana, tostarp fondu vadīšana, kas iegūti no vērtspapīriem, akcijām, fondiem, kapitāla daļām, obligācijām, skaidras naudas vai cita veida finanšu ieguldījumiem pensiju plānos, izmantojot kredītkartes vai debetkartes globālajā datortīklā; informācijas sniegšana par finanšu lietām; finanšu norēķinu pakalpojumi; finanšu konsultācijas; akciju kotēšana; starpniecības pakalpojumi investīciju jomā; finanšu pārvaldīšana; valūtas tirdzniecība un maiņa; banku tiešsaistes darījumi; starpniecības pakalpojumi vērtspapīru jomā; banku pakalpojumi; biržas mākleri starpniecības pakalpojumi; paju investīciju fondu un kapitāla investīciju fondu vadīšana; finansēšanas pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 316 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-740 (220) **Pieteik.dat.** 21.06.2016
 (531) **CFE ind.** 24.15.2; 24.15.13; 26.1.16; 26.1.18



- (526) **Disklamācija** aizsardzība neattiecas uz burtu 'B' īpašā izpildījumā
 (732) **Īpašn.** SOFT-FX HOLDINGS LTD; Saffrey Square, 2nd Floor, Suite 201B, Bank Lane, Nassau, P.O.Box FH-14587, BS
 (740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, "FORAL INTELEKTUĀLĀ ĪPAŠUMA AĢENTŪRA", SIA; Kalēju iela 14-7, Rīga, LV-1050, LV
 (511) **36** finanšu analīze; krājbanku pakalpojumi; kredītkaršu izsniegšana; vērtspapīru emisija; finanšu pakalpojumi, proti, darījumu vadīšana, tostarp fondu vadīšana, kas iegūti no vērtspapīriem, akcijām, fondiem, kapitāla daļām, obligācijām, skaidras naudas vai cita veida finanšu ieguldījumiem pensiju plānos, izmantojot kredītkartes vai debetkartes globālajā datortīklā; informācijas sniegšana par finanšu lietām; finanšu norēķinu pakalpojumi; finanšu konsultācijas; akciju kotēšana; starpniecības pakalpojumi investīciju jomā; finanšu pārvaldīšana; valūtas tirdzniecība un maiņa; banku tiešsaistes darījumi; starpniecības pakalpojumi vērtspapīru jomā; banku pakalpojumi; biržas mākleri starpniecības pakalpojumi; paju investīciju fondu un kapitāla investīciju fondu vadīšana; finansēšanas pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 317 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-782 (220) **Pieteik.dat.** 08.07.2016

URSOGRIX

- (732) **Īpašn.** GRINDEKS, AS; Krustpils iela 53, Rīga, LV-1057, LV
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; zāļu vielas medicīniskiem un veterināriem nolūkiem; medikamenti, arī recepšu medikamenti; uztura bagātinātāji; uztura bagātinātāji, kas paredzēti parasta uztura papildināšanai

un veselības veicināšanai; bioloģiski aktīvas piedevas medicīniskiem un/vai diētiskiem nolūkiem; dabīgu un/vai sintētisku ārstniecisko vielu kompleksi un preparāti medicīniskiem un veterināriem nolūkiem

30 pārtikas piedevas, pamatā no šajā klasē ietvertajiem produktiem, kas nav paredzētas medicīniskiem nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 70 318 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1703 (220) **Pieteik.dat.** 02.12.2015

Diženā

(732) **Īpašn.** NOVOBALTIC, SIA; Bauskas iela 58A-412, Rīga, LV-1004, LV
(740) **Pārstāvis** Baiba DIDRIHSONE; Martas iela 9-37A, Rīga, LV-1011, LV
(511) **29** gaļa, mājputni; gaļas ekstrakti; gaļas izstrādājumi, to skaitā desas, žāvējumi, gaļas pusfabrikāti un gaļas konservi; olas, arī paipalu olas

(111) **Reģ. Nr.** M 70 319 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1704 (220) **Pieteik.dat.** 02.12.2015
(531) **CFE ind.** 27.5.24; 29.1.13



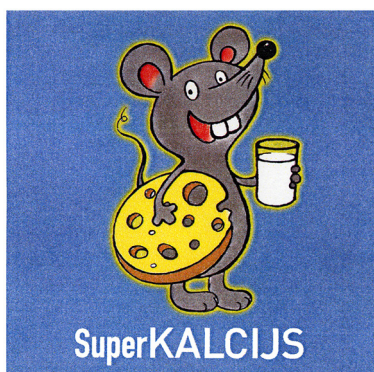
(591) **Krāsu salikums** brūns, melns, balts
(732) **Īpašn.** NOVOBALTIC, SIA; Bauskas iela 58A-412, Rīga, LV-1004, LV
(740) **Pārstāvis** Baiba DIDRIHSONE; Martas iela 9-37A, Rīga, LV-1011, LV
(511) **29** gaļa, mājputni; gaļas ekstrakti; gaļas izstrādājumi, to skaitā desas, žāvējumi, gaļas pusfabrikāti un gaļas konservi; olas, arī paipalu olas

(111) **Reģ. Nr.** M 70 320 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-133 (220) **Pieteik.dat.** 05.02.2016

SOLVITALE

(732) **Īpašn.** SOLEPHARM PHARMACEUTICALS, SIA; Alkšņu iela 4, Jaunmārupe, Mārupes nov., LV-2166, LV
(511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti

(111) **Reģ. Nr.** M 70 321 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-221 (220) **Pieteik.dat.** 24.02.2016
(531) **CFE ind.** 29.1.15; 3.5.7; 3.5.24; 3.5.26; 8.3.12; 8.7.1



(591) **Krāsu salikums** zils, rozā, oranžs, dzeltens, pelēks, melns, balts
(732) **Īpašn.** VR PACKING, SIA; Rubeņu iela 96, Jūrmala, LV-2011, LV
(511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem

(111) **Reģ. Nr.** M 70 322 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-357 (220) **Pieteik.dat.** 29.03.2016
(531) **CFE ind.** 26.1.12; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** violets, sarkans, oranžs, dzeltens, zaļš, zils, melns
(732) **Īpašn.** SEFINANCE CREDIT, SIA; Rūpniecības iela 14-19, Rīga, LV-1010, LV
(740) **Pārstāvis** Sandis EGLAVS; Rūpniecības iela 14-19, Rīga, LV-1010, LV
(511) **36** finanšu lietas; finanšu brokeru pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 323 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-253 (220) **Pieteik.dat.** 02.03.2016
(531) **CFE ind.** 26.1.2; 26.1.3; 26.1.15; 26.1.19; 29.1.14; 3.4.2; 5.5.4



(591) **Krāsu salikums** ziels, sarkans, dzeltens, balts
(732) **Īpašn.** SKRĪVERU SILDUMI, SIA; Daugavas iela 82, Skrīveri, Skrīveru nov., LV-5125, LV
(740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, "FORAL INTELEKTUĀLĀ ĪPAŠUMA AĢENTŪRA", SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
(511) **30** konditorejas izstrādājumi; konfektes; piena konfektes (gotiņas), karameles, ledenes; saldējums ar piena konfekšu pildījumu vai ar piena konfekšu garšu

(111) **Reģ. Nr.** M 70 324 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1203 (220) **Pieteik.dat.** 08.09.2015
(531) **CFE ind.** 5.3.13; 5.3.15; 27.5.6; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** zaļš, brūns, balts
(732) **Īpašn.** EKOLABORATORIYA, Obschestvo s ogranichennoy otvetstvennostyu; ul. 2-ya Mashinostroeniya 17, str. 1, Moskva, 115088, RU
(740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(511) **3** ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas; kosmētiskie līdzekļi, tostarp līdzekļi uz augu bāzes; dekoratīvā kosmētika; kosmētiskie līdzekļi un

preparāti; losjoni matiem; eļļas matiem; zobu pulveri un pastas; abrazīvie līdzekļi; ambra (smaržviela); aromatizētāji (ēteriskās eļļas); aerosoli mutes dobuma atsvaidzināšanai; balzami (ne medicīniskiem nolūkiem); lūpu spīdumi; aromātiskās vielas; līmvielas kosmētiskiem nolūkiem; smaržūdeņi; hlorūdens; lavandas ūdens; tualetes ūdeņi; vasks depilācijai; vasks ūsām; Marokas māls ('ghassoul') kosmētiskiem nolūkiem; masāžas geli (ne medicīniskiem nolūkiem); heliotropīns; žeļejas zobu balināšanai; ģērāniju eļļa; dekoratīvā kosmētika; dezodoranti cilvēkam; smaržas; tauki kosmētiskiem nolūkiem; augu uzlējumi; novelkamie dekoratīvie attēli kosmētiskiem nolūkiem; jononi (smaržvielas); aluņīts skūšanās nolūkiem; uzacu zīmulji; kosmētiskie zīmulji; silīcija karbīds (abrazīvs līdzeklis); metālu karbīdi (abrazīvi līdzekļi); alauna akmeņi (antiseptiski līdzekļi); korunds (abrazīvs līdzeklis); kosmētiskie krēmi; kosmētiskie balinošie krēmi; losjoni kosmētiskiem nolūkiem; pēcskūšanās losjoni; kosmētiskās maskas; parfimērijas eļļas; kosmētiskās eļļas; masāžas eļļas; tualetes eļļas; ēteriskās eļļas; ciedru ēteriskā eļļa; citronu ēteriskā eļļa; eļļas tualetes nolūkiem; bergamotes eļļa; gaultērijas eļļa; jasmīnu eļļa; lavandas eļļa; mandeļu eļļa; rožu eļļa; mandeļu pieniņš kosmētiskiem nolūkiem; tualetes pieniņi; muskuss (smaržviela); dezinfekcijas ziepes; dezodorējošās ziepes; skūšanās ziepes; tualetes ziepju gabali; ziepes ar ārstniecisku iedarbību; pretsviedru ziepes; ziepes pret pēdu svīšanu; mandeļu ziepes; piparmētras parfimērijas nolūkiem; kosmētisko līdzekļu komplekti; pumeks; plāksnītes elpas atsvaidzināšanai; lūpu krāsas; pomādes kosmētiskiem nolūkiem; kosmētiskie līdzekļi un preparāti skūšanās un pēcskūšanās nolūkiem; kosmētiskie līdzekļi un preparāti vannai un dušai; tualetes piederumi; personiskās tualetes līdzekļi; matu ievieidošanas līdzekļi; veļas mērcēšanas līdzekļi; mazgāšanas un dezodorēšanas preparāti intīmās higiēnas nolūkiem (tualetes piederumi); līdzekļi krāsas noņemšanai; līdzekļi ādas balināšanai; mutes skalošanas līdzekļi (ne medicīniskiem nolūkiem); kosmētiskie līdzekļi novāģēšanas nolūkiem; līdzekļi dekoratīvās kosmētikas noņemšanai; nagu kopšanas līdzekļi; alvejas preparāti kosmētiskiem nolūkiem; līdzekļi aizsardzībai no saules; dekoratīvās kosmētikas pūderi; ar kosmētiskiem losjoniem piesūcinātas salvetes; safrols; kaltētu ziedlapiņu un augu maisījumi; vannas sāļi (ne medicīniskiem nolūkiem); aromātisko vielu maisījumi kvēpināšanas nolūkiem (parfimērijas izstrādājumi); saistvielas kosmētiskiem nolūkiem; kosmētiskie līdzekļi uzacīm; kosmētiskie līdzekļi sauļošanās nolūkiem; kosmētiskie līdzekļi krāsošanās nolūkiem; matu krāsošanas līdzekļi un preparāti; kosmētiskie līdzekļi skropstām; depilācijas līdzekļi; kosmētiskie ādas un matu kopšanas līdzekļi un preparāti; kosmētiskie ādas un matu kopšanas līdzekļi un preparāti bērniem; kosmētiskie pretsviedru līdzekļi; talka pūderis ķermenim; terpēni (ēteriskās eļļas); sausie šampūni; kaustiskā soda; ziedu ekstrakti (smaržvielas); ēterisko vielu esences; zvaigžņveida anīsa esence; piparmētru esence (ēteriskā eļļa); minētās preces satur dabiskas organiskās vielas

4 aromatizētas sveces; sveces apgaismošanai; minētās preces satur dabiskas organiskās vielas

21 sūklīši sejas dekoratīvās kosmētikas uzklāšanai; sūklī mājsaimniecības nolūkiem; sūklī personiskās tualetes nolūkiem; minētās preces satur dabiskas organiskās vielas

(111) Reģ. Nr. M 70 325 (151) Reģ. dat. 20.10.2016
(210) Pieteik. Nr. M-15-1729 (220) Pieteik.dat. 09.12.2015

PLECARD

(732) Īpašn. NOVARTIS AG; Basel, CH-4002, CH
(740) Pārstāvis Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(511) **5** farmaceitiskie preparāti cilvēkam, proti, kardiovaskulārie preparāti

(111) Reģ. Nr. M 70 326 (151) Reģ. dat. 20.10.2016
(210) Pieteik. Nr. M-15-1730 (220) Pieteik.dat. 09.12.2015

ANGAL

(732) Īpašn. NOVARTIS AG; Basel, CH-4002, CH
(740) Pārstāvis Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(511) **5** farmaceitiskie preparāti cilvēkam

(111) Reģ. Nr. M 70 327 (151) Reģ. dat. 20.10.2016
(210) Pieteik. Nr. M-15-1731 (220) Pieteik.dat. 09.12.2015

DIRELON

(732) Īpašn. NOVARTIS AG; Basel, CH-4002, CH
(740) Pārstāvis Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(511) **5** farmaceitiskie preparāti cilvēkam, proti, kardiovaskulārie preparāti

(111) Reģ. Nr. M 70 328 (151) Reģ. dat. 20.10.2016
(210) Pieteik. Nr. M-16-21 (220) Pieteik.dat. 07.01.2016
(531) CFE ind. 27.5.1

**VANILLA
SAMURAI**

(732) Īpašn. BALBIINO AS; Viljandi mnt. 26, Tallinn, 11217, EE
(740) Pārstāvis Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(511) **30** maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; pārtikas ledus

(111) Reģ. Nr. M 70 329 (151) Reģ. dat. 20.10.2016
(210) Pieteik. Nr. M-16-63 (220) Pieteik.dat. 19.01.2016
(531) CFE ind. 26.1.1; 26.1.3; 26.1.12; 26.1.16; 29.1.14



ICEVEDA
NORDIC AYURVEDIC SPA

(591) Krāsu salikums tumši pelēks, gaiši pelēks, pelēks, balts
(732) Īpašn. NATURA SIBERICA LTD.; ul. Yuzhnobutovskaya 101-18A, Moskva, 117042, RU

(740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, "FORAL INTELEKTUĀLĀ ĪPAŠUMA AĢENTŪRA", SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(511) **3** abrazīvie līdzekļi; ambra (smaržviela); līdzekļi katlakmens noņemšanai mājāsaimniecības nolūkiem; antistatiskie līdzekļi mājāsaimniecības nolūkiem; gaisa atsvaidzināšanas līdzekļi; konditorejas izstrādājumu aromatizētāji (ēteriskās eļļas); dzērienu aromatizētāji (ēteriskās eļļas); aromātiskās vielas (ēteriskās eļļas); izsmidzināmi elpas atsvaidzināšanas līdzekļi; aerosoli ar saspiestu gaisu tīrīšanas nolūkiem; balzami (ne medicīniskiem nolūkiem); lūpu spīdumi; galodas pulēšanai; abrazīvais papīrs; smilšpapīrs; pulēšanas papīrs; vazelīns kosmētiskiem nolūkiem; apavu vasks; apavu kopšanas līdzekļi; kurpnieka piķis; vate kosmētiskiem nolūkiem; sauso smaržu maisiņi veļas aromatizēšanai; trauku žāvēšanas līdzekļi trauku mazgājamām mašīnām; līmvielas kosmētiskiem nolūkiem; hlorūdens; lavandas ūdens; tualetes ūdeņi; vasks veļas gludināšanai; parketa vasks; grīdas vasks ar pretslīdes efektu; depilācijas vasks; ūsu vasks; krēmi ādai (materiālam); grīdas un mēbeļu pulēšanas līdzekļi; vasks apavu labošanas nolūkiem; vasks spodrināšanas nolūkiem; vaska krītiņi drēbnieku vajadzībām; masāžas geli (ne medicīniskiem nolūkiem); heliotropīns; želejas zobu balināšanai; ģērāniju eļļa; dekoratīvā kosmētika; dezodoranti mājdzīvniekiem; dezodoranti cilvēkam un dzīvniekiem; depilācijas līdzekļi; smaržkociņi; smaržas; šķidrums grīdām ar pretslīdes efektu; automašīnu vējstiklu mazgāšanas līdzekļi; ziedes kosmētiskiem nolūkiem; vulkāniskie pelni tīrīšanas nolūkiem; parfimērijas izstrādājumi; dekoratīvās uzlīmes kosmētiskiem nolūkiem; jonons (smaržviela); aluņīts skūšanās nolūkiem (saistviela); uzacu zīmuļi; kosmētiskie zīmuļi; silīcija karbīds (abrazīvs līdzeklis); metālu karbīdi (abrazīvi līdzekļi); alauna akmeņi (antiseptiski līdzekļi); trepelis pulēšanai; līmvielas mākslīgo skropstu piestiprināšanai; līmvielas mākslīgo matu piestiprināšanai; kvilaja koka miza veļas mazgāšanai; korunds (abrazīvs līdzeklis); bārdas krāsošanas līdzekļi; krāsvielas kosmētiskiem nolūkiem; kosmētiskie krāsošanas līdzekļi; līdzekļi veļas cietināšanai; līdzekļi veļas spīdumam; apavu krēmi; krēmi pulēšanai; kosmētiskie krēmi; kosmētiskie krēmi ādas balināšanai; dzelzs oksīda līdzekļi pulēšanai; vīraks; matu lakas; nagu lakas; matu losjoni; losjoni kosmētiskiem nolūkiem; pēckūšanās losjoni; kosmētiskās maskas; eļļas smaržām; eļļas tīrīšanas nolūkiem; eļļas kosmētiskiem nolūkiem; eļļas tualetes nolūkiem; ēteriskās eļļas; ciedru ēteriskā eļļa; citronu ēteriskā eļļa; citronliānas ēteriskā eļļa; bergamotes eļļa; gaultērijas eļļa; jasmīnu eļļa; lavandas eļļa; mandeļu eļļa; rožu eļļa; terpentīneļļa attaukošanai; krīts balināšanai; krīts tīrīšanai; mandeļu pieniņš kosmētiskiem nolūkiem; attīroši pieniņi kosmētiskiem nolūkiem; muskuss (smaržviela); ziepes; dezinficējošas ziepes; dezodorējošas ziepes; skūšanās ziepes; ziepes tekstilizstrādājumu krāsas atsvaidzināšanai; tualetes ziepju gabali; ziepes ar ārstniecisku iedarbību; pretsviedru ziepes; ziepes pret pēdu svīšanu; mandeļu ziepes; piparmētras parfimērijas nolūkiem; kosmētisko izstrādājumu komplekti; smirģelis; dekoratīvās nagu uzlīmes; mākslīgie nagi; ziedu smaržu bāzes; vates irbulīši kosmētiskiem nolūkiem; kvēpināmie kociņi; pastas bārdas nažu asināšanas siksnām; zobu pulveri un pastas; pumeks; lūpu krāsu futrāļi; ūdeņraža pārskābe kosmētiskiem nolūkiem; plāksnītes elpas atsvaidzināšanai; abrazīvie audumi; abrazīvie audumi ar sīkgraudainu stikla materiālu virsmu (smirģeļaudēklis); lūpu krāsas; pomādes kosmētiskiem nolūkiem; skūšanās līdzekļi; kosmētiskie līdzekļi vannai; vannas līdzekļi (ne medicīniskiem nolūkiem); personiskās higiēnas līdzekļi (tualetes līdzekļi); matu ievieidošanas līdzekļi; veļas mērcēšanas līdzekļi; abrazīvie līdzekļi; dušas līdzekļi higiēnas un dezodorēšanas nolūkiem (tualetes

piederumi); cietināšanas līdzekļi veļas burzīšanās samazināšanai; līdzekļi krāsas noņemšanai; līdzekļi ādas izstrādājumu balināšanai; pulēšanas līdzekļi; zobu protēžu pulēšanas līdzekļi; mutes skalošanas līdzekļi (ne medicīniskiem nolūkiem); kosmētiskie līdzekļi novājēšanas nolūkiem; līdzekļi veļas cietināšanai un spīdumam; audumu mīkstinātāji veļas mazgāšanai; veļas balinātāji; ķīmiskās tīrīšanas līdzekļi; līdzekļi laku noņemšanai; līdzekļi dekoratīvās kosmētikas noņemšanai; līdzekļi grīdas vaska noņemšanai; līdzekļi nagu lakas noņemšanai; līdzekļi rūsas noņemšanai; nagu kopšanas līdzekļi; tīrīšanas līdzekļi; līdzekļi zobu protēžu tīrīšanai; līdzekļi tapešu tīrīšanai; līdzekļi aizsērējušu notekcauruļu tīrīšanai; līdzekļi veļas mazgāšanai; alvejas preparāti kosmētiskiem nolūkiem; losjoni aizsardzībai pret sauli; ķīmiskie līdzekļi veļas krāsas atjaunošanai mājāsaimniecības nolūkiem; spodrināšanas līdzekļi; dekoratīvās kosmētikas pūderi; abrazīvie līdzekļi no dimanta putekļiem; trauku tīrīšanas preparāti; tīrīšanas šķīdumi; mākslīgās skropstas; ar kosmētiskiem losjoniem piesūcinātas salvetes; safrons; veļas zilums; terpentīns attaukošanai; kaltētu ziedlapiņu un augu aromātiskie maisījumi (sausās smaržas); balinošā soda; mazgājamā soda tīrīšanai; vannas sāļi (ne medicīniskiem nolūkiem); balināšanas sāļi; kvēpināmie līdzekļi telpu aromatizēšanai; pulēšanas līdzekļi ādas izstrādājumu saglabāšanai; amonjaka šķīdums (ožamais spirts) tīrīšanas nolūkiem; savelkoši līdzekļi kosmētiskiem nolūkiem; kosmētiskie līdzekļi uzacīm; dekoratīvās kosmētikas līdzekļi; kosmētiskie līdzekļi sauļošanās nolūkiem; matu krāsas; neitralizētāji ilgviļņu veidošanai; līdzekļi augu lapu spīdumam; kosmētiskie līdzekļi; kosmētiskie līdzekļi skropstām; kosmētiskie līdzekļi ādas kopšanai; kosmētiskie līdzekļi dzīvniekiem; skropstu tuša; detergenti, izņemot ražošanai un medicīniskiem nolūkiem paredzētos detergentus; attaukošanas līdzekļi, kas nav paredzēti ražošanas nolūkiem; balināšanas līdzekļi kosmētiskiem nolūkiem; pretsviedru līdzekļi; talka pūderis ķermenim; terpēni (ēteriskās eļļas); ar tīrīšanas līdzekļiem impregnētas lupatiņas; henna (kosmētiskā krāsa); šampūni; šampūni mājdzīvniekiem; sausie šampūni; kaustiskā soda; ziedu ekstrakti (smaržas); ēterisko vielu esences; badjana (zvaigžņotā anīsa) esence; piparmētru esence (ēteriskā eļļa)

(111) **Reģ. Nr.** M 70 330 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-281 (220) **Pieteik.dat.** 10.03.2016
 (531) **CFE ind.** 25.1.19; 26.4.5; 26.4.22; 29.1.15; 5.7.8; 8.7.16



- (591) **Krāsu salikums** gaiši zaļš, zaļš, violets, zils, sarkans, dzeltens, brūns, balts
 (732) **Īpašn.** DOBELES DZIRNAVNIĒKS, AS; Spodrības iela 4, Dobeles, Dobeles novads, LV-3701, LV
 (511) **30** milti un labības produkti

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 331 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-287 (220) **Pieteik.dat.** 11.03.2016
 (531) **CFE ind.** 27.5.1; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** zils, balts
 (732) **Īpašn.** ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **30** milti un labības produkti; maize; maizes un konditorejas izstrādājumi, tostarp tortes, kūkas, kūksi, cepumi, vafeles, vafeļu tortes, saldētas tortes, krekeri, piparkūkas, šokolāde un šokolādes izstrādājumi, šokolādes tāfelītes, šokolādes batoniņi un šokolādes konfektes; saldējums

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 332 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-288 (220) **Pieteik.dat.** 11.03.2016
 (531) **CFE ind.** 27.5.1; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** zils, balts
 (732) **Īpašn.** ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **30** milti un labības produkti; maize; maizes un konditorejas izstrādājumi, tostarp tortes, kūkas, kūksi, cepumi, vafeles, vafeļu tortes, saldētas tortes, krekeri, piparkūkas, šokolāde un šokolādes izstrādājumi, šokolādes tāfelītes, šokolādes batoniņi un šokolādes konfektes; saldējums

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 333 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-290 (220) **Pieteik.dat.** 11.03.2016
 (531) **CFE ind.** 25.3.3; 29.1.13; 5.5.20

Pateicībā un Mīlestībā



• ANNO 1910 •

- (591) **Krāsu salikums** zeltains, sarkans, balts
 (732) **Īpašn.** ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **30** milti un labības produkti un to izstrādājumi; maize; maizes un konditorejas izstrādājumi, tostarp tortes, kūkas, kūksi, ruffles, cepumi, smalkmaizītes, kruasāni, vafeles, vafeļu tortes, saldētas tortes, krekeri, piparkūkas, šokolāde un šokolādes izstrādājumi, šokolādes tāfelītes, šokolādes batoniņi un šokolādes konfektes; saldējums

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 334 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1618 (220) **Pieteik.dat.** 09.11.2015
 (531) **CFE ind.** 26.4.6; 26.4.22; 27.5.24



- (732) **Īpašn.** ELEMENTOS TRADE LIMITED; Avlonos, 1 Maria House, Nicosia, 1075, CY
 (740) **Pārstāvis** Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra "KDK"; Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV
 (511) **29** apstrādāti, grauzdēti, sāļi un ar dažādām piedevām aromatizēti rieksti; augļu uzkodas; uzkodas no riekstiem; žāvētu augļu uzkodas; saulespuķu sēklas (pārtikai); sagatavotas saulespuķu sēklas; čipsi, augļu čipsi, banānu čipsi, dārzeņu čipsi, kartupeļu čipsi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 335 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1736 (220) **Pieteik.dat.** 11.12.2015
 (531) **CFE ind.** 26.1.2; 26.1.3; 26.1.20; 29.1.12



BA SCHOOL OF BUSINESS AND FINANCE

- (591) **Krāsu salikums** tumši zils, balts

(732) **Īpašn.** BANKU AUGSTSKOLA; Krišjāņa Valdemāra iela 161, Rīga, LV-1013, LV
 (511) **41** izglītības un apmācības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 339 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1656 (220) **Pieteik.dat.** 24.11.2015
 (531) **CFE ind.** 27.5.1

(111) **Reģ. Nr.** M 70 336 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-148 (220) **Pieteik.dat.** 09.02.2016
 (531) **CFE ind.** 19.7.12; 26.1.2; 26.1.3; 29.1.15; 5.7.13; 5.9.21



(554) **Telpiska zīme**
 (591) **Krāsu salikums** rozā, sarkans, purpursarkans, violets, tumši zaļš, zaļš, gaiši zaļš, oranžs, dzeltens, balts
 (732) **Īpašn.** CIDO GRUPA, SIA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV
 (740) **Pārstāvis** Anete KUPČA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV
 (511) **32** minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

(111) **Reģ. Nr.** M 70 337 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1236 (220) **Pieteik.dat.** 16.09.2015

LATLOTO

(732) **Īpašn.** LATVIJAS LOTO, Valsts AS; Meistaru iela 19, Rīga, LV-1050, LV
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra "TESIO"; Kronvalda bulvāris 3, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; informācijas vākšana datoru datubāzēs; informācijas sistematizācija datubāzēs; loteriju un izložu biješu tirdzniecība, arī ar interneta vai citu saziņas līdzekļu starpniecību
41 audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi; televīzijas spēļu veidošana, televīzijas izklaides pakalpojumi ar skatītāju piedalīšanos; loteriju un izložu organizēšana un vadīšana, arī ar interneta vai citu saziņas līdzekļu starpniecību; spēļu pakalpojumi tiešsaistes režīmā

(111) **Reģ. Nr.** M 70 338 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1369 (220) **Pieteik.dat.** 15.07.2016

Guerrieri

(732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
 (511) **20** dīvāni, krēsli, gultas, tahtas, galdi; mēbeles, spoguļi, rāmji; metāla mēbeles un kempinga mēbeles; gultas piederumi, izņemot gultas veļu
25 apģērbi: blūzes, kaklasaites, svārki, bikses, žaketes
42 konsultāciju sniegšana datoru sistēmu projektēšanas jomā; datoru sistēmu problēmu risināšana

Cafeterius

(732) **Īpašn.** ART. LEBEDEV STUDIO, LLC; 1905 Year Street 7, building 1, Moscow, 123995, RU
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra "TESIO"; Kronvalda bulvāris 3, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **21** mājturības un virtuves piederumi, ierīces, tilpnes un trauki; ķemmes un sūkļi; sukas (izņemot otas); materiāli suku izstrādājumiem; tīrīšanas un apkopšanas rīki un ierīces; tērauda skaidas (tīrīšanai); neapstrādāts vai daļēji apstrādāts stikls (izņemot stiklu celtniecības vajadzībām); izstrādājumi no stikla, porcelāna, fajansa un keramikas
25 apģērbi, apavi, galvassegas
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi, tapioka un sāgo; milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; raugs, cepamais pulveris; sāls, sinepes; etiķis, garšvielu mērces; garšvielas; pārtikas ledus
35 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
41 audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi
43 apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 340 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-69 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016

ANIDOLLS

(732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198A, Rīga, LV-1019, LV
 (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
28 elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
41 izpriecās; azartspēļu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 341 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-70 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016

GOLDEN BIJOU

(732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198A, Rīga, LV-1019, LV
 (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
28 elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
41 izpriecās; azartspēļu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 342 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-71 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016

VIKINGAR

- (732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198A, Rīga, LV-1019, LV
 (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
28 elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
41 izpriecas; azartspēļu pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 343 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-72 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016

MIGHTY ZOO

- (732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198A, Rīga, LV-1019, LV
 (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
28 elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
41 izpriecas; azartspēļu pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 344 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-73 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016

DOUBLE RICH

- (732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198A, Rīga, LV-1019, LV
 (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
28 elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
41 izpriecas; azartspēļu pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 345 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-74 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2016

BRICK FRUITS

- (732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198A, Rīga, LV-1019, LV
 (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
28 elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
41 izpriecas; azartspēļu pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 346 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-271 (220) **Pieteik.dat.** 08.03.2016

ZIEDU LAIKA

- (732) **Īpašn.** CIDO GRUPA, SIA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV
 (740) **Pārstāvis** Anete KUPČA; Ostas iela 4, Rīga, LV-1034, LV
 (511) **32** alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 347 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-210 (220) **Pieteik.dat.** 24.02.2016

Apbedīšanas birojs Akropolis

- (732) **Īpašn.** LOADER, SIA; Slokas iela 161, Rīga, LV-1067, LV
 (740) **Pārstāvis** Karīna DEMENTJEVA; Krišjāņa Valdemāra iela 38-612, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **39** transporta pakalpojumi
45 apbedīšanas pakalpojumi; apbedīšana zemē, apbedīšana jūrā; morga pakalpojumi; krematorijas pakalpojumi; bērņu organizēšana; kapu kopšana

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 348 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-213 (220) **Pieteik.dat.** 24.02.2016
 (531) **CFE ind.** 2.1.3; 2.1.21; 29.1.14; 3.1.8; 3.1.24



- (591) **Krāsu salikums** gaiši brūns, brūns, melns, balts
 (732) **Īpašn.** LOADER, SIA; Slokas iela 161, Rīga, LV-1067, LV
 (740) **Pārstāvis** Karīna DEMENTJEVA; Krišjāņa Valdemāra iela 38-612, Rīga, LV-1010, LV
 (511) **39** transporta pakalpojumi
45 apbedīšanas pakalpojumi; apbedīšana zemē, apbedīšana jūrā; morga pakalpojumi; krematorijas pakalpojumi; bērņu organizēšana; kapu kopšana

- (111) **Reģ. Nr.** M 70 349 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-142 (220) **Pieteik.dat.** 08.02.2016
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 27.5.21; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** tumši zils, zils
 (732) **Īpašn.** ALTENERGY, SIA; Augusta Deglava iela 104-41, Rīga, LV-1082, LV
 (740) **Pārstāvis** Irina PAPAKULE; Augusta Deglava iela 104-41, Rīga, LV-1082, LV
 (511) **1** ķīmiskās vielas, ķīmiskie materiāli, ķīmiskie preparāti un dabiskie elementi
6 būvmateriāli un būvelementi no metāla (caurules, cauruļvadi un šļūtenes, kā arī to armatūra, tostarp vārsti, no metāla); metāla konteineri, metāla izstrādājumi transportēšanas un iepakojšanas nolūkiem; metāla izstrādājumi; metāla konstrukcijas un pārvietojamas metāla būves
7 mašīnas un iekārtas, kas paredzētas izmantošanai lauksaimniecībā, zemes darbos, būvniecībā, naftas un gāzes ieguvē un kalnrūpniecībā; sūkņi, kompresori un ventilatori; ražošanas un materiālu apstrādes mašīnas un darbmašīnas

- 9 elektriskie aparāti diagnostikai, kontrolei (pārbaudei) un dozēšanai, elektroteleji, centrifūgas laboratoriju vajadzībām; elektriskie instrumenti un kabeli; elektrisko aparātu, instrumentu un kabelu elektriskie un elektroniskie komponenti; detektori un mērīšanas un monitoringa ierīces, indikatori un regulatori (vadības ierīces)
- 11 dūmvadi un iekārtas izplūdes gāzu novadīšanai; sanitārtehniskās iekārtas, ūdensapgādes un kanalizācijas iekārtas (ūdens attīrīšanas, atsāļošanas un kondicionēšanas iekārtas, sanitārtehniskās un vannas iekārtas un sanitārtehniskā armatūra); degļi, sildītāji un apkures katli; rūpnieciskās apstrādes iekārtas ūdensapgādei, siltumapgādei, dzesēšanai un notekūdeņu attīrīšanai; apkures, ventilācijas un gaisa kondicionēšanas un attīrīšanas iekārtas; regulēšanas un drošības palīgierīces ūdens un gāzes iekārtām
- 17 elastīgas caurules, cauruļvadi, šļūtenes un to armatūra, tostarp nemetāliski vārsti; ielāpi, blīvējuma materiāli un pildījumi; izolācijas materiāli un aizsargbarjeras
- 19 nemetāliski būvmateriāli un būvelementi (caurules un cauruļvadi, kā arī to piederumi, tostarp nemetāliski ventiļi); nemetāliskas konstrukcijas un pārvietojamas būves
- 37 labiekārtošana (iekārtu uzstādīšana), tīrīšana, remonts un apkope (apkures, ventilācijas un gaisa kondicionēšanas sistēmu uzstādīšana, apkope un remonts); būvniecība un būvju nojaukšana
- 40 gaisa un ūdens kondicionēšana un attīrīšana; materiālu apstrāde un pārveidošana (izejvielu un atkritumu otrreizējā pārstrāde); izgatavošanas un montāžas pakalpojumi pēc pasūtījuma
- 42 zinātniskie un tehnoloģiskie pakalpojumi (tehniskā projektēšana un plānošana, inženiertehniskie pakalpojumi)

(111) **Reģ. Nr.** M 70 350 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-3 (220) **Pieteik.dat.** 04.01.2016

EVERLAST ЭВЕРЛАСТ

- (732) **Īpašn.** TECHNONICOL, ZAO; Krimsky Val, 8, Moskva, 119409, RU
- (740) **Pārstāvis** Rūta OLMANE; a/k 49, Rīga, LV-1006, LV
- (511) **17** kaučuks, gumija, gutaperča, azbests, vizla; plastmasu pusfabrikāti rūpnieciskiem nolūkiem; drīvēšanas, blīvēšanas un izolācijas materiāli, tostarp skaņas izolācijas materiāli, ugunsizolācijas materiāli, strāvu nevadoši materiāli siltuma uzturēšanai; blīvēšanas maisījumi, ūdensdroši izolācijas materiāli, savienojumu blīvēšanai paredzēto materiālu sastāvdaļas; minerālvate (izolācijas materiāls), stikla vate izolācijas nolūkiem, stikšķiedra izolācijas nolūkiem; lokanas nemetāliskas caurules
- 19** nemetāliski būvmateriāli, tostarp ģeotekstīlijas, celtniecības kartons, ar bitumu apstrādāts celtniecības kartons; nemetāliski jumta segumi; bitumena izstrādājumi celtniecībai; ceļu pārklājuma materiāli; materiāli ceļu būvniecībai un pārklājumiem; piķis; pārklājumi (būvmateriāli); nemetāliski celtniecības paneļi; nemetāliski ielu seguma bloki; bitumena segumi jumtiem; nemetāliski jumtu pārsegumi; nemetāliski ēku oderējuma materiāli; celtniecības java; skaņu izolējošs stikls celtniecības nolūkiem; nemetāliski jumta kārņiņi; kārņiņi; nemetāliskas cietas caurules celtniecības nolūkiem; asfalts, darva un bitumens; pārvietojamas nemetāliskas būves un konstrukcijas

(111) **Reģ. Nr.** M 70 351 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-124 (220) **Pieteik.dat.** 02.02.2016

WELLTON TELEGRAF

- (732) **Īpašn.** INTERNATIONAL HOTEL OPERATOR COMPANY, SIA; Brīvības gatve 445-7, Rīga, LV-1024, LV
- (740) **Pārstāvis** Rūta OLMANE; a/k 49, Rīga, LV-1006, LV
- (511) **43** apgāde ar uzturu; kafejnīcu, restorānu, bāru un bufešu pakalpojumi; viesu izmitināšana; viesnīcu pakalpojumi; vietu rezervēšana viesnīcās

(111) **Reģ. Nr.** M 70 352 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-1370 (220) **Pieteik.dat.** 08.10.2015
(531) **CFE ind.** 27.5.1



- (732) **Īpašn.** Aleksejs SAVICKIS; Ķengaraga iela 7-9, Rīga, LV-1063, LV
- (740) **Pārstāvis** Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā Īpašuma juridiskā firma "LATISS"; Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (511) **9** lietojumprogrammatūra mobilajiem telefoniem
35 reklāmas pakalpojumi restorānu jomā
43 informācijas pakalpojumi attiecībā uz restorāniem

(111) **Reģ. Nr.** M 70 353 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-15-857 (220) **Pieteik.dat.** 14.07.2015
(531) **CFE ind.** 25.7.17; 27.5.24



- (732) **Īpašn.** CIRCLE K LATVIA, SIA; Dunties iela 6, Rīga, LV-1013, LV
- (740) **Pārstāvis** Alīna BOGDANOVIČA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (511) **30** hotdogi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 354 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(210) **Pieteik. Nr.** M-16-235 (220) **Pieteik.dat.** 26.02.2016

POLAR MONKEYS

- (300) **Prioritāte** T201552406; 10.11.2015; FI
- (732) **Īpašn.** OY HARTWALL AB; Hiomotie 32, Helsinki, 00380, FI
- (740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
- (511) **32** alus, porteris, eils
33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 70 355 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-259 (220) **Pieteik.dat.** 03.03.2016
 (531) **CFE ind.** 27.5.1; 29.1.11



(591) **Krāsu salikums** gaiši zils
 (732) **Īpašn.** VERY SPECIAL, SIA; Ilūkstes iela 103 k-1-95, Rīga, LV-1082, LV
 (740) **Pārstāvis** Aleksandrs PUŠKINS; Ilūkstes iela 103 k-1-95, Rīga, LV-1082, LV
 (511) **43** restorānu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 356 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-350 (220) **Pieteik.dat.** 24.03.2016
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.3; 26.4.8; 26.4.9; 27.5.24; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** tumši zils, zils, pelēks, balts
 (732) **Īpašn.** ND DOORS, SIA; Bieķensalas iela 21, Rīga, LV-1004, LV
 (740) **Pārstāvis** Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra "KDK"; Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV
 (511) **6** metāla durvis; garāžu durvis no metāla; metāla vārti; metāla durvju furnitūra; durvju rāmji no metāla; durvju rokturi no metāla; durvju slēdzenes; durvju stiprinājumi no metāla; durvju turētāji no metāla; metāla aizbīdņi durvju slēgšanai; metāla durvju daļas; metāla durvju paneli; neelektriskas durvju atsperes; metāla vārtu daļas un furnitūra
19 nemetāliskas durvis; nemetāliskas garāžas durvis; nemetāliskas paceļamās durvis; nemetāliski vārti; nemetāliski durvju paneli; nemetāliski durvju rāmji

(111) **Reģ. Nr.** M 70 357 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1122 (220) **Pieteik.dat.** 24.08.2015

Watro

(732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
 (511) **9** datori; datoru programmatūra; ar datoriem saistītās ierīces, kas ietvertas šajā klasē; elektroniskās datu apstrādes iekārtas; datortīklu aparatūra; visu minēto preču daļas un piederumi
35 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; konsultācijas personāla vadības jautājumos; nodarbinātības aģentūru pakalpojumi pagaidu, tstermiņa un pastāvīgajiem darbiniekiem; kvalificēta tehniskā personāla pakalpojumi uzņēmējdarbības un reklāmas jomā

(111) **Reģ. Nr.** M 70 358 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1124 (220) **Pieteik.dat.** 24.08.2015

XBEE

(732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
 (511) **25** apģērbi; moderni apģērbi; apavi un galvassegas; peldkostīmi; sporta apģērbi
35 informācijas apkopošana par dažādām precēm; apģērbu un modes aksesuāru mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar elektronisko saziņas līdzekļu un tīmekļa vietņu starpniecību

(111) **Reģ. Nr.** M 70 359 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1125 (220) **Pieteik.dat.** 24.08.2015

XMO

(732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
 (511) **9** datori; datoru programmatūra; ar datoriem saistītās ierīces, kas ietvertas šajā klasē; elektroniskās datu apstrādes iekārtas; datortīklu aparatūra; visu minēto preču daļas un piederumi
36 finanšu pakalpojumi; banku un ar bankām saistītu institūciju pakalpojumi, proti, valūtas maiņas punktu pakalpojumi un mijieskaita norēķinu pakalpojumi; finanšu vadība un plānošana
38 telesakari; televīzijas pārraide, izmantojot Interneta protokolu (IPTV); televīzijas pārraide, izmantojot globālos sakaru tīklus un Internetu; televīzijas apraide televīzijas šovu un filmu veidošana un izplatīšana;
41 televīzijas programmu veidošana; neiejūplādējamu filmu un televīzijas programmu nodrošināšana
45 konsultāciju pakalpojumi uzņēmumiem un privātpersonām imigrācijas jomā; imigrācijas konsultāciju pakalpojumi saistībā ar vīzu iegūšanu

(111) **Reģ. Nr.** M 70 360 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1333 (220) **Pieteik.dat.** 02.10.2015

Savoca

(732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
 (511) **9** telekomunikāciju iekārtas un instrumenti; zinātniskās elektroniskās iekārtas un instrumenti; datu apstrādes un skaitļošanas iekārtas, arī informācijas ievades un izvades ierīces, kuras paredzētas lietošanai kopā ar tām; elektroniskās drošības iekārtas un aparatūra; visu iepriekšminēto preču daļas, piederumi un programmatūra
25 apģērbi: krekli, blūzes, kaklasaites, svārki, bikses, žaketes

(111) **Reģ. Nr.** M 70 361 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1336 (220) **Pieteik.dat.** 02.10.2015

Principato

(732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
 (511) **9** elektrotehniskās un elektroniskās iekārtas, to strukturālās sastāvdaļas, daļas un elementi; elektrisko un elektronisko iekārtu kontroles un regulēšanas ierīces; komunikāciju tīklu daļas; elektriskie kondensatori
20 guļammaisi, guļampaklāji
25 apģērbi, apavi, galvassegas

(111) **Reģ. Nr.** M 70 362 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1433 (220) **Pieteik.dat.** 19.10.2015

Everfast

- (732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
- (511) **9** datoru mikroshēmas; datoru peles; datoru perifērijas iekārtas un to daļas; elektriskie savienojumi un savienotāji; kontaktdakšas un kontaktligzdas; radioaparātūra; elektronisko signālu raidītāji
- 16** kancelejas preces; periodiskie izdevumi, žurnāli, avīzes, grāmatas; materiāli māksliniekiem; rakstāmlietas; skiču bloki; dienasgrāmatas, plakāti, fotogrāfijas, albumi, ietinamais papīrs, pastkartes, apsveikuma kartītes; līmvielas kancelejas vai mājturības vajadzībām; kalendāri; papīra galdauti, papīra salvetes; dzēšamgumijas, zīmuļu asināmie, krītiņi, krāsainie zīmuļi; plastmasas iesaiņojuma materiāli, papīra maisiņi; plastmasas maisiņi; uzlīmes
- 38** tiešsaistes forumu un elektronisko ziņojumu dēļu darbības nodrošināšana; e-pasta un ziņojumu apmaiņas pakalpojumu nodrošināšana; telekomunikāciju pakalpojumu nodrošināšana ar Interneta starpniecību; elektronisko signālu videopārraide; videopārraides pakalpojumi; audioierakstu un videoierakstu lejupielādes nodrošināšana; elektronisko savienojumu nodrošināšana ar Internetu un datubāzēm telekomunikāciju nolūkos; datu pārraide, elektronisko ziņojumu pārraide; multimediju sakaru pakalpojumi; ar meklētājprogrammu starpniecību izgūto datu pārraide, izmantojot sakaru tīklus; informācijas sniegšana un konsultācijas par iepriekš minētajiem pakalpojumiem, arī ar Interneta un telefona starpniecību

(111) **Reģ. Nr.** M 70 363 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1557 (220) **Pieteik.dat.** 30.10.2015

Bluevision

- (732) **Īpašn.** GRIGORIUS HOLDINGS, SIA; Juglas iela 31-8, Rīga, LV-1064, LV
- (511) **9** datori; datoru programmatūra; datoru perifērijas ierīces; elektroniskā datu apstrādes aparātūra; datortīklu aparātūra; minēto preču daļas un piederumi
- 38** telesakari; televīzijas pārraide, izmantojot interneta protokolu (IPTV); televīzijas apraide, arī globālajos komunikāciju tīklos un internetā
- 41** audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi; televīzijas šovu un filmu veidošana un izplatīšana; televīzijas programmu veidošana; nelejuplādējamu filmu un televīzijas programmu nodrošināšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 364 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-205 (220) **Pieteik.dat.** 22.02.2016
 (531) **CFE ind.** 14.7.13; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts
 (732) **Īpašn.** DRILLER, SIA; Ropažu iela 35-4, Rīga, LV-1006, LV
 (511) **37** urbšanas pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 365 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-206 (220) **Pieteik.dat.** 29.03.2016
 (531) **CFE ind.** 15.1.17; 24.1.12; 24.1.15; 24.1.17; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** dzeltens, melns, balts
 (732) **Īpašn.** Sergejs PISLEGINS; Pļavu iela 15, Ādaži, Ādažu nov., LV-2164, LV
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
37 būvniecība; ēku apkope un remonts; informācijas sniegšana Internetā par būvniecību, ēku apkopi un remontu

(111) **Reģ. Nr.** M 70 366 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-251 (220) **Pieteik.dat.** 01.03.2016

BiFresh

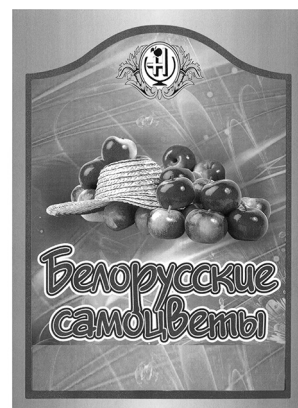
- (732) **Īpašn.** LIVONIA, SIA; Lāču iela 10, Cēsis, Cēsu nov., LV-4101, LV
 (511) **32** gāzētie un negāzētie bezalkoholiskie dzērieni

(111) **Reģ. Nr.** M 70 367 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-15-1788 (220) **Pieteik.dat.** 22.12.2015

COD

- (732) **Īpašn.** SIMPLY DELICIOUS, SIA; Augstrozes iela 1A, Rīga, LV-1026, LV
 (511) **43** apgāde ar uzturu, proti, ēdienu un dzērienu gatavošana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 368 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-143 (220) **Pieteik.dat.** 08.02.2016
 (531) **CFE ind.** 25.1.15; 5.7.13; 9.7.17



- (732) **Īpašn.** BALTĀ BURA, SIA; Getliņu iela 18, Rumbula, Stopiņu nov., LV-2121, LV
- (740) **Pārstāvis** Māra UZULĒNA, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV
- (511) **32** alus; minerālūdeņi, gāzētie ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai
- 33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu), tai skaitā vīni, dzirkstošie vīni, stiprie alkoholiskie dzērieni, degvīni, brendiji, viskiji, liķieri, balzami, aperitīvi, rumi, džini, raudzētie dzērieni ar alkohola saturu virs 6 %

(111) **Reģ. Nr.** M 70 369 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-209 (220) **Pieteik.dat.** 23.02.2016

EssentiLiv

- (732) **Īpašn.** GRIPHARMA, SIA; Oskara Kalpaka iela 1, Ogre, Ogres nov., LV-5001, LV
- (511) **5** uztura bagātinātāji

(111) **Reģ. Nr.** M 70 370 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-224 (220) **Pieteik.dat.** 24.02.2016
 (531) **CFE ind.** 24.1.15



ELETTO

- (732) **Īpašn.** ELETTO RIGA, SIA; Anniņmuižas bulvāris 30-80, Rīga, LV-1067, LV
- (511) **25** ādas apģērbi; apģērbi no ādas imitācijas; adīti apģērbi; brīvā laika apģērbi; apģērbi ar augstu apkakli; apģērbi, kas paredzēti valkāšanai ikdienā; apģērbi no kašmīra; apģērbi no kažokādas; apģērbi no zīda; viegli apģērbi valkāšanai virs peldkostīma; džinsu apģērbi; sieviešu apģērbi; vilnas apģērbi
- 35** apģērbu mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 70 371 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-241 (220) **Pieteik.dat.** 29.02.2016

NordCard

- (732) **Īpašn.** HEDGE CAPITAL COMPANY, SIA; Baznīcas iela 20/22-40, Rīga, LV-1010, LV
- (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "FORT"; Antonijas iela 8-4, Rīga, LV-1010, LV
- (511) **36** patērētāju kredītēšanas pakalpojumi; kredītkaršu izsniegšana

(111) **Reģ. Nr.** M 70 372 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-245 (220) **Pieteik.dat.** 01.03.2016
 (531) **CFE ind.** 27.5.1

SKUDRU gaļa

- (732) **Īpašn.** Māris SKUDRA; Lāčplēša iela 10, Krāslava, Krāslavas nov., LV-5601, LV
- (740) **Pārstāvis** Māra UZULĒNA, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV

- (511) **29** gaļa, gaļas izstrādājumi, gaļas produkti, tostarp gaļas kūpinājumi; zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti

(111) **Reģ. Nr.** M 70 373 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-263 (220) **Pieteik.dat.** 04.03.2016

cblcl.lv

- (732) **Īpašn.** CITADELE BANKA, AS; Republikas laukums 2A, Rīga, LV-1010, LV

- (511) **36** apdrošināšana, tostarp apdrošināšanas starpniecības pakalpojumi; nekustamā īpašuma lietas; finanšu lietas; darījumi ar naudu; finanšu un banku pakalpojumi, tostarp kontu atvēršana un apkalpošana, noguldījumu un citu atmaksājamo līdzekļu piesaistīšana, kredītēšana, tostarp tirdzniecības finansēšanu un patēriņa kredītēšanu, finanšu līzingu un faktoringa pakalpojumi, maksājumu pakalpojumi, tostarp pārskaitījumu veikšanu, skaidras naudas darījumus, skaidras naudas izmaksu, izmantojot maksājumu karšu pieņemšanas ierīces (POS termināļus), un skaidras naudas iemaksu un izmaksu, izmantojot bankas automātus, maksājumu karšu un citu maksāšanas līdzekļu izsniegšana un apkalpošana, valūtas maiņa, ar maksājumu pakalpojumu sniegšanu nesaistītu bezskaidras naudas maksāšanas līdzekļu emitēšana un apkalpošana, darījumu veikšana savā vai klienta vārdā ar valūtu, finanšu instrumentiem, investīciju zeltu, naudas tirgus instrumentiem, finanšu nākotnes un iespējas līgumiem, valūtas instrumentiem, procentu likmju instrumentiem un pārvedamiem vērtspapīriem, uzticības operācijas (trusts), ieguldījumu pakalpojumi un ieguldījumu blakuspakalpojumi, kapitāla pārvedumu pakalpojumi, finanšu pakalpojumi kapitāla nodrošināšanai, vērtspapīru portfeļu pārvaldīšana, vērtspapīru emitēšana un glabāšana, garantiju sniegšanas pakalpojumi, tostarp galvojumu un citu saistību aktu izsniegšanu, ar kuriem tiek uzņemts pienākums atbildēt kreditoriem par trešo personu parādiem, vērtību glabāšana, seifu iznomāšana, konsultāciju sniegšana klientiem finansiāla rakstura jautājumos, ar klientu parādu saistību kārtotšanu saistītas informācijas sniegšana, elektroniskās naudas emisija, pakalpojumi ar elektronisko līdzekļu starpniecību, tostarp norēķinu veikšanu ar globālo datortīklu, telefonsakaru un faksimilsakaru starpniecību, kredītinformācijas apstrādes un sniegšanas pakalpojumi, fondu pārvaldīšana un inkaso (maksājumu iekasēšanas) pakalpojumi
- 45** drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai

(111) **Reģ. Nr.** M 70 374 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-264 (220) **Pieteik.dat.** 04.03.2016

cblinkasacija.lv

- (732) **Īpašn.** CITADELE BANKA, AS; Republikas laukums 2A, Rīga, LV-1010, LV

- (511) **36** apdrošināšana, tostarp apdrošināšanas starpniecības pakalpojumi; nekustamā īpašuma lietas; finanšu lietas; darījumi ar naudu; finanšu un banku pakalpojumi, tostarp kontu atvēršana un apkalpošana, noguldījumu un citu atmaksājamo līdzekļu piesaistīšana, kredītēšana, tostarp tirdzniecības finansēšanu un patēriņa kredītēšanu, finanšu līzingu un faktoringa pakalpojumi, maksājumu pakalpojumi, tostarp pārskaitījumu veikšanu, skaidras naudas darījumus, skaidras naudas izmaksu, izmantojot maksājumu karšu pieņemšanas ierīces (POS termināļus), un skaidras naudas iemaksu un izmaksu, izmantojot bankas automātus, maksājumu karšu un citu maksāšanas līdzekļu izsniegšana un apkalpošana, valūtas maiņa, ar maksājumu pakalpojumu sniegšanu

nesaistītu bezskaidras naudas maksāšanas līdzekļu emitēšana un apkalpošana, darījumu veikšana savā vai klienta vārdā ar valūtu, finanšu instrumentiem, investīciju zeltu, naudas tirgus instrumentiem, finanšu nākotnes un iespējas līgumiem, valūtas instrumentiem, procentu likmju instrumentiem un pārvedamiem vērtspapīriem, uzticības operācijas (trusts), ieguldījumu pakalpojumi un ieguldījumu blakuspakalpojumi, kapitāla pārvedumu pakalpojumi, finanšu pakalpojumi kapitāla nodrošināšanai, vērtspapīru portfeļu pārvaldīšana, vērtspapīru emitēšana un glabāšana, garantiju sniegšanas pakalpojumi, tostarp galvojumu un citu saistību aktu izsniegšanu, ar kuriem tiek uzņemts pienākums atbildēt kreditoriem par trešo personu parādiem, vērtību glabāšana, seifu iznomāšana, konsultāciju sniegšana klientiem finansiāla rakstura jautājumos, ar klientu parādu saistību kārtošanu saistītas informācijas sniegšana, elektroniskās naudas emisija, pakalpojumi ar elektronisko līdzekļu starpniecību, tostarp norēķinu veikšanu ar globālo datortīklu, telefonsakaru un faksimilsakaru starpniecību, kredītinformācijas apstrādes un sniegšanas pakalpojumi, fondu pārvaldīšana un inkaso (maksājumu iekasēšanas) pakalpojumi

45 drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai

(111) **Reģ. Nr.** M 70 375 (151) **Reģ. dat.** 20.10.2016
 (210) **Pieteik. Nr.** M-16-265 (220) **Pieteik.dat.** 04.03.2016

cblcash.lv

(732) **Īpašn.** CITADELE BANKA, AS; Republikas laukums 2A, Rīga, LV-1010, LV

(511) **36** apdrošināšana, tostarp apdrošināšanas starpniecības pakalpojumi; nekustamā īpašuma lietas; finanšu lietas; darījumi ar naudu; finanšu un banku pakalpojumi, tostarp kontu atvēršana un apkalpošana, noguldījumu un citu atmaksājamo līdzekļu piesaistīšana, kreditēšana, tostarp tirdzniecības finansēšanu un patēriņa kreditēšanu, finanšu līzingu un faktoringa pakalpojumi, maksājumu pakalpojumi, tostarp pārskaitījumu veikšanu, skaidras naudas darījumus, skaidras naudas izmaksu, izmantojot maksājumu karšu pieņemšanas ierīces (POS termināļus), un skaidras naudas iemaksu un izmaksu, izmantojot bankas automātus, maksājumu karšu un citu maksāšanas līdzekļu izsniegšana un apkalpošana, valūtas maiņa, ar maksājumu pakalpojumu sniegšanu nesaistītu bezskaidras naudas maksāšanas līdzekļu emitēšana un apkalpošana, darījumu veikšana savā vai klienta vārdā ar valūtu, finanšu instrumentiem, investīciju zeltu, naudas tirgus instrumentiem, finanšu nākotnes un iespējas līgumiem, valūtas instrumentiem, procentu likmju instrumentiem un pārvedamiem vērtspapīriem, uzticības operācijas (trusts), ieguldījumu pakalpojumi un ieguldījumu blakuspakalpojumi, kapitāla pārvedumu pakalpojumi, finanšu pakalpojumi kapitāla nodrošināšanai, vērtspapīru portfeļu pārvaldīšana, vērtspapīru emitēšana un glabāšana, garantiju sniegšanas pakalpojumi, tostarp galvojumu un citu saistību aktu izsniegšanu, ar kuriem tiek uzņemts pienākums atbildēt kreditoriem par trešo personu parādiem, vērtību glabāšana, seifu iznomāšana, konsultāciju sniegšana klientiem finansiāla rakstura jautājumos, ar klientu parādu saistību kārtošanu saistītas informācijas sniegšana, elektroniskās naudas emisija, pakalpojumi ar elektronisko līdzekļu starpniecību, tostarp norēķinu veikšanu ar globālo datortīklu, telefonsakaru un faksimilsakaru starpniecību, kredītinformācijas apstrādes un sniegšanas pakalpojumi, fondu pārvaldīšana un inkaso (maksājumu iekasēšanas) pakalpojumi

45 drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai

Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs

(210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs	(210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs
M-15-857	M 70 353	M-16-263	M 70 373
M-15-1108	M 70 288	M-16-264	M 70 374
M-15-1122	M 70 357	M-16-265	M 70 375
M-15-1124	M 70 358	M-16-271	M 70 346
M-15-1125	M 70 359	M-16-281	M 70 330
M-15-1147	M 70 287	M-16-287	M 70 331
M-15-1203	M 70 324	M-16-288	M 70 332
M-15-1206	M 70 289	M-16-290	M 70 333
M-15-1227	M 70 290	M-16-350	M 70 356
M-15-1236	M 70 337	M-16-357	M 70 322
M-15-1299	M 70 291	M-16-739	M 70 315
M-15-1333	M 70 360	M-16-740	M 70 316
M-15-1336	M 70 361	M-16-782	M 70 317
M-15-1354	M 70 292		
M-15-1369	M 70 338		
M-15-1370	M 70 352		
M-15-1433	M 70 362		
M-15-1557	M 70 363		
M-15-1595	M 70 293		
M-15-1602	M 70 294		
M-15-1618	M 70 334		
M-15-1633	M 70 295		
M-15-1656	M 70 339		
M-15-1675	M 70 296		
M-15-1703	M 70 318		
M-15-1704	M 70 319		
M-15-1707	M 70 297		
M-15-1729	M 70 325		
M-15-1730	M 70 326		
M-15-1731	M 70 327		
M-15-1736	M 70 335		
M-15-1788	M 70 367		
M-15-1789	M 70 298		
M-16-3	M 70 350		
M-16-19	M 70 299		
M-16-21	M 70 328		
M-16-24	M 70 300		
M-16-53	M 70 301		
M-16-63	M 70 329		
M-16-69	M 70 340		
M-16-70	M 70 341		
M-16-71	M 70 342		
M-16-72	M 70 343		
M-16-73	M 70 344		
M-16-74	M 70 345		
M-16-78	M 70 302		
M-16-79	M 70 303		
M-16-85	M 70 304		
M-16-124	M 70 351		
M-16-130	M 70 305		
M-16-133	M 70 320		
M-16-141	M 70 306		
M-16-142	M 70 349		
M-16-143	M 70 368		
M-16-148	M 70 336		
M-16-159	M 70 307		
M-16-168	M 70 309		
M-16-171	M 70 310		
M-16-174	M 70 311		
M-16-175	M 70 312		
M-16-179	M 70 308		
M-16-187	M 70 313		
M-16-205	M 70 364		
M-16-206	M 70 365		
M-16-209	M 70 369		
M-16-210	M 70 347		
M-16-213	M 70 348		
M-16-219	M 70 314		
M-16-221	M 70 321		
M-16-224	M 70 370		
M-16-235	M 70 354		
M-16-241	M 70 371		
M-16-245	M 70 372		
M-16-251	M 70 366		
M-16-253	M 70 323		
M-16-259	M 70 355		

Preču zīmju īpašnieku rādītājs

(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs	(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs
ALP-LIQ SA	M-15-1299	ORKLA CONFECTIONERY	
ALTENERGY, SIA	M-16-142	& SNACKS LATVIJA, SIA	M-16-287
AMERIKAS TIRDZNIECĪBAS			M-16-288
PALĀTA LATVIJĀ, BIEDRĪBA	M-16-53		M-16-290
AMILI, SIA	M-15-1595	OZOLKALNS, SLĒPOŠANAS	
ART. LEBEDEV STUDIO, LLC	M-15-1656	UN ATPŪTAS PARKS, SIA	M-16-130
AS NŌO LIHATŌOSTUS	M-16-79	PERNOD RICARD	
BALBIINO AS	M-16-21	WINEMAKERS PTY LTD	M-15-1707
BALTĀ BURA, SIA	M-16-143	PISLEGINs Sergejs	M-16-206
BANKU AUGSTSKOLA	M-15-1736	SAVICKIS Aleksejs	M-15-1370
BIANKI Sigita	M-15-1675	SEFINANCE CREDIT, SIA	M-16-357
BML GROUP LIMITED	M-16-174	SIMPLY DELICIOUS, SIA	M-15-1788
	M-16-175	SKRĪVERU SALDUMI, SIA	M-16-253
BUŠA Katerīna	M-16-141	SKUDRA Māris	M-16-245
BŪVALTS R, SIA	M-16-171	SOFT-FX HOLDINGS LTD	M-16-739
CIDO GRUPA, SIA	M-16-148		M-16-740
	M-16-159	SOLEPHARM	
	M-16-179	PHARMACEUTICALS, SIA	M-16-133
	M-16-271	TECHNONICOL, ZAO	M-16-3
CIRCLE K LATVIA, SIA	M-15-857	VAGELIS Alberts	M-16-168
CITADELE BANKA, AS	M-16-263	VERY SPECIAL, SIA	M-16-259
	M-16-264	VIA SMS, SIA	M-16-19
	M-16-265	VR PACKING, SIA	M-16-219
DALANS, SIA	M-16-187		M-16-221
DLV, SIA	M-16-69	WALTON INTERNATIONAL LTD.	M-16-78
	M-16-70	X INFOTECH, SIA	M-15-1633
	M-16-71		
	M-16-72		
	M-16-73		
	M-16-74		
DOBELES DZIRNAVNIKS, AS	M-16-281		
DRILLER, SIA	M-16-205		
ECONOM CLASS, SIA	M-15-1354		
EKOLABORATORIJA,			
OBSCHESTVO S			
OGRANICHENNOY			
OTVETSTVENNOSTYU	M-15-1203		
ELEMENTOS TRADE LIMITED	M-15-1618		
ELETTO RIGA, SIA	M-16-224		
FLORENS			
INTERNATIONAL, SIA	M-16-85		
GRIGORIUS HOLDINGS, SIA	M-15-1108		
	M-15-1122		
	M-15-1124		
	M-15-1125		
	M-15-1333		
	M-15-1336		
	M-15-1369		
	M-15-1433		
	M-15-1557		
GRINDEKS, AS	M-16-782		
GRIPHARMA, SIA	M-16-209		
HEDGE CAPITAL COMPANY, SIA	M-16-241		
HINDUSTAN PENCILS			
PRIVATE LIMITED	M-15-1147		
INTERNATIONAL HOTEL			
OPERATOR COMPANY, SIA	M-16-124		
JOHNSON & JOHNSON	M-15-1227		
	M-15-1789		
LATVIJAS LOTO, VALSTS AS	M-15-1236		
LATVIJAS TELEVĪZIJA,			
VALSTS SIA	M-16-24		
LIEPA Zemgus	M-15-1206		
LIVONIA, SIA	M-16-251		
LOADER, SIA	M-16-210		
	M-16-213		
MILZUI, SIA	M-15-1602		
NATURA SIBERICA LTD.	M-16-63		
ND DOORS, SIA	M-16-350		
NOVARTIS AG	M-15-1729		
	M-15-1730		
	M-15-1731		
NOVOBALTIC, SIA	M-15-1703		
	M-15-1704		
OY HARTWALL AB	M-16-235		

Preču zīmju rādītājs pēc preču un pakalpojumu klasēm

(511) Nicas klasifikācijas indekss	(111) Reģistrācijas numurs	(511) Nicas klasifikācijas indekss	(111) Reģistrācijas numurs	(511) Nicas klasifikācijas indekss	(111) Reģistrācijas numurs
1	M 70 349	30	M 70 293	41	M 70 344
3	M 70 298		M 70 294		M 70 345
	M 70 324		M 70 317		M 70 359
	M 70 329		M 70 323		M 70 363
4	M 70 324		M 70 328	42	M 70 300
5	M 70 290		M 70 330		M 70 338
	M 70 291		M 70 331		M 70 349
	M 70 298		M 70 332	43	M 70 296
	M 70 314		M 70 333		M 70 310
	M 70 317		M 70 339		M 70 311
	M 70 320		M 70 353		M 70 339
	M 70 321	31	M 70 313		M 70 351
	M 70 325	32	M 70 307		M 70 352
	M 70 326		M 70 308		M 70 355
	M 70 327		M 70 336		M 70 367
	M 70 369		M 70 346	45	M 70 288
6	M 70 289		M 70 354		M 70 347
	M 70 310		M 70 366		M 70 348
	M 70 349		M 70 368		M 70 359
	M 70 356	33	M 70 297		M 70 373
7	M 70 349		M 70 354		M 70 374
9	M 70 288		M 70 368		M 70 375
	M 70 290	35	M 70 289		
	M 70 291		M 70 292		
	M 70 295		M 70 300		
	M 70 340		M 70 302		
	M 70 341		M 70 304		
	M 70 342		M 70 306		
	M 70 343		M 70 309		
	M 70 344		M 70 337		
	M 70 345		M 70 339		
	M 70 349		M 70 352		
	M 70 352		M 70 357		
	M 70 357		M 70 358		
	M 70 359		M 70 365		
	M 70 360		M 70 370		
	M 70 361	36	M 70 289		
	M 70 362		M 70 299		
	M 70 363		M 70 315		
10	M 70 290		M 70 316		
11	M 70 349		M 70 322		
16	M 70 287		M 70 359		
	M 70 290		M 70 371		
	M 70 362		M 70 373		
17	M 70 349		M 70 374		
	M 70 350		M 70 375		
19	M 70 289	37	M 70 289		
	M 70 349		M 70 349		
	M 70 350		M 70 364		
	M 70 356		M 70 365		
20	M 70 338	38	M 70 300		
	M 70 361		M 70 309		
21	M 70 298		M 70 359		
	M 70 324		M 70 362		
	M 70 339		M 70 363		
25	M 70 302	39	M 70 289		
	M 70 338		M 70 347		
	M 70 339		M 70 348		
	M 70 358	40	M 70 349		
	M 70 360	41	M 70 290		
	M 70 361		M 70 300		
	M 70 370		M 70 301		
28	M 70 340		M 70 305		
	M 70 341		M 70 309		
	M 70 342		M 70 311		
	M 70 343		M 70 312		
	M 70 344		M 70 335		
	M 70 345		M 70 337		
29	M 70 303		M 70 339		
	M 70 318		M 70 340		
	M 70 319		M 70 341		
	M 70 334		M 70 342		
	M 70 372		M 70 343		

Reģistrētie dizainparaugi

Šajā sadaļā Patentu valde turpina publicēt oficiālos paziņojumus par dizainparaugu reģistrācijām, kas veiktas atbilstoši 2004. gada 28. oktobra Dizainparaugu likumam. Publikācijas ir sakārtotas reģistrācijas numuru secībā. Katra publikācija satur datus, kas dizainparauga reģistrācijas brīdī iekļauti Dizainparaugu reģistra ziņās, kā arī dizainparauga attēlu vai attēlus.

Dizainparauga reģistrācija ir spēkā piecus gadus, skaitot no pieteikuma datuma. Šim termiņam beidzoties, reģistrāciju var atjaunot ikreiz uz jaunu piecu gadu periodu līdz dizainparauga aizsardzības maksimālajam termiņam – 25 gadiem no pieteikuma datuma (Dizainparaugu likums, 31. pants). Ar dienu, kad reģistrētais dizainparaugs publicēts (datums, kas norādīts katras lappuses augšmalā), pilnā apjomā stājas spēkā dizainparauga īpašnieka tiesības (Dizainparaugu likums, 12. pants).

Ar publikācijas dienu iestājas iebildumu periods. Iebilduma iesniegumu var iesniegt triju mēnešu laikā pēc publikācijas, pamatojoties uz Dizainparaugu likuma 37. panta pirmās daļas 1., 2., 4., 5., 6., 7. vai 8. punkta noteikumiem (Dizainparaugu likums, 28. pants; Rūpnieciskā īpašuma institūciju un procedūru likums, 60., 61. un 62. pants).

Starptautiski pieņemtie kodi (INID kodi), kas izmantoti dizainparaugu bibliogrāfisko datu identificēšanai:

- (11) Reģistrācijas numurs
Registration number
- (15) Reģistrācijas datums
Registration date
- (21) Pieteikuma numurs
Application number
- (22) Pieteikuma datums
Filing date of the application
- (23) Izstādes prioritātes dati
Exhibition priority data
- (28) Dizainparaugu skaits kompleksā reģistrācijā
Number of designs included (in case of multiple registration)
- (30) Konvencijas prioritātes dati:
pieteikuma numurs, pieteikuma datums, valsts kods
Convention priority data:
application number, filing date, code of country
- (46) Publikācijas atlikšanas termiņš
Deferment expiration term
- (51) Dizainparaugu starptautiskās klasifikācijas
(Lokarno klasifikācijas, saīs. LOC) indeksi: klase,
apakšklase
Indication of International Classification for Industrial
Designs (Locarno Classification – LOC): class, subclass
- (54) Izstrādājuma nosaukums / izstrādājumu nosaukumi
Indication of product(s) covered
- (58) Reģistrācijas grozījumu ieraksta datums (īpašumtiesību
pāreja, grozījumi vārdos, nosaukumos vai adresēs,
reģistrācijas darbības pārtraukšana u.tml.)
Date of recording of a transaction in respect of the
registration (change in ownership, change in name or
address, termination of protection, etc.)
- (62) Dati par sākotnējo pieteikumu, no kura šis pieteikums
nodalīts
Data of the initial application from which the present
application has been divided up
- (72) Dizainers / dizaineri, valsts kods
Designer(s), code of country
- (73) Īpašnieks / īpašnieki, adrese, valsts kods
Name and address of the owner(s), code of country
- (74) Patentpilnvarnieks vai cits pārstāvis, adrese
Patent attorney or other representative, address
- (78) Jaunais īpašnieks / jaunie īpašnieki, adrese, valsts kods
(īpašumtiesību maiņas gadījumā)
Name and address of the new owner(s), code of country
(in case of change in ownership)

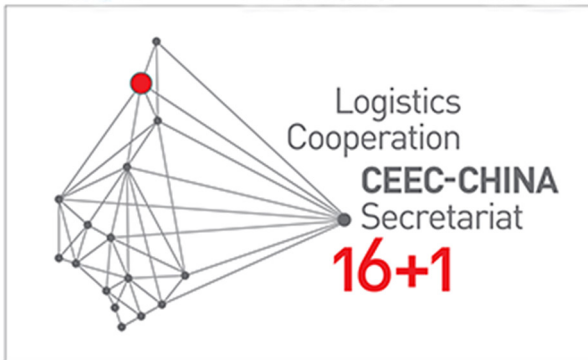
- (11) **Reģ. Nr.** D 15 630
- (15) **Reģ. dat.** 20.10.2016
- (21) **Pieteik. Nr.** D-16-31
- (22) **Pieteik.dat.** 17.05.2016
- (72) **Dizainers** Elita KADIĶE (LV)
- (73) **Īpašnieks** Elita KADIĶE; Raiņa iela 47-41, Jūrmala, LV-2011, LV
- (54) **TELPAS DEKORS**

1.01



- (11) **Reģ. Nr.** D 15 631 (15) **LOC kl.** 19-08, 32-00
(21) **Pieteik. Nr.** D-16-37 (15) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(72) **Dizainers** Guntars OŠENIEKS (LV) (22) **Pieteik.dat.** 26.07.2016
(73) **Īpašnieks** Guntars OŠENIEKS; Lienas iela 8-1, Rīga,
LV-1009, LV
(54) **LOGOTIPS**

1.01



- (11) **Reģ. Nr.** D 15 632 (51) **LOC kl.** 25-01
(21) **Pieteik. Nr.** D-16-42 (15) **Reģ. dat.** 20.10.2016
(72) **Dizainers** Gints BEIKULIS (LV) (22) **Pieteik.dat.** 15.08.2016
(73) **Īpašnieks** Gints BEIKULIS; "Veldzes", Sērenes pag.,
Jaunjelgavas nov., LV-5123, LV
(54) **CELTNIECĪBAS BLOKS**

1.01



GROZĪJUMI PATENTU REĢISTRĀ**Patenta īpašnieka maiņa**

(Patentu likuma 51. panta otrā daļa)

- (11) **EP 1883689**
 (73) AREVA ENERGIES RENOUVELABLES; 1 Place
 Jean Millier , Tour AREVA, 92400 Courbevoie, FR
 (74) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIAROBIT;
 Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
Ieraksts reģistrā: 29.09.2016

Patenta īpašnieka nosaukuma un adreses maiņa

(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

- (11) **EP 2032592**
 (73) Kuros Biosciences AG; Wagistrasse 25, 8952
 Schlieren, CH
Ieraksts reģistrā: 29.09.2016

Patenta īpašnieka nosaukuma maiņa

(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

- (11) **EP 1970465**
 (73) Viavi Solutions Inc; 430 N. McCarthy Boulevard,
 Milpitas, CA 95035, US
Ieraksts reģistrā: 29.09.2016

Patenta īpašnieka adreses maiņa

(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

- (11) **EP 2217577, EP 2585437**
 (73) Ardea Biosciences, Inc.; 9390 Towne Centre Drive,
 San Diego, CA 92121, US
Ieraksts reģistrā: 29.09.2016

- (11) **EP 2445526**
 (73) GlaxoSmithKline Biologicals S.A.; Rue de l'Institut, 89,
 1330 Rixensart, BE
 ID Biomedical Corporation of Quebec; 2323 Boul. du
 Parc Technologique, Ste Foy, Quebec G1P 4R8, CA
Ieraksts reģistrā: 29.09.2016

Patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu

(Patentu likuma 55. panta pirmās daļas 2. punkts)

Tiek norādīts patenta numurs un tā darbības termiņa beigu datums

LV 14022	07.02.2016
LV 14124	10.02.2016
LV 14126	09.02.2016
LV 14145	26.02.2016
LV 14311	14.02.2016
LV 14314	08.02.2016
LV 14315	08.02.2016
LV 14316	11.02.2016
LV 14319	18.02.2016
LV 14322	25.02.2016
LV 14332	28.02.2016
LV 14400	18.02.2016
LV 14501	06.02.2016
LV 14661	08.02.2016
LV 14663	27.02.2016
LV 14667	08.02.2016
LV 14726	22.02.2016
LV 14727	22.02.2016
LV 14740	20.02.2016
LV 14843	27.02.2016
LV 15048	20.02.2016

Eiropas patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu(Patentu likuma 73. panta pirmā daļa un
55. panta pirmās daļas 2. punkts)

Tiek norādīts patenta numurs un tā darbības termiņa beigu datums

EP 0881906	21.02.2016
EP 1026126	07.02.2016
EP 1056445	16.02.2016
EP 1058657	26.02.2016
EP 1159278	09.02.2016
EP 1261444	16.02.2016
EP 1263664	15.02.2016
EP 1263690	08.02.2016
EP 1263739	12.02.2016
EP 1338528	26.02.2016
EP 1361215	14.02.2016
EP 1362398	20.02.2016
EP 1368023	18.02.2016
EP 1370543	14.02.2016
EP 1377574	21.02.2016
EP 1410791	16.02.2016
EP 1476226	07.02.2016
EP 1482797	26.02.2016
EP 1482938	25.02.2016
EP 1490064	14.02.2016
EP 1594436	02.02.2016
EP 1713543	04.02.2016
EP 1745040	21.02.2016
EP 1757606	21.02.2016
EP 1826279	28.02.2016
EP 1848267	08.02.2016
EP 1848415	17.02.2016
EP 1849468	25.02.2016
EP 1851312	23.02.2016
EP 1855650	16.02.2016
EP 1855695	23.02.2016
EP 1855707	17.02.2016
EP 1856090	09.02.2016
EP 1873148	12.02.2016
EP 1982014	05.02.2016
EP 1982109	08.02.2016
EP 1982708	05.02.2016
EP 1987038	07.02.2016
EP 1988085	19.02.2016
EP 1988163	21.02.2016
EP 1989233	23.02.2016
EP 1993589	27.02.2016
EP 2060570	21.02.2016
EP 2069531	05.02.2016
EP 2070922	21.02.2016
EP 2074989	15.02.2016
EP 2093972	19.02.2016
EP 2095822	17.02.2016
EP 2114206	11.02.2016
EP 2118390	08.02.2016
EP 2120618	28.02.2016
EP 2121731	21.02.2016
EP 2125889	13.02.2016
EP 2126130	29.02.2016
EP 2127268	07.02.2016
EP 2131818	28.02.2016
EP 2199389	23.02.2016
EP 2242797	11.02.2016
EP 2254570	19.02.2016
EP 2258394	19.02.2016
EP 2289533	17.02.2016
EP 2293791	06.02.2016
EP 2300614	03.02.2016
EP 2351858	28.02.2016
EP 2363463	08.02.2016
EP 2393474	05.02.2016
EP 2393838	09.02.2016
EP 2394528	08.02.2016

EP 2398473	18.02.2016
EP 2398780	19.02.2016
EP 2401269	19.02.2016
EP 2465864	21.02.2016
EP 2476694	21.02.2016
EP 2490191	14.02.2016
EP 2531527	02.02.2016
EP 2542224	28.02.2016
EP 2542873	23.02.2016
EP 2562170	19.02.2016
EP 2623215	01.02.2016
EP 2628970	04.02.2016

Dizainparauga izslēgšana no reģistra (Dizainparaugu likuma 40. pants)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas beigu datums

D 10 597	13.03.2016
D 15 386	10.03.2016
D 15 389	18.03.2016

GROZĪJUMI PREČU ZĪMJU REĢISTRĀ

Zīmes reģistrācijas atjaunošana

(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
21. panta otrā daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

M 38 285	16.10.2016
M 39 759	28.06.2016
M 39 906	19.03.2016
M 39 907	19.03.2016
M 40 043	17.10.2016
M 40 086	12.12.2016
M 40 260	21.11.2016
M 40 443	19.12.2016
M 40 444	19.12.2016
M 40 445	19.12.2016
M 40 454	14.11.2016
M 40 505	14.10.2016
M 40 519	15.10.2016
M 40 530	16.10.2016
M 40 531	07.10.2016
M 40 532	13.12.2016
M 40 702	18.12.2016
M 40 786	11.12.2016
M 40 828	10.10.2016
M 40 862	17.12.2016
M 40 931	18.10.2016
M 40 949	10.12.2016
M 41 152	04.11.2016
M 41 339	26.09.2016
M 41 632	20.11.2016
M 41 727	19.11.2016
M 41 915	19.11.2016
M 56 834	25.04.2016
M 57 277	18.09.2016
M 57 417	01.12.2016
M 57 455	04.12.2016
M 57 480	26.09.2016
M 57 483	04.12.2016
M 57 484	04.12.2016
M 58 526	11.08.2016
M 58 538	20.10.2016
M 58 549	17.10.2016
M 58 600	23.10.2016
M 58 634	19.10.2016
M 58 636	21.11.2016
M 58 684	30.01.2017
M 58 764	11.10.2016
M 58 774	26.10.2016
M 58 776	27.10.2016
M 58 881	27.09.2016
M 58 884	06.10.2016
M 58 885	24.10.2016
M 58 921	04.10.2016
M 58 922	04.10.2016
M 58 946	27.12.2016
M 58 978	15.12.2016
M 59 085	30.11.2016
M 59 086	30.11.2016

Kļītas tiesība

(Patentu likuma 50. panta piektā daļa)

(11)	LV 14868
(73)	Igors JEVMEŅOVŠ; Vējavas iela 10 k-1-31, Rīga, LV-1035, LV
Komerckļītas ņēmējs:	
Reģionālā investīciju banka, AS; Jura Alunāna iela 2, Rīga, LV-1010, LV	
Komerckļītas reģistrācijas Nr.:	100175938
leraksts reģistrā:	29.09.2016

GROZĪJUMI PAPILDU AIZSARDZĪBAS SERTIFIKĀTU REĢISTRĀ

Papildu aizsardzības sertifikāta termiņa pārrēķins
atbilstoši EST nolēmumam lietā C-471/14
(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

(21)	C/LV2008/0003/z
(93)	20.09.2007
(94)	20.09.2022
(21)	C/LV2008/0005/z
(93)	14.07.2004
(94)	14.07.2019
(21)	C/LV2011/0011/z
(93)	20.05.2011
(94)	20.05.2026
(21)	C/LV2012/0017/z
(93)	25.04.2012
(94)	25.04.2027
(21)	C/LV2014/0032/z
(93)	30.04.2014
(94)	30.04.2029

GROZĪJUMI DIZAINPARAUGU REĢISTRĀ

Dizainparauga reģistrācijas atjaunošana

(Dizainparaugu likuma 31. pants, Pārejas noteikumu 7. punkts)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

D 10 255	04.10.2016
D 10 638	10.10.2016

M 59 096	26.01.2017
M 59 138	27.09.2016
M 59 139	27.09.2016
M 59 172	30.10.2016
M 59 259	13.10.2016
M 59 505	31.07.2016
M 61 454	15.09.2016

M 57 676	30.03.2016
M 57 692	23.03.2016
M 57 706	16.03.2016
M 57 715	17.03.2016
M 57 716	30.03.2016
M 57 722	20.03.2016
M 57 733	14.03.2016
M 57 734	14.03.2016
M 57 736	28.03.2016
M 57 758	07.03.2016
M 57 759	07.03.2016
M 57 760	16.03.2016
M 57 761	29.03.2016
M 57 762	30.03.2016
M 57 791	02.03.2016
M 57 792	02.03.2016
M 57 793	13.03.2016
M 57 815	30.03.2016
M 57 816	30.03.2016
M 57 817	30.03.2016
M 57 855	23.03.2016
M 57 856	23.03.2016
M 57 857	23.03.2016
M 57 858	23.03.2016
M 57 859	23.03.2016
M 57 860	23.03.2016
M 57 862	13.03.2016
M 57 875	14.03.2016
M 57 889	03.03.2016
M 57 890	03.03.2016
M 57 891	03.03.2016
M 57 898	07.03.2016
M 57 906	01.03.2016
M 57 907	07.03.2016
M 57 908	09.03.2016
M 57 909	09.03.2016
M 57 910	09.03.2016
M 57 912	15.03.2016
M 57 937	07.03.2016
M 57 938	07.03.2016
M 57 939	08.03.2016
M 57 941	21.03.2016
M 57 944	29.03.2016
M 57 974	03.03.2016
M 57 986	09.03.2016
M 57 988	23.03.2016
M 58 020	16.03.2016
M 58 028	29.03.2016
M 58 029	29.03.2016
M 58 032	28.03.2016
M 58 049	06.03.2016
M 58 050	06.03.2016
M 58 051	09.03.2016
M 58 053	29.03.2016
M 58 118	07.03.2016
M 58 119	17.03.2016
M 58 239	15.03.2016
M 58 240	15.03.2016
M 58 241	15.03.2016
M 58 323	09.03.2016
M 58 520	29.03.2016
M 58 547	02.03.2016
M 58 556	16.03.2016
M 58 643	21.03.2016
M 59 227	06.03.2016
M 59 386	14.03.2016

Zīmes reģistrācijas izslēgšana no reģistra(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
33. panta pirmā daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas beigu datums

M 35 205	14.03.2016
M 35 599	04.03.2016
M 38 356	20.03.2016
M 39 150	19.03.2016
M 39 151	19.03.2016
M 39 155	22.03.2016
M 39 344	25.03.2016
M 39 403	15.03.2016
M 39 406	18.03.2016
M 39 408	19.03.2016
M 39 409	19.03.2016
M 39 545	25.03.2016
M 39 547	29.03.2016
M 39 591	01.03.2016
M 39 592	01.03.2016
M 39 593	01.03.2016
M 39 597	01.03.2016
M 39 721	15.03.2016
M 39 723	25.03.2016
M 39 841	19.03.2016
M 39 892	14.03.2016
M 39 894	14.03.2016
M 39 895	14.03.2016
M 39 898	14.03.2016
M 40 063	06.03.2016
M 40 196	05.03.2016
M 40 200	06.03.2016
M 40 296	12.03.2016
M 40 356	01.03.2016
M 40 357	01.03.2016
M 40 361	12.03.2016
M 40 581	06.03.2016
M 41 134	12.03.2016
M 41 456	11.03.2016
M 41 791	01.03.2016
M 41 903	12.03.2016
M 43 201	04.03.2016
M 56 527	02.03.2016
M 56 529	03.03.2016
M 56 544	14.03.2016
M 56 585	22.03.2016
M 56 586	22.03.2016
M 56 587	27.03.2016
M 56 712	09.03.2016
M 56 809	03.03.2016
M 57 558	06.03.2016
M 57 600	15.03.2016
M 57 636	22.03.2016
M 57 659	17.03.2016
M 57 660	17.03.2016
M 57 661	17.03.2016
M 57 662	17.03.2016
M 57 663	17.03.2016
M 57 664	27.03.2016
M 57 665	27.03.2016
M 57 666	28.03.2016
M 57 673	20.03.2016
M 57 674	20.03.2016

Reģistrācijas atzīšana par spēkā neesošu
(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
19. pants)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas beigu datums

M 62 004 20.03.2010
M 68 239 20.01.2015

Reģistrācijas atzīšana par spēkā neesošu
(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
31. pants)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas beigu datums

M 66 731 20.11.2013
M 66 732 20.11.2013
M 66 733 20.11.2013
M 66 744 20.11.2013

Zīmes īpašnieka maiņa
(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
25. pants)

(111) **M 11 131, M 11 135, M 30 002, M 30 819, M 31 733, M 32 170, M 35 537, M 37 505, M 37 507, M 37 512, M 37 513, M 37 516, M 37 521, M 37 533, M 37 534, M 37 538, M 38 206, M 38 207, M 38 940, M 39 607, M 39 724, M 41 142, M 41 143, M 41 487, M 41 514, M 51 653, M 52 285, M 54 812, M 55 914, M 56 490**
(732) ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
(740) Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 27.09.2016

(111) **M 14 621, M 14 622, M 14 623, M 14 624, M 14 625, M 14 626, M 14 628, M 14 629, M 30 140, M 30 576, M 30 577, M 31 024, M 31 028, M 31 029, M 32 051, M 37 994, M 38 897, M 40 090, M 40 122, M 40 411, M 41 152, M 41 751, M 43 899, M 44 053, M 45 569, M 45 570, M 46 456, M 46 621, M 46 622, M 46 890, M 47 057, M 47 478, M 47 593, M 47 787, M 48 058, M 48 092, M 48 625, M 62 901, M 64 552**
(732) THE GILLETTE COMPANY LLC; One Gillette Park, Boston, MA 02127, US
(740) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(580) 29.09.2016

(111) **M 15 873**
(732) HENKEL AG & CO. KGAA; Henkelstraße 67, Düsseldorf, 40589, DE
(740) Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 05.10.2016

(111) **M 30 824**
(732) ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
(740) Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 03.10.2016

(111) **M 35 799**
(732) BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG; Ingelheim, 55218, DE
(740) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(580) 21.09.2016

(111) **M 37 620**
(732) OOO ALTAI HOLDING; ul. Chkalova, 57, Barnaul, Altaysky kray, 656049, RU
(740) Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 05.10.2016

(111) **M 37 976**
(732) AB VILNIAUS PERGALĒ; V. A. Graičiūno g. 26, Vilnius, LT-02241, LT
(740) Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 21.09.2016

(111) **M 38 285, M 39 747, M 39 755, M 39 756, M 39 762, M 40 011, M 40 019, M 40 519, M 40 530, M 44 634, M 44 636, M 53 090, M 53 536**
(732) ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
(740) Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 29.09.2016

(111) **M 41 614, M 46 062, M 46 816, M 60 021, M 60 023, M 60 024, M 60 026, M 60 027, M 63 781, M 63 835, M 63 836, M 63 837, M 63 838, M 63 839, M 63 840, M 63 841, M 63 842, M 63 843, M 64 453, M 66 458, M 67 711, M 67 712, M 67 927, M 68 292, M 68 818, M 69 479**
(732) ORKLA CONFECTIONERY & SNACKS LATVIJA, SIA; Miera iela 22, Rīga, LV-1001, LV
(740) Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2 - 2, Rīga, LV-1010, LV
(580) 29.09.2016

(111) **M 49 740, M 58 698, M 63 115, M 68 522, M 68 523, M 68 524, M 68 525, M 69 188**
(732) LSREF3 RIGA PLAZA, SIA; Krišjāņa Valdemāra iela 21-11, Rīga, LV-1010, LV
(580) 04.10.2016

(111) **M 52 007, M 54 494, M 61 158, M 61 159, M 61 160, M 61 509, M 63 995**
(732) SIMEKS, SIA; Ziemeļu iela 51, Ķekava, Ķekavas pag., Ķekavas nov., LV-2123, LV
(740) Baiba KRAVALE, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV
(580) 19.09.2016

(111) **M 55 237, M 69 339**
(732) Jeļena STRAHOVA; Pulkveža Brieža iela 7-219 C, Rīga, LV-1010, LV
(740) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(580) 03.10.2016

(111) **M 60 993**
(732) VĪNA STUDIJA, SIA; Maskavas iela 250, Rīga, LV-1063, LV
(580) 07.10.2016

(111) **M 62 440**
(732) Bruno BRIEDIS; Tērbatas iela 45-3, Rīga, LV-1011, LV
(580) 04.10.2016

(111) **M 63 471**
(732) Atis LIEPIŅŠ; Meža iela 13B, Salaspils, LV-2121, LV
(580) 16.09.2016

(111)	M 63 593	(111)	M 40 532
(732)	JOKER LĪZINGS, SIA; Katrīnas iela 12, Rīga, LV-1045, LV	(732)	ADI, SIA; Bauskas iela 58A - 2, Rīga, LV-1004, LV
(580)	12.10.2016	(580)	23.09.2016
(111)	M 64 617, M 64 618	(111)	M 40 702
(732)	SENTOR FARM APTIEKAS, AS; Mūkusalas iela 41b, Rīga, LV-1004, LV	(732)	WYETH HOLDINGS LLC; 235 East 42nd Street, New York, NY, 10017, US
(580)	27.09.2016	(580)	05.10.2016
(111)	M 68 052	(111)	M 50 252
(732)	VRK TRAVEL, SIA; Ciemupes iela 1-71, Rīga, LV-1024, LV	(732)	GLOBAL BEVERAGE INDUSTRIES PTE. LTD.; 50 Raffles Place, #32-01 Singapore Land Tower, Singapore, 048623, SG
(580)	12.10.2016	(580)	29.09.2016
(111)	M 68 070	(111)	M 57 481
(732)	RIGAAPARTMENT.COM, SIA; Ģertrūdes iela 129-1, Rīga, LV-1009, LV	(732)	Boriss ROMANOVSKIS; Zeltkalna iela 47-2, Daugavpils, LV-5421, LV
(740)	Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma "LATISS"; Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV	(580)	15.09.2016
(580)	03.10.2016	(111)	M 58 538
Zīmes īpašnieka nosaukuma maiņa			
(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm" 17. panta otrā daļa)			
(111)	M 40 609, M 40 610	(111)	M 58 774
(732)	HUAWEI TECHNOLOGIES CO., LTD.; Administration Building, Huawei Technologies Co., Ltd., Bantian, Longgang District, Shenzhen, CN	(732)	Z UN Z, SIA; Aleksandra Čaka iela 72 - 1, Rīga, LV-1011, LV
(580)	12.10.2016	(580)	29.09.2016
(111)	M 45 992, M 46 919, M 50 001, M 51 894, M 52 038	(111)	M 58 776
(732)	SONY INTERACTIVE ENTERTAINMENT INC.; 1-7-1 Konan, Minato-ku, Tokyo, JP	(732)	DOMMO, SIA; "Lapegles", Stūnīši, Olaines pagasts, Olaines novads, LV-2127, LV
(580)	15.09.2016	(580)	11.10.2016
(111)	M 58 636	(111)	M 58 946
(732)	AFFECTO OYJ; Atomitie 2b, Helsinki, FIN-00370, FI	(732)	WYETH LLC; 235 East 42nd Street, New York, NY, 10017, US
(580)	22.09.2016	(580)	05.10.2016
(111)	M 58 884	(111)	M 59 172
(732)	AS TKM KING; Betooni 14, Tallinn, 11415, EE	(732)	HYUNDAI CORPORATION; 25, Yulgok-ro 2-gil, Jongno-gu, Seoul, KR
(580)	12.10.2016	(580)	27.09.2016
(111)	M 63 899, M 63 900, M 63 901, M 63 979, M 64 601	(111)	M 59 228
(732)	DANON ROSSIYA, AKTSIONERNOE OBSHCHESTVO; ul. Vyatskaya, 27, korp. 13-14, 127015, Moskva, RU	(732)	DIAMEDICA, SIA; Augusta Deglava iela 66, Rīga, LV-1035, LV
(580)	15.09.2016	(580)	28.09.2016
(111)	M 64 237	Pārstāvja maiņa	
(732)	STREAMPAY, AS; Dzirnau iela 37-51, Rīga, LV-1010, LV	(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm" 17. panta otrā daļa)	
(580)	21.09.2016	(111)	M 16 639, M 60 778, M 62 471, M 62 962, M 62 963, M 63 407, M 63 650, M 63 911, M 64 152, M 64 477, M 64 965, M 65 120, M 65 472, M 65 498, M 65 499, M 68 819, M 68 820
Zīmes īpašnieka adreses maiņa			
(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm" 17. panta otrā daļa)			
(111)	M 40 086	(740)	Anda BRIEDE, Patentu aģentūra "KDK"; Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV
(732)	OLD NAVY (ITM) INC.; 2 Folsom Street, San Francisco, CA 94105, US	(580)	12.10.2016
(580)	27.09.2016	(111)	M 68 348, M 69 924, M 69 966
(111)	M 40 260	(740)	Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma "METIDA"; Krišjāņa Barona iela 119-19, Rīga, LV-1012, LV
(732)	SYNGENTA LIMITED; Syngenta, Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire, RG42 6EY, GB	(580)	28.09.2016
(580)	30.09.2016		

Grozījumi preču sarakstā(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
17. panta otrā daļa)

(111) (511)	M 69 509 9	datori; datoru programmatūra; datoru palīgierīces; elektroniskās datu apstrādes ierīces; datortīklu aparatūra; visu iepriekšminēto preču daļas un piederumi; neviena no iepriekš minētajām precēm neattiecas uz mehāniskajiem transportlīdzekļiem, it īpaši visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	12	vieglās automašīnas un motocikli; neviena no iepriekš minētajām precēm neattiecas uz visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	16	iespiedprodukcija; grāmatas, nošu grāmatas, mūzikas partitūras; žurnāli; fotogrāfijas; rakstāmpiederumi; neviena no iepriekš minētajām precēm neattiecas uz mehāniskajiem transportlīdzekļiem, it īpaši visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	21	stikla izstrādājumi; mājturības un virtuves piederumi, trauki; glāzes un krūzes; paliktņi mājturības nolūkiem; pusdienu kārbīņas; papīra šķīvji; krājkasītes; māla, porcelāna un keramikas izstrādājumi; dekoratīvas figūriņas, statujas un mākslas darbi, kas ietverti šajā klasē; neviena no iepriekš minētajām precēm neattiecas uz mehāniskajiem transportlīdzekļiem, it īpaši visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	25	apģērbī, apavi un galvassegas; peldkostīmi; sporta un brīvā laika apģērbī; neviena no iepriekš minētajām precēm neattiecas uz mehāniskajiem transportlīdzekļiem, it īpaši visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	28	rotaļlietas; spēles, galda spēles, elektroniskās spēles; videospēles un datorspeles; neviena no iepriekš minētajām precēm neattiecas uz mehāniskajiem transportlīdzekļiem, it īpaši visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	41	televīzijas šovu un filmu veidošana un izplatīšana; televīzijas programmu veidošana; nelejuplādējama filmu un televīzijas programmu nodrošināšana; neviena no iepriekš minētajiem pakalpojumiem neattiecas uz mehāniskajiem transportlīdzekļiem, it īpaši visurgājējiem un pilnpiedziņas transportlīdzekļiem	(580)	21.09.2016
----------------	----------------------	--	----	---	----	--	----	---	----	--	----	--	----	--	-------	------------

Ķīlas tiesība(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
25.¹ pants)

(111) (732)	M 52 306 SUSHI POINT, SIA; Palasta iela 10, Rīga, LV-1050, LV	Komerckīlasņēmējs: RIETUMU BANKA, AS; Vesetas iela 7, Rīga, LV-1013, LV Komerckīlasreģistrācijas Nr. 100160451 Komerckīlasņēmējam ir tiesības pārdot ieķīlāto mantu bez izsoles. Aizliegts atkārtoti ieķīlāt komerckīlas priekšmetu.	(580)	09.09.2016
(111) (732)	M 52 839 SUSHI POINT, SIA; Palasta iela 10, Rīga, LV-1050, LV		(580)	

Komerckīlasņēmējs: RIETUMU BANKA, AS; Vesetas iela 7, Rīga, LV-1013, LV
Komerckīlasreģistrācijas Nr. 100160451
Komerckīlasņēmējam ir tiesības pārdot ieķīlāto mantu bez izsoles. Aizliegts atkārtoti ieķīlāt komerckīlas priekšmetu.
(580) 09.09.2016(111)
(732) **M 56 453**
KANTINA, SIA; Palasta iela 10, Rīga, LV-1050, LV
Komerckīlasņēmējs: RIETUMU BANKA, AS; Brīvības iela 54, Rīga, LV-1011, LV
Ķīlas pārvaldnieks: RIETUMU BANKA, A/S, Brīvības iela 54, Rīga, LV-1011, LV
Dokuments, kas apliecina ķīlas tiesības: Līgums Nr. 321-2/2006; Līguma grozījumi Nr. 1
Darbības laiks: no 22.08.2007 līdz saistību izpildei
Ķīlas tiesības dzēšanas datums: 02.02.2016
(580) 02.02.2016(111)
(732) **M 57 109**
SUSHI POINT, SIA; Palasta iela 10, Rīga, LV-1050, LV
Komerckīlasņēmējs: RIETUMU BANKA, AS; Vesetas iela 7, Rīga, LV-1013, LV
Komerckīlasreģistrācijas Nr. 100160451
Komerckīlasņēmējam ir tiesības pārdot ieķīlāto mantu bez izsoles. Aizliegts atkārtoti ieķīlāt komerckīlas priekšmetu.
(580) 09.09.2016(111)
(732) **M 57 487**
SUSHI POINT, SIA; Palasta iela 10, Rīga, LV-1050, LV
Komerckīlasņēmējs: RIETUMU BANKA, AS; Vesetas iela 7, Rīga, LV-1013, LV
Komerckīlasreģistrācijas Nr. 100160451
Komerckīlasņēmējam ir tiesības pārdot ieķīlāto mantu bez izsoles. Aizliegts atkārtoti ieķīlāt komerckīlas priekšmetu.
(580) 09.09.2016**Licences**(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
26. pants)(111)
(732) **M 53 465**
LĪNA LOĢISTIKA, SIA; Buļļu iela 47a, Rīga, LV-1067, LV
(791) RODOZA TRADING LIMITED; 69 Arch. Makariou III Ave., TLAIS TOWER, office 301, Nicosia, 1070, CY
Licences veids: vienkārša licence
Licences darbības laiks: no 03.10.2016 līdz brīdim, kad Puses vienojas par Licences līguma darbības izbeigšanu
(580) 03.10.2016(111)
(732) **M 53 467**
LĪNA LOĢISTIKA, SIA; Buļļu iela 47a, Rīga, LV-1067, LV
(791) RODOZA TRADING LIMITED; 69 Arch. Makariou III Ave., TLAIS TOWER, office 301, Nicosia, 1070, CY
Licences veids: vienkārša licence
Licences darbības laiks: no 03.10.2016 līdz brīdim, kad Puses vienojas par Licences līguma darbības izbeigšanu
(580) 03.10.2016(111)
(732) **M 57 751**
UŽDAROJI AKCINĒ BENDROVĒ 'BITĒ LIETUVA'; Žemaitės g. 15, Vilnius, 03504, LT
(791) BITE LATVIJA, SIA; Dunties iela 17a, Rīga, LV-1005, LV

Licences veids: vienkārša licence
 Licences darbības laiks: no 03.11.2006 līdz
 27.01.2016
 Licences darbības izbeigšanas datums: 27.01.2016
 (580) 27.01.2016

(111) **M 66 462**
 (732) LĪNA LOĢISTIKA, SIA; Buļļu iela 47a, Rīga,
 LV-1067, LV
 (791) RODOZA TRADING LIMITED; 69 Arch. Makariou III
 Ave., TLAIS TOWER, office 301, Nicosia, 1070, CY
 Licences veids: vienkārša licence
 Licences darbības laiks: no 03.10.2016 līdz brīdim,
 kad Puses vienojas par Licences līguma darbības
 izbeigšanu
 (580) 03.10.2016

Zīmes elementu maiņa

(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
 17. panta otrā daļa)

(111) **M 69 489**
 (540)



(580) 05.10.2016
 (540) RĪGA Dance COMPETITION

Labojumi

(likuma "Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm"
 17. panta otrā daļa)

(111) **M 69 835**
 (230) dzēsts ieraksts par izstādes prioritāti
 (580) 13.10.2016

Pamanīto kļūdu labojums oficiālajā izdevumā 8/2016

1348. lappuse, Zīmes reģistrācijas izslēgšana no reģistra, otrā sleja
jābūt:

M 56 087 ... M 56 094 – *kā publicēts*

M 56 095 25.01.2016

M 56 096 *un tālāk – kā publicēts*

Pamanīto kļūdu labojums oficiālajā izdevumā 9/2016

1510. lappuse, Grozījumi Patentu reģistrā, pirmā sleja, sadaļa
"Patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu"

jābūt:

Patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu
(Patentu likuma 55. panta pirmās daļas 1. punkts)

Tiek norādīts patenta numurs un tā darbības termiņa beigu datums

LV 14446 05.09.2016

un tālāk – kā publicēts

1510. lappuse, Grozījumi Patentu reģistrā, pirmā sleja, sadaļa
"Patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu (Patentu likuma
55. panta pirmās daļas 2. punkts)"

svītrojams ieraksts:

LV 12830 17.01.2016

Atbildīgā par izdevumu R. Lāce
Izdevuma reģistrācijas Nr. 000701174