

# PATENTI

## un preču zīmes

LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES OFICIĀLAIS IZDEVUMS

12 / 2013

The Official Gazette of the Patent Office of the Republic of Latvia - "Patenti un preču zīmes" - 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 - December 20, 2013.

Latvijas Republikas Patentu valde

Citadeles iela 7/70, Rīga, LV - 1010  
a/k 41, Rīga, LV - 1010  
LATVIJA

Tālrunis: 67 099 600

Fakss: 67 099 650

E-pasts: [valde@lrpv.gov.lv](mailto:valde@lrpv.gov.lv)

Mājaslapa: <http://www.lrpv.gov.lv>

Patent Office of the Republic of Latvia

7/70 Citadeles iela, Rīga, LV - 1010  
P.O. Box 41, Rīga, LV - 1010  
LATVIA

Phone: 371 67 099 600

Fax: 371 67 099 650

E-mail: [valde@lrpv.gov.lv](mailto:valde@lrpv.gov.lv)

Website: <http://www.lrpv.gov.lv>

# PATENTI un PREČU ZĪMES

LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES OFICIĀLAIS IZDEVUMS

Latvijas Republikas Patentu valde, Rīga, Citadeles ielā 7/70  
Pasta adrese: a/k 41, Rīga, LV-1010, Latvija  
Tālrunis 67 099 600 Fakss 67 099 650

**12/2013**  
**20.decembris**

1785. - 2007. lappuse

## S A T U R S

### IZGUDROJUMI

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas .....1786

Izgudrojumu patentu publikācijas .....1793

Attiecināto Eiropas patentu publikācijas  
(LR Patentu likuma 19. panta 2. un 4. daļa) .....1796

Attiecināto Eiropas patentu publikācijas  
(LR Patentu likuma 19. panta 3. daļa) .....1804

Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas  
(LR Patentu likuma 71. panta 5. daļa) .....1805

Papildu aizsardzības sertifikāti .....1962

Pieteicēju, izgudrotāju un īpašnieku  
alfabētiskais rādītājs .....1963

Izgudrojumu pieteikumu un patentu  
numuru rādītājs .....1965

### PREČU ZĪMES

Reģistrētās preču zīmes .....1966

Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs .....1985

Preču zīmju īpašnieku rādītājs .....1986

Preču zīmju rādītājs pēc preču un  
pakalpojumu klasēm .....1987

### DIZAINPARAUGI

Reģistrētie dizainparaugi .....1988

Dizainparaugu pieteikumu numerācijas rādītājs ...1991

Dizaineru un dizainparaugu īpašnieku  
alfabētiskais rādītājs .....1992

Dizainparaugu rādītājs pēc Lokarno  
klasifikācijas klasēm .....1993

### GROZĪJUMI VALSTS REĢISTROS

Grozījumi Patentu reģistrā .....1994

Grozījumi Valsts dizainparaugu reģistrā .....1994

Grozījumi Valsts preču zīmju reģistrā .....1994

Pamanīto kļūdu labojums .....2001

Patentpilnvaroto saraksts .....2002

## C O N T E N T S

### INVENTIONS

Publication of Patent Applications .....1786

Publication of Invention Patents .....1793

Publication of Extended European Patents  
(Patent Law, Article 19, Paragraphs 2 and 4) ... 1796

Publication of Extended European Patents  
(Patent Law, Article 19, Paragraph 3) .....1804

Publication of European Patents Validated in Latvia  
(Patent Law, Article 71, Paragraph 5) .....1805

Supplementary Protection Certificates .....1962

Name Index of Applicants, Inventors and  
Owners .....1963

Application and Patent Number Index  
of Inventions .....1965

### TRADEMARKS

Registered Trademarks .....1966

Application Number Index of Trademarks .....1985

Name Index of Trademark Owners .....1986

Trademark Registrations Listed by Classes of  
Goods and Services .....1987

### INDUSTRIAL DESIGNS

Registered Industrial Designs .....1988

Application Number Index of Industrial Designs ...1991

Name Index of Designers and Owners of  
Industrial Designs .....1992

Industrial Designs Listed by Classes of  
Locarno Classification .....1993

### CHANGES IN THE STATE REGISTERS

Changes in the Patent Register .....1994

Changes in the Industrial Designs Register .....1994

Changes in the Trademarks Register .....1994

Correction of Mistakes .....2001

List of Patent Attorneys .....2002

Publikācijas par patenta pieteikumiem ir sakārtotas Starptautiskās patenta klasifikācijas (IPC) indeksu kārtībā. Starp svītrām ir izdalītas klases, kuras dotajam patentam nav pamatklase un, kur kreisajā pusē pēc uzrādītās klases izceltā šriftā uzrādīts patenta numurs, uz kuru attiecas dotā klase, kā arī labajā pusē pamatklases indekss. Publikācijas patentiem sakārtotas dokumenta numura 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.  
Application 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) **Izgdrojuma 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 izsniegšanas datums Eiropas Savienībā.  
Number and date of marketing authorization in the European Union.

- (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.

## Izgdrojumu pieteikumu publikācijas

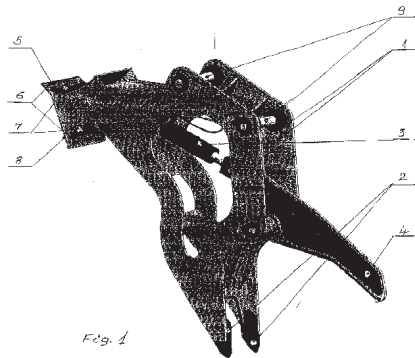
### A sekcija

**A01B13/00 14769**

- (51) **A01B49/04 (11) 14769 A**  
**A01G23/06**  
**A01B13/00**
- (21) P-13-113 (22) 01.08.2013
- (41) 20.12.2013
- (71) LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS 'SILAVA'; Rīgas iela 111, Salaspils, Salaspils nov. LV-2169, LV
- (72) Andis LAZDIŅŠ (LV),  
Valentīns LAZDĀNS (LV),  
Igoris GUSAREVS (LV),  
Agris ZIMELIS (LV),  
Ervīns KURMIS (LV),  
Vjačeslavs DMITRIJENKO (LV),  
Dagnija LAZDIŅA (LV)
- (74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV
- (54) **MULTIFUNKCIONĀLA IEKĀRTA CELMU RAUŠANAI-PLĒŠANAI AR PACILVEIDA STĀDVĪETU VEIDOŠANU**  
**MULTIFUNCTIONAL DEVICE FOR STUMP EXTRACTION AND SPLIDING AND SCARIFICATION OF SOIL USING MOUNDING METHOD**
- (57) Izgdrojums attiecas uz mežsaimniecības nozari un paredzēts koku celmu raušanai – plēšanai, kā arī vienlaicīgai pacilveida stādvietu veidošanai meža izcirtumos un mērķtiecīgai meža atjaunošanai ar stādīšanas paņēmieni. Izgdrojums ir multifunkcionāla iekārta, ar kuru meža izcirtumos, vienā piebraucienā, vienlaicīgi iespējams veikt celmu raušanu – plēšanu un veidot pacilveida stādvietas meža atjaunošanai atcelmotajā platībā. Piedāvātā iekārta ir izveidota uz kopēja iekārtas korpusa (1), kura vienā galā izvietoti celmu raušanas žokļi (2) un ar hidrocilindru (3) pievienots celmu plēšanas pretnazis (4), korpusa pretējā galā izvietota divpusējas darbības pacilveida stādvietu veidošanas iekārta (5), kas sastāv no augsnes plastā griezējnažiem (6), izgriezto velēnu vērtuvēm (7) un izveidoto stādvietu (pacilu) piespiedējlātnes (8), korpusam augšējā daļā izvietotas bultas (9), ar kurām iekārtu pievieno ekskavatoram.

The invention applies to the forestry and the multifunctional excavator bucket is developed for extraction and splitting of stumps in clear-felling sites with ability of simultaneous scarification of soil using mounding method in forest regeneration. The invention is a multifunctional device consisting of common frame (1) with attached stump extraction and splitting device with jaws (2) and with hydraulic cylinder (3) powered splitting knife (4) at one end and with soil scarification (mounding) unit (5) consisting of main working plate (6), cutting knives (7) and moldboards (8) mounted at the other end of the common frame. Mounting fingers (9) to attach the device to the excavator are located at the top of the common frame.





- (51) **A01F29/04** (11) **14770 A**  
**A01F29/06**  
**A01F29/08**  
 (21) P-13-107 (22) 25.07.2013  
 (41) 20.12.2013  
 (71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;  
 Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV  
 (72) Aivars KAČĪTIS (LV),  
 Dainis ANCĀNS (LV),  
 Imants NULLE (LV)  
 (54) **STIEBRU MATERIĀLU DOZATORS-GARUMOTĀJS**  
**STRAW MATERIAL CROSS-CUTTER WITH MASS**  
**SUPPLY REGULATION**

(57) Izgdrojums attiecas uz lauksaimniecības produkcijas pārstrādes iekārtām un ir izmantojams stiebru materiālu (niedru, salmu, kaņepju) sagarumošanai noteikta garuma daļās un sagarumotās masas padeves regulēšanai. Izgudrotais garumotājs sastāv no diviem rotoriem (1), ar izgriezumos nostiprinātiem nažiem (2), smalcināmā materiāla (3) padeves rulljiem (4) un izvadkanāla (5). Naži (2) ir nostiprināti uz diviem sinchroni pretējos virzienos rotējošiem rotoriem (1) un uz nažu (2) plāksnēm ir izveidoti slīpā leņķī novietoti pretgriezēji (6), lai uzlabotu šķiedras saturošu materiālu nogriešanu. Materiāla padevi nodrošina rullji (4) ar elastīga materiāla pārklājumu, kuru virsmas lineārais ātrums ir mazāks par nažu asmens kustības ātrumu. Garumotājs izmantojams galvenokārt stiebru biomasas sagarumošanai noteikta izmēra daļās un to dozētas padeves nodrošināšanai biomasas kurināmā briķešu ražošanā.

The invention relates to the agricultural production and the processing equipment is used for the straw materials (reed, straw, hemp) cutting in certain lengths and regulation of the crushed mass supply. Invented cross-cutter consisting of two rotors (1), with cut-outs attached blades (2) shredded material (3) feed rollers (4) and outlet (5). Knives (2) are mounted on two synchronously in opposite directions rotating rotors (1) and on knives (2) plates are created at an oblique angle positioned shearbars (6) to improve the fiber-containing material cutting. Material is fed to the rollers (4) with a flexible material coating, whose surfaces linear velocity is less than the cutting blade speed. The cutter is mainly used for cross-cutting of stalk biomass in certain parts and dosed supply for biomass fuel briquettes production.

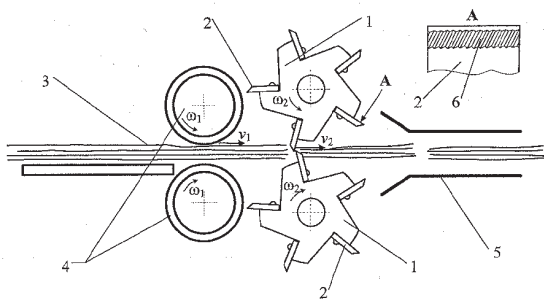


Figure 1

**A01F29/06** **14770**  
**A01F29/08** **14770**

- (51) **A01G23/06** (11) **14771 A**  
 (21) P-13-106 (22) 25.07.2013  
 (41) 20.12.2013  
 (71) LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS 'SILAVA';  
 Rīgas iela 111, Salaspils, Salaspils nov. LV-2169, LV  
 (72) Andis LAZDIŅŠ (LV),  
 Dagnija LAZDIŅA (LV)  
 (54) **PILNVEIDOTA ATCELMOŠANAS TEHNOĻĢIJA EĢĻU**  
**IZCIRTUMOS AUGLĪGOS MEŽA TIPOS, SAGLABĀJOT**  
**KOKMATERIĀLU TREILĒŠANAS CEĻUS**  
**IMPROVED STUMP EXTRACTION TECHNOLOGY FOR**  
**SPRUCE CLEAR-FELLING SITES ON FERTILE SOILS**  
**PRESERVING EXISTING STRIP-ROADS**

(57) Izgdrojums attiecas uz mežsaimniecībā pielietojamām tehnoloģijām. Piedāvāta atcelmošanas tehnoloģija, kas paredzēta meža atjaunošanas uzlabošanai eĢļu izcirtumos auglīgos meža tipos, saglabājot kokmateriālu treilēšanas ceļus.

The invention refers to the technologies applied in the forest management. The provided stump extraction technology is developed to improve forest regeneration quality in spruce clear-felling sites on fertile soils without damaging strip-roads.

**A01G23/06** **14769**

- (51) **A23K1/14** (11) **14772 A**  
**A23K1/165**  
 (21) P-12-86 (22) 30.05.2012  
 (41) 20.12.2013  
 (71) SIGRA, Biotehnoloģijas un veterinārmedicīnas zinātniskais institūts, LLU aģentūra; Institūta iela 1, Peltes, Siguldas pag., Siguldas nov. LV-2150, LV  
 (72) Aleksandrs JEMELJANOVŠ (LV),  
 Anda VALDOVSKA (LV),  
 Imants JANSONŠ (LV),  
 Inese ŽĪTARE (LV),  
 Vita ŠTERNA (LV),  
 Biruta LUJĀNE (LV)  
 (54) **PREBIOTIKAS TOPINAMBŪRA PULVERA HELIANTHUS**  
**TUBEROSUS UN PROBIOTIKAS PEDIOCOCCUS PEN-**  
**TOSACEUS PIEDEVAS SATUROŠS SASTĀVS NOBA-**  
**ROJAMĀM CŪKĀM**  
**THE COMPOSITION OF PRE-MIXTURE CONTAINING**  
**HELIANTHUS TUBEROSUS POWDER AND PROBIOT-**  
**ICS PEDIOCOCCUS PENTOSACEUS FOR THE FEEDER**  
**PIGS**

(57) Izgdrojums attiecas uz lauksaimniecību. Izstrādātā sausas pulverveida formas piedeva satur sekojošu kombināciju maisījumu: topinambūra pulveri *Helianthus tuberosus* un *Pediococcus pentosaceus* kultūru. Piedāvātās prebiotikas topinambūra pulvera *Helianthus tuberosus* un prebiotikas *Pediococcus pentosaceus* sastāvs ir cūku barības sastāvdaļa, ko pievieno pilnvērtīgai cūku barībai. Piedevu pielieto gan konvencionālās, gan bioloģiskās lauksaimniecības saimniekošanas sistēmās, lai paaugstinātu nobarojamo cūku produktivitātes līmeni. Piedevas pielietošanas rezultātā palielinās cūku dzīvmasa vidēji par 23,6 % un samazinās barības patēriņš 1 kg dzīvmasas ražošanai vidēji par 13,6 %, paaugstinās gremošanas trakta labvēlīgā *Lactobacillus* ģints mikroflora par 0,5 lg kvv g<sup>-1</sup>. Piedevu pievieno cūku barībai no 30 līdz 65 dienu vecumam: 3 % no kopējā barības daudzuma topinambūra pulveris + 1 g *Pediococcus pentosaceus* kultūru. Piedevu kā barības sastāvdaļu var izmantot lopbarības ražošanas uzņēmumi, cūkkopības saimniecības, individuālie cūku audzētāji u.c.

The invention pertains to agriculture. The pre-mixture formulated, having a form of powder, contains the mixture of following combinations: powder of Jerusalem artichoke *Helianthus tuberosus* and

culture of *Pediococcus pentosaceus*. The composition of the pre-mixture formulated consisting of the Jerusalem artichoke (*Helianthus tuberosus*) powder and prebiotics *Pediococcus pentosaceus* is an ingredient of the pig feed added to total mixed ration. The pre-mixture can be used both, in organic and conventional farming systems with the purpose of increasing the productivity level of feeder pigs. As the result of applying this pre-mixture, the live weight of pigs is increased by 23.6 % on the average and the amount of feed utilised for production of 1 kg of live weight decreased by 13.6 % on the average while the micro flora of genus *Lactobacillus*, favourable to digestive tract increased by 0.5 lg kvv g<sup>-1</sup>. The pre-mixture can be added to feed of pigs from 30 to 65 days of age in a dose of 3 % Jerusalem artichoke powder of the total amount of feed + 1 g *Pediococcus pentosaceus* culture. This pre-mixture as a feed ingredient can be used by feed producing establishments, pig farms, individual pig producers, etc.

- (51) **A23K1/14** (11) **14773 A**  
A23K1/165  
(21) P-12-87 (22) 30.05.2012  
(41) 20.12.2013  
(71) SIGRA, Biotehnoloģijas un veterinārmedicīnas zinātniskais institūts, LLU aģentūra; Institūta iela 1, Peltas, Siguldas pag., Siguldas nov. LV-2150, LV  
(72) Aleksandrs JEMEĻJANOVŠ (LV), Vera KRASIŅA (LV), Ināra KONOŠONOKA (LV), Anda VALDOVSKA (LV), Īra-Īrēna VĪTIŅA (LV), Inese ZĪTARE (LV)  
(54) **TOPINAMBŪRA PULVERA UN LACTOBACILLUS REUTERI PIEDEVAS KOMBINĀCIJAS IZMANTOŠANA BROILERCĀĻU PRODUKTIVĪTĒS PAAUGSTINĀŠANAI APPLICATION OF JERUSALEM ARTICHOKE POWDER AND LACTOBACILLUS REUTERI COMBINATION AS FEED ADDITIVE FOR PRODUCTIVITY INCREASE OF THE BROILER CHICKS**  
(57) Izgdrojums attiecas uz lauksaimniecības nozarēm: lopkopību (putnkopību) un topinambūra sakņu pulvera ražošanu. Patenta aizsardzības objekts ir topinambūra sausās pulverveida piedevas sastāvs un daudzums. Zinātniski izstrādātā sausā pulverveida formas piedeva satur sekojošu maisījuma kombināciju: prebiotikas topinambūra pulveri *Helianthus tuberosus* un probiotikas *Lactobacillus reuteri* kultūru. Lietojot zinātniski izstrādātās topinambūra pulvera *Helianthus tuberosus* un *Lactobacillus reuteri* kombināciju devas broilercāļu ēdināšanā: tika paaugstināta iegūtās gaļas kvalitāte – holesterīna līmenis broilercāļu gaļā samazinājās par 19,7 mg/%. Broilercāļu produktivitāte paaugstinājās par 3,9 %. Prebiotikas topinambūra pulvera *Helianthus tuberosus* un probiotikas *Lactobacillus reuteri* kombināciju devas var izmantot broilercāļu barības ražotāju uzņēmumi, lai nodrošinātu putnkopības saimniecības un individuālos putnu audzētājus ar putnu barību, kuru lietojot paaugstinās broilercāļu produktivitāte un gaļas kvalitāte, kā arī tiek uzlabota to zarnu trakta mikroflora.

The invention pertains to the following sub-sectors of agriculture: animal production (poultry farming) and production of powder obtained from roots of Jerusalem artichoke. The object covered by the patent protection is composition and dose of the dry powder additive sourced from Jerusalem artichoke. The scientifically formulated additive in the form of dry powder contains the following combination of premixtures: prebiotics as powder of Jerusalem artichoke (*Helianthus tuberosus*) and probiotics: culture of *Lactobacillus reuteri*. Applying the scientifically formulated doses consisting of a combination of powder from *Helianthus tuberosus* and *Lactobacillus reuteri*, the quality of the obtained meat was improved – the cholesterol level in broiler meat dropped by 19.7 mg/% while the productivity of broiler chicks increased by 3.9 %. The doses of Jerusalem artichoke (*Helianthus tuberosus*) powder in combination with *Lactobacillus reuteri* can be used by mixed broiler feed producers in order to provide poultry feed to broiler production farms and individual poultry farmers capable of

increasing the productivity of broilers and quality of meat, as well as improvement of the digestive tract micro-flora.

**A23K1/165 14772**  
**A23K1/165 14773**

- (51) **A23L1/08** (11) **14774 A**  
**A61K36/18**  
(21) P-12-102 (22) 20.06.2012  
(41) 20.12.2013  
(71) Smaida PĒRKONE; Aglonas iela 27-54, Rīga LV-1057, LV; Kārlis PĒRKONS; 'Grūzupes', Galgauskas pag., Gulbenes nov. LV-4428, LV  
(72) Smaida PĒRKONE (LV), Kārlis PĒRKONS (LV)  
(74) Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS Latvija; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050, LV  
(54) **BIOĻĪSĪKI AKTĪVO PRODUKTU KOMPOZĪCIJA UN TĀS IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS COMPOSITION OF BIOLOGICALLY ACTIVE PRODUCTS AND A METHOD FOR PREPARATION THEREOF**  
(57) Izgdrojums attiecas uz medicīnas, pārtikas rūpniecības un kosmētikas nozarēm un var tikt izmantots bioloģiski aktīvo produktu iegūšanai uz bišu medus un ārstniecības augu bāzes, kā bioloģiski aktīvos ārstniecības augus izmantojot piparmētru, melisu, asinszāli, pelašķu, vīgriežu, kliņģerīšu u.c. augu materiālus. Bioloģiski aktīvas kompozīcijas iegūšanas paņēmiens ietver substrāta jeb ārstnieciskā augu materiāla termisku apstrādi, kā ekstraktu izmantojot medu, bet kā substrātu izmantojot ārstnieciskos augus: piparmētras, melisas, kumelītes, pelašķus, asinszāles (divšķautnaino), kliņģerītes, vīgriezes. Minētos substrātus samitrina un ievieto māla vai emaljas traukā, trauku noslogo un sutina 45°C temperatūrā 12 stundas, pēc sutināšanas substrātu izžāvē. Bioloģiski aktīva kompozīcija, kas satur medu un ārstnieciskos augus, kā arī papildus satur vismaz vienu termiski apstrādātu ārstniecības augu.

This invention concerns medical, food and cosmetic industries and can be used to get biologically active products that are bee honey-based and medicinal plant-based, using such biologically active medicinal plants as peppermint, balm mint, St. John's Wort, common yarrow, meadowsweet, calendula and materials from other plants. The method used for getting biologically active composition includes heat treatment of substratum or medicinal plants material using honey as an extractive and as substratum using the medicinal plants: peppermint, balm mint, chamomile, common yarrow, St. John's Wort (*Hypericum perforatum*), calendula, meadowsweet. The mentioned substratum is moistened and placed into a clay container or enamelware, the container is put under a weight and stewed at 45°C for 12 hours, after stewing the substratum is being dried. Biologically active composition containing honey and medicinal plants and further comprise at least one heat-treated medicinal plant.

(51) **A23L1/24** (11) **14775 A**  
(21) P-13-162 (22) 28.10.2013  
(41) 20.12.2013

- (71) SPILVA, SIA; Zvaigžņu iela 1, Spilve, Babītes pag., Babītes nov. LV-2101, LV  
(72) Pēteris TEIVĀNS (LV), Egita BĒRZIŅA (LV)  
(74) Ņina DOLGICERE; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006, LV  
(54) **TOMĀTU MĒRČU RAŽOŠANAS PAŅĒMIENS METHOD FOR PRODUCTION OF TOMATO SAUCES**

(57) Izgdrojums attiecas uz pārtikas rūpniecību, konkrēti – uz tomātu mērču ražošanas tehnoloģiju. Tiek piedāvāts mērču ražošanas procesā pirms produkta iepildīšanas stikla traukos to dibenus sasildīt līdz 40 - 60°C temperatūrai. Tas nodrošina to, ka temperatūras starpība starp stikla trauku sienām un produktu ir 30 - 40°C, tādēļ nenotiek mitruma kondensēšanās uz trauka sienām un produkts tiek vienmērīgi sadalīts trauka tilpumā.

A61K36/18 14774

**B sekcija**

- (51) **B01J20/04** (11) **14776 A**  
**B01J20/24**  
**C02F1/28**
- (21) P-13-144 (22) 03.10.2013  
(41) 20.12.2013  
(71) LATVIJAS UNIVERSITĀTE; Raiņa bulvāris 19, Rīga LV-1586, LV  
(72) Māris KĻAVIŅŠ (LV),  
Andris ABRAMENKOVŠ (LV)  
(74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **SORBENTS UN METODE ŪDEŅU ATTĪRĪŠANAI NO RADIOAKTĪVAJĪEM ELEMENTIEM**  
**A SORBENT AND A METHOD OF WATER PURIFICATION FROM RADIOACTIVE ELEMENTS**
- (57) Izgudrojums attiecas uz sorbentiem un metodēm ūdeņu attīrīšanai no radionuklīdiem. Tiek piedāvāts sorbents, kas satur uz kūdras virsmas izgulsnētu oksiapatītu. Tiek piedāvāta metode sorbenta ieguvei, kuras rezultātā veidojas kovalenta saistība starp kūdru un oksiapatītu veidojošiem elementiem. Metode paredz kalcija sāļu izšķīdināšanu, vēlams dejonizētā ūdenī, kūdras pievienošanu kalcija sāļu šķīdumam, maisījuma izturēšanu, fosfātjonu pievienošanu iegūtajai dispersijai, samaisīšanu, filtrēšanu, skalošanu, vēlams ar dejonizētu ūdeni, un termisku apstrādi.

Invention relates to sorbents and methods for water purification from radioactive elements. The sorbent contains oxyapatite precipitated on peat surface. A method for producing the sorbent provides covalent links between precipitated oxyapatite and peat. The method comprises the following steps: dissolution of calcium salts, preferably in deionized water; adding peat to the calcium salt solution; aging the resulting mixture; adding phosphate ions to the obtained dispersion; mixing, filtering, rinsing, preferably with deionized water, and treatment by heating.

B01J20/24 14776

**C sekcija**C02F1/28 14776  
C02F3/02 14777

- (51) **C02F9/00** (11) **14777 A**  
**C02F3/02**
- (21) P-12-83 (22) 23.05.2012  
(41) 20.12.2013  
(71) BGS, SIA; Ūnijas iela 8 k-9, Rīga LV-1084, LV  
(72) Vladislav ADZHIENKO (RU),  
Jānis TĒRAUDS (LV),  
Igor LADNER (DE)  
(74) Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS Latvija;  
Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050, LV  
(54) **NOTEKŪDEŅU ATTĪRĪŠANAS IETAĪŠU KOMPLEKSS, IZGATAVOTS NO ĢEOTEKSTILA CAURULĒM**  
**EQUIPMENT COMPLEX MADE FROM GEO-TEXTILE PIPES FOR TREATMENT OF WASTEWATER**
- (57) Izgudrojums attiecas uz lietus ūdens, ražošanas un saimniecisko notekūdeņu mehānisko un bioloģisko attīrīšanu. Piedāvātais komplekss sastāv no aerējama biodīķa (1), filtrējošiem dambjiem (3) un no drenāžas sistēmas (5), kas izgatavota no perforētām caurulēm. Izgudrojumā piedāvāts biodīķa (1) filtrējošos dambjus (3), kā arī filtrējošās starpsienas (4) izgatavot no slēgtiem lielgabarīta sintētiska tekstilmateriāla filtrējošiem apvalkiem, kuros iepildīts

graudains minerālvielu piekrāvums. Filtrējošie dambji (3) izvietoti pa biodīķa (1) perimetru, bet filtrējošās starpsienas sadala biodīķi pirmajā (10), otrajā (11), trešajā (12) un ceturtajā (13) sekcijās. Slēgtie lielgabarīta filtrējošie apvalki, kurus sauc arī par ģeotekstila caurulēm, tiek izgatavoti rūpnieciski no austa vai neausta sintētiska materiāla, un tie tiek piepildīti ar graudainu piekrāvumu. Graudainais materiāls var būt minerālvielas (smilts, grants vai tml.) vai arī polimēra, gumijas vai citādas granulas.

The present invention pertains to mechanical and biological treating of rainwater, waste water or sewage. There is offered complex comprising aerated bio-pond (1), filtering dikes (3) and drainage system (5) made from punched pipes. The invention offers to make filtering dikes (3) of bio-pond (1) as well as filtering partition walls (4) from closed type large-sized filtering housings manufactured from synthetic textile and filled up with grainy minerals. The filtering dikes (3) are positioned along the perimeter of bio-pond (1), but filtering partition walls (4) divide the bio-pond into first (10), second (11), third (12) and fourth (13) sections. The closed type large-sized filtering housings, named also as geo-textile pipes are made industrially from woven or non-woven synthetic material and loaded down with grainy mineral charge. The grainy material could be minerals (sand, gravel and the like) or granules of polymeric, rubber or other material.

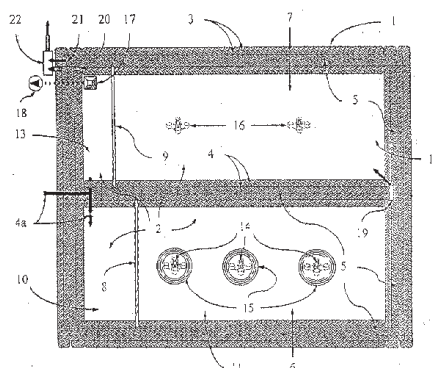
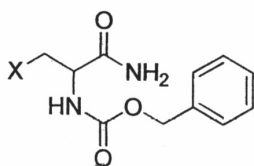


Fig. 1

- (51) **C07C211/15** (11) **14778 A**  
**C07D203/00**
- (21) P-13-139 (22) 27.09.2013  
(41) 20.12.2013  
(71) RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga LV-1658, LV  
(72) Jevgeņija LUGIŅINA (LV),  
Vitālijs RJABOVŠ (LV),  
Māris TURKS (LV),  
Jevgeņija MACKEVIČA (LV)  
(54) **2-AMINO-3-HALOGĒN-KARBONSKĀBJU ATVASINĀJUMU UN 2-AMINO-3-PSEIDOHALOGĒN-KARBONSKĀBJU ATVASINĀJUMU IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**  
**METHOD FOR PRODUCING DERIVATIVES OF 2-AMINO-3-HALOGEN CARBONIC ACIDS AND 2-AMINO-3-PSEUDOHALOGEN CARBONIC ACIDS**
- (57) Izgudrojums attiecas uz organiskās ķīmijas tehnoloģijas nozari, konkrēti, uz halogēnus un pseidohalogēnu grupas saturošu aminoskābju atvasinājumu (3) iegūšanas procesu no aziridīn-2-karbonskābes atvasinājumiem un I vai II grupas metālu sāļiem, kā šķīdinātāju izmantojot sašķīdinātu sēra dioksīdu.

The present invention describes the synthesis process of amino acid derivatives (3), that contain halogen substituent or pseudo halogen group, by mixing of aziridine derivatives and metal salts of I or II group metals using liquid sulfur dioxide solvent.





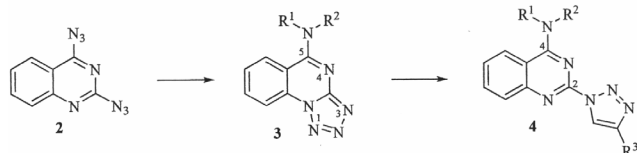
3

C07D249/08 14779  
C07D203/00 14778

- (51) C07D239/72 (11) 14779 A  
C07D249/08  
(21) P-13-136 (22) 20.09.2013  
(41) 20.12.2013  
(71) RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga LV-1658, LV  
(72) Ērika BIZDĒNA (LV),  
Agnese KALNIŅA (LV),  
Irina NOVOSJOLOVA (LV),  
Māris TURKS (LV)  
(54) **4-AMINO-2-(1,2,3-TRIAZOL-1-IL)-HINAZOLĪNA ATVASINĀJUMI UN TO SINTĒZES PAŅĒMIENS**  
**4-AMINO-2-(1,2,3-TRIAZOL-1-YL)-QUINAZOLINE DERIVATIVES AND SYNTHESIS METHOD THEREOF**

(57) Izgdrojums attiecas uz organiskās un medicīnas ķīmijas nozari, konkrēti, uz jaunu 4-amino-2-(1,2,3-triazol-1-il)-hinazolīna atvasinājumu sintēzi no 2,4-diazidohinazolīniem.

The present invention relates to the field of organic and medical chemistry, particularly to the synthesis of novel 4-amino-2-(1,2,3-triazol-1-yl)-quinazoline derivatives.



C08G61/12 14780

- (51) C09K11/06 (11) 14780 A  
C08G61/12  
(21) P-12-93 (22) 11.06.2012  
(41) 20.12.2013  
(71) DAUGAVPILS UNIVERSITĀTE; Vienības iela 13, Daugavpils LV-5400, LV  
(72) Georgijs KIRILOVS (LV),  
Andrejs BULANOVŠ (LV),  
Irene IVANOVA (LV),  
Jeļena KIRILOVA (LV)  
(54) **JAUNA LUMINISCĒJOŠA POLIMĒRMATERIĀLA IEGŪŠANAS METODE**  
**PREPARATION METHOD OF NEW LUMINESCENCE POLYMERIC MATERIAL**

(57) Izstrādāta jauna luminiscējoša polimērmateriāla iegūšanas metode, kas ietver divu monomēru (vinilkarbazola un benzantrona alilatvasinājuma) kopolimerizāciju, iegūstot elektrovadošu kopolimēru, intensīvi luminiscējošu sarkanajā spektra pusē: no 595 līdz 650 nm atkarībā no alilkomponenta daudzuma. Šo īpatnību var uzskatīt par izstrādāto materiālu priekšrocību, jo tā dod iespēju regulēt polimērmateriāla optiskās īpašības atkarībā no pielietojuma vajadzībām. Šī metode attiecas uz materiālizinātnes un spektroskopijas nozari. Tā var tikt pielietota jaunu luminiscējošu materiālu izstrādei, izmantojot jaunizstrādāto luminiscento polimēru

uz polivinilkarbazola bāzes, kura klātbūtne nodrošina elektrovadošību.

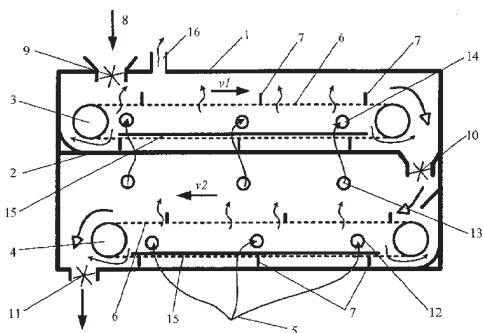
Izstrādātais kopolimērs var tikt pielietots jaunu elastīgu spīdošu materiālu izstrādei, kurus var izmantot elektrofotogrāfijā, displeju, gaismas avotu, sensoru, diožu lāzeru ražošanā un citās jomās, kur nepieciešams nodrošināt intensīvu oranžas vai sarkanas krāsas luminiscenci, pārveidojot elektrisku enerģiju gaismā. Piemēram, var izmantot dažādu elektroluminiscējošu ierīču (OLED diožu, monitoru u.c.) konstruēšanai.

## F sekcija

- (51) F26B17/08 (11) 14781 A  
(21) P-13-108 (22) 25.07.2013  
(41) 20.12.2013  
(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;  
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV  
(72) Aivars KAĶĪTIS (LV),  
Mārtiņš OZOLLAPIŅŠ (LV),  
Imants NULLE (LV)  
(54) **BIOMASU KALTE**  
**DRYER OF BIOMASS**

(57) Izgdrojums attiecas uz lauksaimniecības produkcijas pārstrādes iekārtām un ir izmantojams smalcinātu stiebru materiālu (niedru, salmu, kaņepju) kaltēšanai. Kalte sastāv no korpusa (1), kurā viens virs otra novietoti divi sietveida lentes konveijeri. Augšējo konveijeru (3) no apakšējā konveijera (4) atdala starpsiena (2), kā rezultātā veidojas divas kaltēšanas kameras. Mitrā biomasa tiek padota uz augšējā konveijera lentes (6) noteikta biezuma slānī. Konveijers pārvieto biomasu ar noteiktu ātrumu, kas nodrošina daļēju mitrās masas izkaltēšanu. Caur rotējošu aizvaru (10) pussausā biomasa nonāk uz apakšējā konveijera lentes, kas pārvietojas ar mazāku ātrumu nekā augšējā konveijera lente. Uz apakšējā konveijera lentes biomasas slānis ir biežāks. Sausais kaltēšanas aģents (5) tiek padots starp apakšējā konveijera sietveida lentēm (12) un, plūstot caur kaltējamās masas slāni, nodrošina mitruma iznesi. Daļa kaltēšanas aģenta (5) plūsmas virzās caur konveijera lentes (6) brīvo zaru, attīrot to no biomasas smalkajām daļiņām. Daļēji izmantotais kaltēšanas aģents tiek padots starp augšējā konveijera lentēm un nodrošina mitrās biomasas priekšcaltēšanu. Kaltēšanas aģenta (5) plūsmas virziens augšējā kamerā ir analogs plūsmas virzienam apakšējā kamerā. Kaltēšanas aģents tiek piesātināts ar iznesto mitrumu un izvadīts atmosfērā. Lai nodrošinātu pietiekošu kaltēšanas aģenta padevi caur biomasas slāni, virs konveijera apakšējā zara lentes novietota regulējama garuma plāksne (15), kas ierobežo kaltēšanas aģenta plūsmu caur sietveida lentes brīvo zaru.

The invention relates to the agricultural production processing equipment and can be used for the chopped straw materials (reed, straw, hemp) drying. Dryer consists of two mesh belt conveyors placed in housing (1) one above other. The upper conveyor (3) separates the lower conveyor (4) by bulkhead (2), splitting dryer in two drying chambers. Wet biomass is fed towards the upper conveyor belt (6) in the determined layer thickness. The conveyor moves the biomass at a specific rate, which provides a partial wet weight of the drying. Through a rotating shutter (10) semidry biomass comes in the bottom conveyor belt moving at a slower rate than the upper conveyor belt. On the lower conveyor belt biomass layer is thicker. Dry drying agent (5) is fed between the bottom mesh conveyor belts (6), and flowing through the drying mass layer provides moisture runoff. Part of the drying agent (5) flows passing through the conveyor belt open branch and clean the belt from biomass fine particles. Partly used drying agent is fed between the upper conveyor belts and provides previous drying wet biomass. The drying agent (5) flow direction in the upper chamber is analogous to the flow direction of the lower chamber. The drying agent becomes saturated with moisture and released into the atmosphere. Adjustable length plate (15) is placed over the lower branch conveyor belt to ensure sufficient drying agent supply through biomass layer and limit drying agent flow in the conveyor's belt free branch.



## G sekcija

G01J3/02 14782

(51) G01J3/28 (11) 14782 A

G01J3/02

(21) P-13-177 (22) 12.11.2013

(41) 20.12.2013

(71) LATVIJAS UNIVERSITĀTE; Raiņa bulvāris 19, Rīga LV-1586, LV

(72) Jānis SPĪGULIS (LV)

(74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **PAŅĒMIENS REFLEKSIJAS SPEKTRĀLĀ VĀJINĀJUMA ATTĒLOŠANAI PIE VAIRĀKIEM VIĻŅU GARUMIEM**  
**METHOD FOR IMAGING OF SPECTRAL ATTENUATION AT A NUMBER OF WAVELENGTH BANDS**

(57) Izgdrojums attiecas uz spektrālo attēlošanu, konkrēti – uz virsmas refleksijas spektrālā vājinājuma koeficientu sadalījuma attēlošanu pie vairākiem fiksētiem viļņu garumiem, izmantojot viena digitālā RGB attēla datus. Piedāvāts paņēmieni refleksijas spektrālā vājinājuma attēlošanai pie vairākiem viļņu garumiem, kurā spektrālā vājinājuma attēlus izdala no viena digitālā RGB attēla datu masīva pie viļņu garumiem, kas atbilst polihromatiska līnīspektra apgaismojuma spektrālīniju viļņu garumiem. Paņēmieni nodrošina fotouztvēršanas linearitāti, izmantojot references atstarotāju un ņemot vērā fotouztvērēja jutības spektrālo joslu pārklāšanos, pie kam refleksijas spektrālā vājinājuma aprēķinam katrā attēla pikselī vai pikseļu grupā tiek izmantots kalibrēts pelēks references atstarotājs, turklāt pie visiem apgaismojuma viļņu garumiem refleksijas koeficients ir mazāks, nekā baltai referencei, un pēc vērtības tas ir tuvs lielākajam refleksijas koeficientam attēlojamā objekta zonā.

Invention relates to spectral imaging, in particular to imaging of spectral reflectance distribution at a number of fixed wavelengths bands by means of single RGB image data set. In the proposed method for obtaining several spectral reflectance images the spectral attenuation images are extracted from a digital RGB image data array at wavelengths corresponding to the spectral lines of polychromatic illumination spectral wavelengths, providing photo capture linearity using the reference of the reflector and taking into account photos receiving sensitivity of the spectral bands overlap. The reflectance spectral attenuation is calculated for each image pixel or group of pixels using a calibrated grey reference reflector, and at all wavelengths of light reflection coefficient is less than the white of the reference, and the value is close to the largest reflection coefficient of the displayed object area.

(51) G06Q10/06 (11) 14783 A

(21) P-13-137 (22) 24.09.2013

(41) 20.12.2013

(71) LATVIJAS UNIVERSITĀTES AĢENTŪRA LATVIJAS UNIVERSITĀTES MATEMĀTIKAS UN INFORMĀTIKAS INSTITŪTS; Raiņa bulvāris 29, Rīga LV-1459, LV

(72) Kārlis PODNIEKS (LV),

Leide LĀCE (LV)

(54) **PAŅĒMIENS UN ELEKTRONISKĀ SISTĒMA DOMĒNSPECIFISKAS PROCESU PĀRVALDĪBAS PROGRAMMSISTĒMAS DOMĒNSPECIFISKO PROCESU DEFINĪCIJU TRANSFORMĒŠANAI**

**METHOD AND ELECTRONIC SYSTEM FOR TRANSFORMING PROCESS DEFINITIONS OF DOMAIN-SPECIFIC MANAGEMENT SYSTEM TO THE BASE LANGUAGE OF THE PROCESS EXECUTION ENGINE**

(57) Piedāvātais paņēmieni domēnspecifiskas procesu pārvaldības sistēmas procesu definīciju transformēšanai uz procesu izpildes vides bāzes valodu, kura plūsmas diagramma ir parādīta Fig. 4, ir balstīts uz metamodeļiem, transformāciju valodām un transformāciju vadītu arhitektūru. Vajadzīgās domēnspecifiskās procesu modelēšanas valodas sintakse tiek uzdota ar superstereotipu mehānisma moduli, konsistences nosacījumi – ar konsistences nosacījumu definēšanas moduli un semantika – ar attēlojumu definēšanas moduli. Elektroniskā sistēma, izmantojot minēto paņēmieni, veic procesu definīciju konsistences pārbaudi izveidotajā domēnspecifiskajā valodā un to transformēšanu uz ekvivalentām procesu definīcijām izpildes vides bāzes valodā. Izgdrojums ļaus IT uzņēmumiem ātrāk, efektīvāk un labākā kvalitātē veidot saviem pasūtītājiem domēnspecifiskas procesu pārvaldības programmsistēmas, jo tiks nodrošināta automatizēta procesu definīciju iegūšana izpildes vides bāzes valodā. Izgdrojums ir daļa no domēnspecifisko procesu pārvaldības programmsistēmu būves tehnoloģijas.

The proposed method, flow chart of which is shown in Fig. 4, for transforming process definitions of a domain-specific process management system to the base language of the process execution engine is based on metamodels, transformation languages and transformation driven architecture. The syntax of the required domain-specific process modeling language is specified by means of the superstereotype mechanism, the consistency constraints – by means of the consistency constraint module and semantics – by means of the mapping definition module. By using the proposed method the electronic system performs the consistency check of process definitions in the given domain specific language and their transformation to equivalent process definitions in the base language of the process execution engine. The proposed invention will enable IT enterprises to create domain specific process management systems for their customers faster, more efficiently and at a higher quality. This will occur because an automated creation of process definitions in the base language of the process execution engine will be ensured. The invention is part of the technology for building domain specific process management systems.

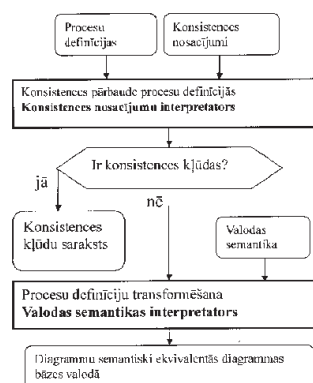


Fig.4

## H sekcija

(51) H04L29/02 (11) 14784 A

(21) P-12-89 (22) 31.05.2012

(41) 20.12.2013

- (71) Guntis BĀRZDIŅŠ; Lāčplēša iela 29-63, Rīga LV-1010, LV;  
Adrians HEIDENS; Embūtes iela 55-39, Ventspils LV-3602,  
LV
- (72) Guntis BĀRZDIŅŠ (LV),  
Adrians HEIDENS (LV)
- (74) Jevgeņijs FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra,  
SIA; a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **PAŅĒMIENS UN IEKĀRTA MARŠRUTĒTĀ SAKARU  
TĪKLĀ PĀRRAIDĀMĀ DATU APJOMA SAMAZINĀŠANAI,  
TUNELĒJOT PRIVĀTĀ TĪKLA DATU PAKETES  
METHOD AND DEVICE FOR REDUCING OF DATA  
TRANSMISSION VOLUME VIA ROUTINED COMMUNICA-  
TION NETWORK BY TUNNELING DATA PACKETS OF  
PRIVATE NETWORK**

(57) Izgdrojums attiecas uz ciparinformācijas pārraidi, konkrēti – uz paņēmieniem un iekārtām IP maršrutēta tīkla pārraidāmā datu apjoma samazināšanai, tunelējot privātā tīkla datu paketes. Paņēmieni maršrutētā sakaru tīklā pārraidāmā datu apjoma samazināšanai, tunelējot privātā tīkla datu paketes, kuras sastāv no galvenes un derīgu datu lauka, caur maršrutētu transporta sakaru tīklu no raidītāja uz uztvērēju, pie kam minētais raidītājs un uztvērējs ir pielāgoti datu pakešu pārveidošanai un paņēmieni ietver šādus soļus: (i) no privātā sakaru tīkla saņemto datu pakešu apstrādi, kas ietver: datu pakešu identificēšanu un sašķirošanu NICE un UGLY paketēs, kur NICE paketes ir tādas paketes, kuru galvenē ir N bitu lauks R ar zināmām un nemainīgām bitu vērtībām T, bet UGLY ir visas parējās paketes; NICE datu pakešu modificēšanu, katras paketes galvenē ietvertajā saņēmēja adresē daļu no bitu vērtībām aizstājot ar mērķa uztvērējam sakaru tīklā maršrutētu apakštīkla adresi, bet oriģinālus (aizstātos bitus) ierakstot galvenes N bitu laukā R; (ii) apstrādāto datu pakešu nosūtīšanu bez fragmentēšanas no raidītāja uz uztvērēju caur transporta sakaru tīklu, izmantojot atbilstošas maršrutizācijas tabulas; (iii) nosūtīto datu pakešu saņemšanu uztvērējā no sakaru tīkla; (iv) saņemto datu pakešu apstrādi, kas ietver: NICE datu pakešu modificēšanu, katras paketes galvenē ietvertajā saņēmēja adresē attiecīgo bitu vērtības aizstājot ar lauka R bitu vērtībām un pēc tam laukā R atjaunojot oriģinālās zināmās un nemainīgās bitu vērtības T. NICE un UGLY pakešu transportēšanas tūneļa shēma ir parādīta Fig. 6.

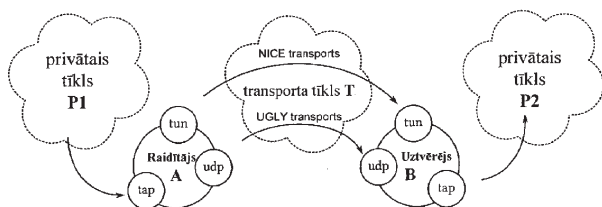


Fig. 6

## Izgdrojumu patentu publikācijas

(51) **A61G5/00** (11) **14590 B**

(21) P-11-45 (22) 18.03.2011

(45) 20.12.2013

(73) Evgueni DUKENDJIEV; Liepājas iela 3, Rīga LV-1002, LV; Vladimirs SKĻAREVIČS; Vīlpa iela 12-22, Rīga LV-1083, LV

(72) Evgueni DUKENDJIEV (LV), Vladimirs SKĻAREVIČS (LV)

(54) **BIONISKS KRĒSLIS**

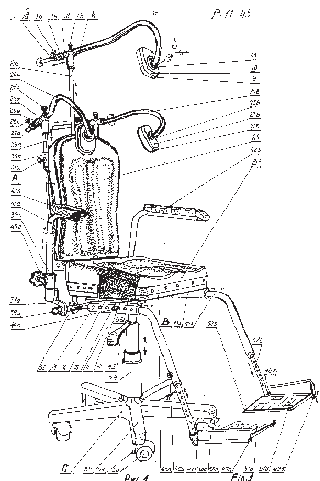
(57) 1. Bionisks krēsls atšķiras ar to, ka sastāv no piestiprinātiem zem sēdekļa (B) nolaižamiem regulējamiem kāju balstiem (50ab), pie abām muguriņas (A1) pusēm piestiprinātiem atvāžamiem regulējamiem elkoņbalstiem (41ab), muguriņas (A1) un sēdekļa (B), kas ar vienas šarnīra (7) palīdzību saistīti leņķīt, kas regulējams un dempferējams uzdotajā amplitūdā un ir ar reljefu virsmu, kas koriģēta pret muguras un sēžas daļas nospiedumiem normā, kā arī tam ir pie muguriņas (A1) mugurpuses piestiprināti atvāžami regulējama augstuma un platuma ar dempferējamu kāpi cauruļveida balsti (29ab) ķermeņa augšējās daļas liekšanās uz priekšu pretpozicionēšanai zematslēgas-pleca bedrītes rajonā un atvāžams regulējama augstuma un platuma ar dempferējamu kāpi cauruļveida balsts (8) galvas liekšanās uz priekšu pretpozicionēšanai pieres rajonā, bet zem sēdekļa (B) nostiprināta teleskopiska kolonna (54) uz daudzkāju balsta (55) ar skrūļiem (56).

2. Bioniskais krēsls saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka tam ir zem sēdekļa (B) piestiprināti nolaižami regulējami pēc augstuma un platuma kāju balsti (50ab).

3. Bioniskais krēsls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju atšķiras ar to, ka tam ir pie muguriņas (A1) piestiprināts labais un kreisais balsts (29ab), kas pretpozicionē ķermeņa kustību uz priekšu zematslēgas-pleca bedrītes rajonā.

4. Bioniskais krēsls saskaņā ar 1. līdz 3. pretenziju atšķiras ar to, ka tam ir pie muguriņas (A1) piestiprināts balsts (8), kas pretpozicionē galvas kustību uz priekšu pieres rajonā.

5. Bioniskais krēsls saskaņā ar 1. līdz 4. pretenziju atšķiras ar to, ka muguriņas (A1) un sēdekļa (B) reljefs ir koriģēts pēc pacienta spinālās un sēžas nospiedumu normas, un sastāv no uzputota pedilena (5) formu veidojoša tilpuma, uz kura uzlīmēts atspērīgi elastīga materiāla slānis (4), mikrograudaina materiāla slānis (3) ar lokālu deformācijas termoatmiņu, elastīgi atspērīga materiāla slānis (2), kurš akumulē enerģiju, ķermenim atspiežoties uz tā, un atdod to atgrūžoties, un āda apvilksmai (1).

(51) **A61B17/60** (11) **14694 B**

(21) P-13-52 (22) 17.04.2013

(45) 20.12.2013

(73) RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV;

Andris JUMTIŅŠ; Rudzu iela 16, Rīga LV-1015, LV

(72) Andris JUMTIŅŠ (LV)

(74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV

(54) **LENTE ĀRĒJĀS FIKSĀCIJAS APARĀTA KONSTRUKCIJAS IZVEIDOŠANAI APAKŠSTILBA UN AUGŠSTILBA SLĒGTO LŪZUMU KONSOLIDĀCIJAS GADĪJUMĀ**

(57) 1. Termoplastiska polimēra plēves lentes lietošana ārējās fiksācijas aparāta konstrukcijas izveidošanai apakšstilba un augšstilba slēgto lūzumu konsolidācijas gadījumā.

(51) **G01N33/53** (11) **14703 B**

(21) P-13-55 (22) 02.05.2013

(45) 20.12.2013

(73) RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV; RĪGAS AUSTRUMU KLĪNISKĀ UNIVERSITĀTES SLIMNĪCA, SIA; Hipokrāta iela 2, Rīga LV-1038, LV

(72) Ronalds MAČUKS (LV), Simona DONIŅA (LV)

(74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV

(54) **OLNĪCU VĒŽA RISKĀ NOTEIKŠANAS PAŅĒMIENS SIEVIETĒM AR VEIDOJUMU DZEMDES PIEDĒKĻU RAJONĀ**

(57) 1. Olnīcu vēža riska noteikšanas paņēmieni sievietēm ar veidojumu dzemdes piedēkļu rajonā raksturīgs ar to, ka par biomarkieri izmanto cilvēka *epidydimis* sekretoro proteīnu 4.

2. Paņēmieni saskaņā ar pirmo pretenziju raksturīgs ar to, ka cilvēka *epidydimis* sekretoro proteīnu 4 nosaka, izmantojot ELISA metodi.

3. Paņēmieni saskaņā ar otro pretenziju raksturīgs ar to, ka, ja cilvēka *epidydimis* sekretorā proteīna 4 daudzums asins serumā ir 48,6 pmol/l un lielāks, tad nosaka augstu olnīcu vēža risku.

(51) **A61K31/501** (11) **14737 B****A61P9/00****C07D403/04**

(21) P-13-86 (22) 25.06.2013

(45) 20.12.2013

(73) LATVIJAS UNIVERSITĀTE; Raiņa bulvāris 19, Rīga LV-1586, LV

(72) Toms RĒĶIS (LV), Gunita OŠA (LV), Agris BĒRZIŅŠ (LV), Andris ACTIŅŠ (LV)

(74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **PIMOBENDĀNA POLIMORFĀS KRISTĀLISKĀS A FORMAS IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**

(57) 1. Pimobendāna polimorfās kristāliskās A formas iegūšanas paņēmieni, kas ietver šādus soļus:

(i) pimobendāna izšķīdināšana polārā šķīdinātājā temperatūrā, kas tuva šķīdinātāja viršanas temperatūrai, pēc tam karsta ūdens pievienošana mazās porcijās, izturot ap 60°C temperatūrā, šķīduma atdzesēšana līdz istabas temperatūrai, kristālu izdalīšana no tā, kristālu skalošana ar acetonu un žāvēšana, iegūstot pimobendāna monohidrātu;

(ii) solī (i) iegūtā pimobendāna monohidrāta suspendēšana virstošā polārā aprotiskā šķīdinātājā;

(iii) solī (ii) iegūtās suspensijas atdzesēšana līdz istabas temperatūrai, filtrēšana, skalošana ar acetonu, žāvēšana un pimobendāna kristāliskās A formas izdalīšana.

2. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kur polārais šķīdinātājs ir metanols, etanols, n-propanols vai izo-propanols.

3. Paņēmieni saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur polārais aprotiskais šķīdinātājs ir 3-pentanons, nitrometāns, acetonitrils, 2-butanons vai etilacetāts.

4. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver kristāliskās A formas pimobendānu, kas iegūts saskaņā ar 1. līdz 3. pretenzijā aprakstīto paņēmieni.

5. Veterinārais preparāts, kas ietver polimorfās kristāliskās A formas pimobendānu, kas iegūts saskaņā ar 1. līdz 3. pretenzijā aprakstīto paņēmieni.



(51) **B04B7/00** (11) **14739 B**  
**B04B13/00**  
**B01L11/00**

(21) P-12-61 (22) 17.04.2012

(45) 20.12.2013

(73) ELMI, SIA; Aizkraukles iela 21-136, Rīga LV-1006, LV

(72) Ivans MIRONOVŠ (LV),  
 Dmitrijs MERKULOVS (LV),  
 Vitālijs MIRONOVŠ (LV)

(54) **CENTRIFŪGAS ROTORS**

(57) 1. Centrifūgas-miksera rotors, kas satur leņķisku disku, centrālo caurumu tā nostiprināšanai uz dzinēja ass un caurumus mēģeņu uzstādīšanai, pie kam mēģenes ar šķidrumu attiecībā pret dzinēja asi rotorā tiek izvietotas zem leņķa robežās no 0 līdz 90 grādiem, kas atšķiras ar to, ka, ar mērķi paplašināt tādas rotora ekspluatācijas iespēju robežas kā pieļaujamo centrifugēšanas ātrumu un rotora kratīšanas efektivitāti, rotors apakšējā daļā satur papilddisku ar caurumiem, kuru ass sakrīt ar rotora augšējās daļas zem leņķa izvietotajiem atbilstošajiem caurumiem, pie kam spraugas starp mēģenēm un rotora apakšējās daļas caurumu asīm ir ievērojami lielākas par spraugām starp mēģenēm un caurumiem rotora augšējā daļā.

2. Rotors saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka tā papilddisks ir izveidots konusa formā.

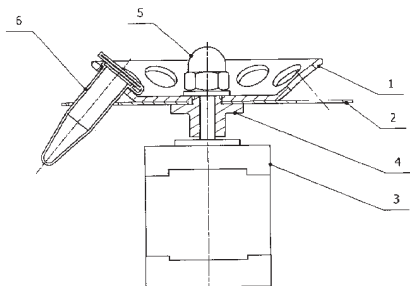


Fig. 1

(51) **C13K1/02** (11) **14742 B**  
**D21B1/14**

(21) P-13-104 (22) 23.07.2013

(45) 20.12.2013

(73) LATVIJAS VALSTS KOKSNES ĶĪMIJAS INSTITŪTS, Atvasināta publiska persona; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006, LV

(72) Aleksandrs RAPOPORTS (LV),  
 Nikolajs VEDERNIKOVŠ (LV),  
 Linda ROZENFELDE (LV),  
 Jurijs DEHTJARS (LV),  
 Semjons CIFANSKIS (LV),  
 Māris PUĶE (LV),  
 Irēna KRŪMA (LV),  
 Aleksejs KATAŠEVŠ (LV),  
 Vladimirs JAKUŠEVIČS (LV)

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

(54) **CELULOZES ENZIMĀTISKĀS HIDROLĪZES PRIEKŠAPSTRĀDES PAŅĒMIENS**

(57) 1. Lignocelulozes materiālu priekšapstrādes paņēmiens pirms enzymātiskās hidrolīzes, tos žāvējot, mehāniski sasmalcinot un pēc tam mehāniski un ķīmiski apstrādājot ūdens suspensiju, raksturīgs ar to, ka mehānisko un ķīmisko apstrādi veic, laižot caur suspensiju ultraskaņas viļņus ar frekvenci 18 līdz 20 kHz 1,5 līdz 2,5 stundas, bet pēc tam apstrādāto materiālu ievieto autoklāvā uz 15 līdz 25 minūtēm pie temperatūras 110 līdz 130°C, un pēc apstrādes autoklāvā, līdz 20 – 30°C atdzesētajam substrātam pievieno komponentus, kas nepieciešami enzymātiskai hidrolīzei.

2. Celulozes enzymātiskās hidrolīzes priekšapstrādes paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka pēc apstrādes autoklāvā materiālu žāvē pie temperatūras 30°C, samaj un pēc tam pievieno komponentus, kas nepieciešami enzymātiskai hidrolīzei.

3. Celulozes enzymātiskās hidrolīzes priekšapstrādes paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka no lignocelulozes materiāla vispirms izdala pentozānus.

(51) **F23G7/10** (11) **14745 B**  
**F23K3/00**  
**F23M13/00**

(21) P-12-63 (22) 20.04.2012

(45) 20.12.2013

(73) Viktors KAZANCEVS; Bulduru prospekts 15-1, Jūrmala LV-2010, LV;  
 Jānis BINDRIS-BLUMENAVS; Smilšu iela 8, Jelgava LV-3001, LV

(72) Viktors KAZANCEVS (LV),  
 Jānis BINDRIS-BLUMENAVS (LV)

(74) Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS Latvija; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050, LV

(54) **GRAUDU ATKRITUMU SADEDDZINĀŠANAS IEKĀRTA**

(57) 1. Graudu atkritumu sadedzināšanas iekārta, kas satur uzkrāšanas tvertni, ķēdes pārvadu, kas ir savienots ar asi, kuras vienā galā izvietots motorreduktors, uzkrāšanas tvertnes lejasdaļā uz ass izvietotu gliemežtransportieri, degšanas kameru, kuras augšējā daļā ir novietots ventilators, bet apakšējā daļā ir izveidotas gaisa padeves spraugas,

atšķirīga ar to, ka tā papildus satur pirmo kurināmā materiāla irdinātāju, kas horizontālā stāvoklī ir ievietots uzkrāšanas tvertnes vidusdaļā un ar ķēdes pārvadu ir savienots ar iekārtas asi, un otro kurināmā materiāla irdinātāju, kas ir nostiprināts ass otrā galā un ir ievietots degšanas kamerā.

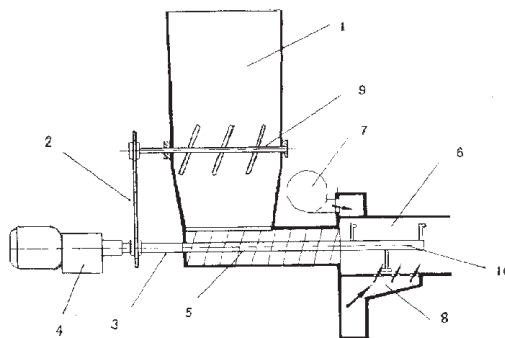


Fig.1

(51) **F02B23/00** (11) **14761 B**  
**F02B71/04**

(21) P-13-122 (22) 23.08.2013

(45) 20.12.2013

(73) Arnis TREIJS; Vabu iela 7A, Rīga LV-1030, LV

(72) Arnis TREIJS (LV)

(54) **VIRZUĻMOTORS AR PALIELINĀTU GRIEZES MOMENTU UN SAMAZINĀTIEM IZMĒRIEM**

(57) 1. Virzuļmotora konstrukcija, kas raksturīga ar to, ka:  
 - blokkartera (1) apakšējā daļā ir izveidotas vertikālas šķērsienas ar kloķvārpstas pamatgultņu ligzdām (10), kurās atrodas un griežas kloķvārpstas pamatgultņu rēdzes (5);

- pie pamatgultņu rēdzēm (5) ir izveidotas kļau rēdzes (9), kas izveido kloķvārpstas kloķus,

- blokkarterī vai cilindru čaulā papildus ir izveidots pagarinājums (8), kuru pie T-veida virzuļa ZMP aizņem T-veida virzuļa vadotne (3d), kā rezultātā tiek samazināts blokkartera augstums un šāda cilindru un virzuļa konstrukcija ļauj pielietot divus saīsinātus kļaušus (6), kuri ar virzuļa pirkstu (4) savieno virzuli (3) ar kloķvārpstas kļau rēdzēm (9).

2. Virzuļmotora konstrukcija saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam abu kļau (6) garums ir vienāds un virzuļa pirksta abos galos ar nobīdi viens otram pretī ir izveidoti mazāka diametra veidojumi (4a un 4b), salīdzinot ar tā pamatdiametru, lai atvieglotu virzuļa kustību caur AMP un ZMP.



3. Virzuļmotora konstrukcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam pie virzuļa vadotnes (3a) katrā virzuļa pirksta (4) pusē ir piestiprināts viens klanis, kuru detaļas saliktā veidā ievieto blokkarterī no apakšas, pie kam pie šādas detaļu savienojumu komplektācijas ir vēlams izgatavot blokkarteri apvienotu ar dzinēja galvu vienā veselā detaļā.

4. Virzuļmotora konstrukcija saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam kloķvārpsta ir nostiprināta pamatgultņu ligzdās (10) pie pamatgultņos (5) izveidotajām klanu rēdzēm (9), kā rezultātā pastiprinās klani (6).

5. Virzuļmotora konstrukcija saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam starp kloķvārpstas pamatgultņu rēdzēm (5) kloķvārpstā ir iestrādāts pretsvars (7).

6. Virzuļmotora konstrukcija saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka konstrukciju, kas parādīta Fig. 1 un Fig. 2, lai to pārveidotu lineāra virzuļmotora konstrukcijā ar vairāk par diviem cilindriem, papildus ir aprīkota ar:

- nepieciešamo cilindru skaitu, tos atvienojot vai pievienojot motora blokkarterim;

- saīsinātu vai pagarinātu kloķvārpstu un nepieciešamo gultņu skaitu, kloķvārpstas klanu rēdzes vienu attiecībā pret otru savstarpēji cilindros novietojot vajadzīgajos leņķos.

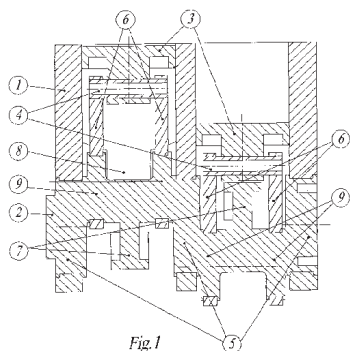


Fig. 1

(51) H03K3/335 (11) 14767 B

(21) P-13-145 (22) 04.10.2013

(45) 20.12.2013

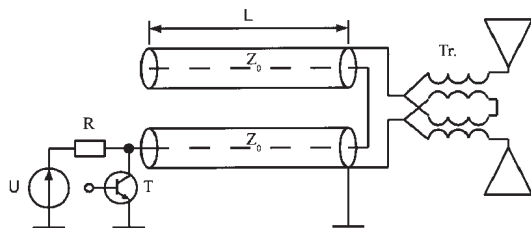
(73) ELEKTRONIKAS UN DATORZINĀTŅU INSTITŪTS;  
Dzērbenes iela 14, Rīga LV-1006, LV

(72) Modris GREITĀNS (LV),  
Vladimirs ARISTOVS (LV),  
Gatis ŠŪPOLS (LV)

(54) **SIMETRISKAS ULTRAPLATJOSLAS (UWB) ANTENAS TRIECIENIEROSMES IMPULSU FORMĒTĀJS**

(57) 1. Ultraplātjoslas (UWB) simetriskas antenas triecienierosmes impulsu formētājs, sastāvošs no diviem koaksiālo līniju nogriežņiem, barošanas avota U, koaksiālās līnijas uzlādes strāvu ierobežojoša rezistora R, lavīncaursites tranzistora T, simetrisku antenu un nesimetrisku triecienierosmes impulsu formētāju salāgojoša transformatora.

atšķirīgs ar to, ka, ar mērķi piemērot prototipa shēmu pikosekunžu platuma impulsu formēšanai un simetriskas antenas triecienierosmei, lai iegūtu UWB impulsus, prototipa impulsa formētāja gāzizlādes lampas vietā ir izmantots ātrdarbīgs lavīntranzistora slēdzis un kā slodze ir izmantota ultraplātjoslas simetriska antena, kuru ar nesimetrisko triecienierosmes impulsu formētāju salāgo vīļņu transformators.



3/5-zīmējums

## Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

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

Pieteikumi sakārtoti Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **A47C 9/00**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1367922**  
**A47C 7/02**<sup>(2006.01)</sup>
- (21) 02700288.0 (22) 14.02.2002  
(43) 10.12.2003  
(45) 07.08.2013  
(31) 20010074 U (32) 15.02.2001 (33) FI  
20010324 U 23.08.2001 FI  
(86) PCT/FI2002/000119 14.02.2002  
(87) WO 2002/063998 22.08.2002  
(73) Easydoing Oy, Sahalantie 41, 77700 Rautalampi, FI  
(72) JALKANEN, Veli-Jussi, FI  
(74) Pitkänen, Hannu Alpo Antero, Patent Agency Pitkänen Oy, P.O. Box 1188, 70211 Kuopio, FI  
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **KRĒSLS SĒŽAS NERVA GALA PROBLĒMU NOVĒRŠANAI**  
**CHAIR TO ELIMINATE PROBLEMS OF SEDENTARY ORIGIN**
- (57) 1. Krēsls sēžas nerva gala problēmu novēršanai, kurš ietver: cietu sedlveida sēžamdaļu (13), kas atbalsta sēdošās personas iegurni un ciskas/augšstilba muskuļus; krēsla kājas daļu (12) un stiprināšanas ierīci (1), lai piestiprinātu sēžamdaļu (13) pie krēsla kājas daļas (12), kurai ir pirmā regulēšanas ierīce (11) sēžamdaļas (13) augstuma regulēšanai, pie tam sēžamdaļa (13) ir izveidota kā vismaz daļēji zem leņķa noliekta sānu virsmas daļas (3, 5), kuras veido sēdekļa sedlveida formu un siles cisku balstīšanai, kas augšējā daļā ir izliektas un apakšējā daļa ir vērsta taisni lejup; bez tam uz minētās sēžamdaļas (13) sēdošā persona ir izvietota sēdēšanai, kājas saliecot leņķī uz priekšu, un sānu virsmas daļas (3, 5) ir izveidotas no vismaz divām daļām, starp kurām longitudināli ar sēžamdaļu (13) ir izveidota centrālā atvere; bez tam krēsls ietver arī stiprināšanas ierīci (1), kas ir piestiprināta pie krēsla kājas daļas (12), un balstdaļas (2, 4), kas ir piestiprinātas pie stiprināšanas ierīces (1) un sānu virsmas daļām (3, 5), un otro regulēšanas ierīci (6 - 10), lai piestiprinātu sānu virsmas daļas (3, 5) pie stiprināšanas ierīces (1), nodrošinot to regulēšanas iespēju,
- kas raksturīgs ar to, ka regulēšanas ierīce (6 - 10) un sprostie- rīce (7 - 9) ietver gropi, kas būtībā ir vērsta šķērsvirzienā attiecībā pret sēžamdaļu un iet cauri balstdaļai (4) vertikālā virzienā, un ar to, ka skrūve (7) no fiksētās balstdaļas (2) augšējās virsmas iznāk ārā gropē, un uzgrieznis (8) ir uzskrūvēts uz regulējamās balstda- ļas (4) līdz skrūves galam, līdz ar to savstarpējo attālumu izmaiņa starp sānu virsmas daļām tiek realizēta, atskrūvējot uzgriezni (8) un pārvietojot regulējamo balstdaļu (4) un sānu virsmas daļu (5), pie tam tādējādi var regulēt centrālās atveres lielumu.

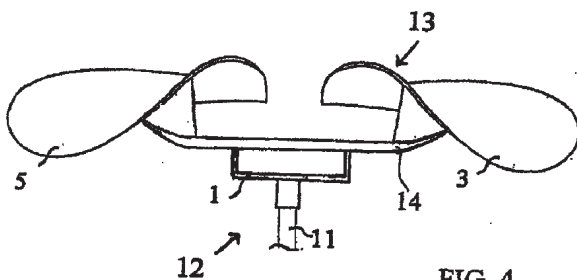


FIG. 4

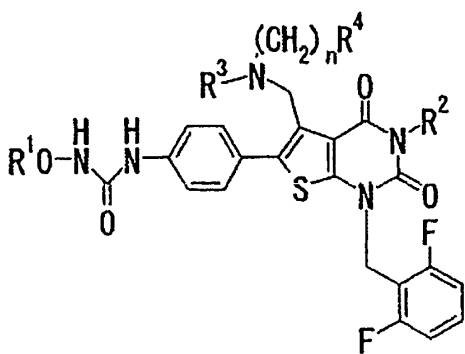
- (51) **A61K 8/64**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1482967**  
**A61Q 7/00**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61Q 19/08**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61K 38/18**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 17/02**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 17/14**<sup>(2006.01)</sup>
- (21) 03712652.1 (22) 05.03.2003  
(43) 08.12.2004  
(45) 15.05.2013  
(31) RM20020119 (32) 05.03.2002 (33) IT  
(86) PCT/IT2003/000132 05.03.2003  
(87) WO 2003/074075 12.09.2003  
(73) GEYMONAT S.p.A., 2 Via S.Anna, I-03012 Anagni FR, IT  
(72) MAGLIONE, Domenico, IT  
BATTISTI, Mauro, IT  
CONTI, Ettore, IT  
SALVIA, Giuseppe, IT  
TUCCI, Marina, IT
- (74) Germinario, Claudio, et al, Società Italiana Brevetti S.p.A., Piazza di Pietra, 38-39, 00186 Roma, IT  
Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga LV-1083, LV
- (54) **FARMACEITISKO UN KOSMĒTIKAS LĪDZEKĻU SASTĀVI, KAS SATUR PLGF-1**  
**PHARMACEUTICAL AND COSMETIC COMPOSITIONS COMPRISING PLGF-1**
- (57) 1. Pirmā tipa placentas augšanas faktora (PLGF-1) izmantošana, lai pagatavotu medikamentu, kas veicina angioģenēzi un novērš vai iedarbojas ārstnieciski uz slimību vai patoloģiskām izmaiņām, tostarp ādas vai zemādas saistaudos, kas atlasītas no:
- sklerodermijas vai
  - ādas pārkā agras novecošanas, kas rodas, ādu pakļaujot atmosfēras agresīvajiem faktoriem vai ilgstošam saules starojumam, vai
  - patoloģiskas matu izkrišanas, kas rodas alopēcijas, hormonālu traucējumu, ķīmijterapijas, radioterapijas vai medikamentu lietošanas rezultātā.
2. Pirmā tipa placentas augšanas faktora (PLGF-1) izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, ja slimība ir lokalizēta sklerodermija vai progresējoša sistēmiskā sklerodermija.
10. Pirmā tipa placentas augšanas faktors (PLGF-1) izmantošanai, lai veicinātu angioģenēzi preventīvai vai ārstnieciskai slimību vai patoloģisku izmaiņu ārstēšanai, tostarp ādas vai zemādas saistaudos, kas atlasītas no:
- sklerodermijas,
  - ādas pārkā agras novecošanas, kas rodas, ādu pakļaujot atmosfēras agresīvajiem faktoriem vai ilgstošam saules starojumam, vai
  - patoloģiskas matu izkrišanas, kas rodas alopēcijas, hormonālu traucējumu, ķīmijterapijas, radioterapijas vai medikamentu lietošanas rezultātā.
11. Pirmā tipa placentas augšanas faktors (PLGF-1) izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, ja slimība ir lokalizēta sklerodermija vai progresējoša sistēmiskā sklerodermija.
17. Farmaceutisks sastāvs, kas satur pirmā tipa placentas augšanas faktoru (PLGF-1) kā aktīvo vielu un farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, lai veicinātu angioģenēzi preventīvai vai ārstnieciskai slimību vai patoloģisku izmaiņu ārstēšanai, tostarp ādas vai zemādas saistaudos, kas atlasītas no:
- sklerodermijas vai
  - ādas pārkā agras novecošanas, kas rodas, ādu pakļaujot atmosfēras agresīvajiem faktoriem vai ilgstošam saules starojumam.
18. Sastāvs izmantošanai saskaņā ar 17. pretenziju, kur vismaz 98,5 % no PLGF-1 ir aktīvā dimēriskā un multimēriskā formā, vismaz 70 % ir dimēriskā formā un ne vairāk par 1,5 % ir monomēru formā.
22. Kosmētikas sastāvs lokālai lietošanai, kas satur PLGF-1 kā aktīvo vielu un kosmētiski pieņemamu palīgvielu un ir raksturīgs ar to, ka vismaz 98,5 % no PLGF-1 ir aktīvā dimēriskā un multimēriskā formā, vismaz 70 % ir dimēriskā formā un ne vairāk par 1,5 % ir monomēru formā un, ka tas ir losjona, ūdens/emļas emulsijas, eļļas/ūdens emulsijas, suspensijas, liposomu suspensijas, gēla, krēma, pastas vai ziedes formā.

23. Sastāvs lokālai lietošanai saskaņā ar 22. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka PLGF-1 ir produkts, kas izspiests no ģenētiski modificētām saimniekšūnām.

24. Sastāvs lokālai lietošanai saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 23. pretenzijai, kas satur vienu vai vairākas vielas, kas atlasītas no cistīna, cisteamīna vai glutatīona samazinātā formā, kas spēj stabilizēt PLGF-1 aktīvā dimēriskā-multimēriskā formā.

- (51) **C07D 495/04**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1591446**  
**A61K 31/519**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 1/04**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 5/04**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 5/24**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 13/08**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 15/00**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 15/08**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 15/18**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 17/10**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 17/14**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 25/28**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 35/00**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 43/00**<sup>(2006.01)</sup>

- (21) 04705950.6 (22) 28.01.2004  
(43) 02.11.2005  
(45) 06.03.2013  
(31) 2003020854 (32) 29.01.2003 (33) JP  
(86) PCT/JP2004/000741 28.01.2004  
(87) WO 2004/067535 12.08.2004  
(73) Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1, Doshomachi 4-chome Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, JP  
(72) CHO, Nobuo, JP  
IMADA, Takashi, JP  
HITAKA, Takenori, JP  
MIWA, Kazuhiro, JP  
KUSAKA, Masami, JP  
SUZUKI, Nobuhiro, JP  
(74) Wright, Robert Gordon McRae, et al, Elkington and Fife LLP, Prospect House, 8 Pembroke Road, Sevenoaks, Kent TN13 1XR, GB  
Baiba KRAVALE, Patentu birojs ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
(54) **TIENOPIRIMIDĪNU SAVIENOJUMI UN TO IZMANTOŠANA**  
**THIENOPYRIMIDINE COMPOUNDS AND USE THEREOF**  
(57) 1. Savienojums ar formulu:



kur

- R<sup>1</sup> ir C<sub>1-4</sub>alkilgrupa;  
R<sup>2</sup> ir 5- līdz 7-locekļu slāpekli saturoša heterocikliska grupa, kurai var būt aizvietotājs, izvēlēts no rindas, kas sastāv no (1') halogēna, (2') hidroksilgrupas, (3') C<sub>1-4</sub>alkilgrupas un (4') C<sub>1-4</sub>alkoksigrupas, R<sup>3</sup> ir C<sub>1-4</sub>alkilgrupa;  
R<sup>4</sup> ir  
(1) ūdeņraža atoms,  
(2) C<sub>1-4</sub>alkoksigrupa,  
(3) C<sub>6-10</sub>arilgrupa,  
(4) N-C<sub>1-4</sub>alkil-N-C<sub>1-4</sub>alkilsulfonilaminogrupa,  
(5) hidroksilgrupa, vai  
(6) 5- līdz 7-locekļu slāpekli saturoša heterocikliska grupa, kurai var būt aizvietotājs, izvēlēts no rindas, kas sastāv no (1') oksogrupas,

(2') C<sub>1-4</sub>alkilgrupas, (3') hidroksi-C<sub>1-4</sub>alkilgrupas, (4') C<sub>1-4</sub>alkoksi-karbonilgrupas, (5') mono-C<sub>1-4</sub>alkil-karbamoilgrupas un (6') C<sub>1-4</sub>alkil-sulfonilgrupas;

n ir vesels skaitlis no 1 līdz 4;

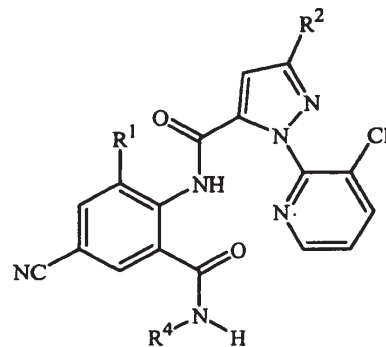
vai tā sāls.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 9. pretenziju, kas izmantojama no dzimumhormona atkarīga vēža, no dzimumhormona atkarīga vēža metastāžu kaulos, priekšdziedzera hipertrofijas, histe-romiomas, endometriozes, metrorfibromas, priekšlaicīgas seksuālās nobriešanas, amenorejas, pirmsmenstruāciju sindroma, dismenorejas, daudzkameru olnīcu sindroma, policistiskā olnīcu sindroma, aknes, plikpaurības, Alcheimera slimības, neauglības, iekaisīgu zarnu sindroma, hormonu atkarīga vai LH-RH jutīga labdabīga vai ļaundabīga audzēja vai karstuma sajūtas profilaksei vai ārstēšanai; izmantojama par reproduktīvo spēju regulatoru; izmantojama par kontraceptīvu līdzekli; izmantojama par ovulācijas stimulatoru; vai izmantojama dzimumhormonu atkarīgā vēža pēcoperācijas recidīva profilaksei.

13. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana, ražojot farmaceutisku kompozīciju gonadotropīnu atbrīvojoša hormona antagonizēšanai.

- (51) **C07D 401/04**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1599463**  
(21) 04704148.8 (22) 21.01.2004  
(43) 30.11.2005  
(45) 05.06.2013  
(31) 443256 P (32) 28.01.2003 (33) US  
(86) PCT/US2004/003568 21.01.2004  
(87) WO 2004/067528 12.08.2004  
(73) E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898, US  
(72) HUGHES, Kenneth, Andrew, US  
LAHM, George, Philip, US  
SELBY, Thomas, Paul, US  
STEVENSON, Thomas, Martin, US  
(74) Beacham, Annabel Rose, et al, Dehns, St Bride's House, 10 Salisbury Square, London EC4Y 8JD, GB  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
(54) **CIĀNANTRANILAMĪDA INSEKTICĪDI**  
**CYANO ANTHRANILAMIDE INSECTICIDES**  
(57) 1. Savienojums ar formulu I, tā N-oksīds vai sāls:



kur:

- R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir hlora atoms un R<sup>4</sup> ir Me-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir hlora atoms un R<sup>4</sup> ir Et-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir hlora atoms un R<sup>4</sup> ir *i*-Pr-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir broma atoms un R<sup>4</sup> ir Me-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir broma atoms un R<sup>4</sup> ir Et-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir broma atoms un R<sup>4</sup> ir *i*-Pr-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir CF<sub>3</sub>-grupa un R<sup>4</sup> ir Me-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir Me-grupa, R<sup>2</sup> ir CF<sub>3</sub>-grupa un R<sup>4</sup> ir Et-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir hlora atoms un R<sup>4</sup> ir Me-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir hlora atoms un R<sup>4</sup> ir Et-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir hlora atoms un R<sup>4</sup> ir *i*-Pr-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir broma atoms un R<sup>4</sup> ir Me-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir broma atoms un R<sup>4</sup> ir Et-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir broma atoms un R<sup>4</sup> ir *i*-Pr-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir CF<sub>3</sub>-grupa un R<sup>4</sup> ir Me-grupa; vai

R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir CF<sub>3</sub>-grupa un R<sup>4</sup> ir Et-grupa; vai  
R<sup>1</sup> ir hlora atoms, R<sup>2</sup> ir CF<sub>3</sub>-grupa un R<sup>4</sup> ir *i*-Pr-grupa.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

R<sup>1</sup> ir Me-grupa;

R<sup>2</sup> ir broms atoms; un

R<sup>4</sup> ir Me-grupa.

3. Kompozīcija bezmugurkaulnieku kaitēkļu apkarošanai, kas satur savienojuma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju bioloģiski efektīvu daudzumu un vismaz vienu papildu komponentu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no virsmaktīvas vielas, cieta atšķaidītāja un šķīdņa atšķaidītāja, minētā kompozīcija, iespējams, papildus satur vismaz vienu papildu bioloģiski aktīva savienojuma vai līdzekļa efektīvu daudzumu.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur vismaz viens papildu bioloģiski aktīvais savienojums vai līdzeklis ir izvēlēts no insektīdu grupas, kas sastāv no piretroīda, karbamāta, neonikotinoīda, neironu nātrija kanālu blokatora, insektīdu makrocikliska laktona, gamma-aminosviestskābes (GABA) antagonista, insektīdu urīnvielas, juvenilā hormona imitētāja, *Bacillus thuringiensis* pārstāvja, *Bacillus thuringiensis* delta endotoksīna un dabā sastopama vai ģenētiski modificēta virālā insektīda.

5. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur vismaz viens papildu bioloģiski aktīvais savienojums vai līdzeklis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no abamektīna, acefāta, acetamiprīda, amidoflumeta (S-1955), avermektīna, azadiraktīna, azinofmetila, bifentrīna, bifenazāta, buprofezīna, karbofurāna, hlorfenapira, hlorfluazurona, hlorpirifosa, hlorpirifosmetila, hromafenozīda, klotianidīna, ciflutrīna, beta-ciflutrīna, cihalotrīna, lambda-cihalotrīna, cipermetrīna, ciromazīna, deltametrīna, diafentiurona, diazinona, diflubenzurona, dimetoāta, diofenolāna, emamektīna, endosulfāna, esfenvalerāta, etiprola, fenotikarba, fenoksikarba, fenpropatrīna, fenvalerāta, fipronila, flonikamīda, flucitrināta, tau-fluvalināta, flufenērīna (UR-50701), flufenoksurona, halofenozīda, heksaflumurona, imidakloprīda, indoksakarba, izofenfosā, lufenurona, malationa, metaldehīda, metamidofosa, metidationa, metomila, metoprēna, metoksihlora, metoksifenoziāda, monokrotofosa, metoksifenoziāda, novalurona, noviflumurona (XDE-007), oksamila, parationa, parationmetila, permetrīna, forāta, fozalona, fosmeta, fosfamidona, pirimikarba, profenofosa, proflutrīna, protrifenbuta, pimetozīna, piridaila, piriprosifēna, rotenona, S 1812 (Valent) spinosāda, spiromesifēna (BSN 2060), sulprofosa, tebufenozīda, teflubenzurona, teflutrīna, terbufosa, tetrahlorvinfosa, tiakloprīda, tiametoksama, tiodikarba, tiosultapnātrija, tolfenpirāda, tralometrīna, trihlorfona un triflumurona, aldikarba, fenamifosa, amitrāza, hinometionāta, hlorbenzilāta, ciheksatīna, dikofola, dienohlorā, etoksazola, fenazakvina, fenbutatīna oksīda, fenpiroksimāta, heksitiazoksa, propargīta, piridabēna, tebufenpirāda, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoksīna, bakulovīrusa, entomopatogēnajām baktērijām, entomopatogēnajiem vīrusiem un entomopatogēnajām sēnēm.

6. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur vismaz viens papildu bioloģiski aktīvais savienojums vai līdzeklis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no acetamiprīda, cipermetrīna, cihalotrīna, ciflutrīna un beta-ciflutrīna, esfenvalerāta, fenvalerāta, tralometrīna, fenotikarba, metomila, oksamila, tiodikarba, klotianidīna, imidakloprīda, tiakloprīda, indoksakarba, spinosāda, abamektīna, avermektīna, emamektīna, endosulfāna, etiprola, fipronila, flufenoksurona, triflumurona, diofenolāna, piriprosifēna, pimetozīna, amitrāza, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoksīna un entomopatogēnajām sēnēm.

7. Bez mugurkaulnieku kaitēkļu apkarošanas paņēmieni, kurā ietilpst bezmugurkaulnieku kaitēkļu vai to vides nonākšana saskarē ar savienojuma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju bioloģiski efektīvu daudzumu, ar nosacījumu, ka paņēmieni nav terapeitiski paņēmieni cilvēka vai dzīvnieka organisma ārstēšanai.

8. Bez mugurkaulnieku kaitēkļu apkarošanas paņēmieni, kurā ietilpst bezmugurkaulnieku kaitēkļu vai to vides nonākšana saskarē ar kompozīcijas saskaņā ar 3. pretenziju bioloģiski efektīvu daudzumu, ar nosacījumu, ka paņēmieni nav terapeitiski paņēmieni cilvēka vai dzīvnieka organisma ārstēšanai.

9. Paņēmieni saskaņā ar 8. pretenziju, kur augs nonāk saskarē ar kompozīciju, aplaistot augsni ar šķīdru sastāvu.

10. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju šķīdņa sastāva veidā augsnes aplaistīšanai.

11. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 6. pretenzijai, kuru izmanto dzīvnieka aizsargāšanā pret bezmugurkaulnieku kaitēkļiem.

- (51) **A61K 38/21**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1617861**  
**A61K 47/00**<sup>(2006.01)</sup>
- (21) 04730264.1 (22) 29.04.2004  
(43) 25.01.2006  
(45) 29.05.2013  
(31) 03101210 (32) 01.05.2003 (33) EP  
530169 P 17.12.2003 US  
(86) PCT/EP2004/004806 29.04.2004  
(87) WO 2004/096263 11.11.2004  
(73) ARES TRADING S.A., Zone Industrielle de l'Ouriettaz, 1170 Aubonne, CH  
(72) SAMARITANI, Fabrizio, IT  
DEL RIO, Alessandra, IT  
(74) Hiebl, Inge Elisabeth, et al, Kraus & Weisert, Patent- und Rechtsanwältin, Thomas-Wimmer-Ring 15, 80539 München, DE  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
(54) **CILVĒKA SERUMA ALBUMĪNU NESATUROŠI STABILIZĒTI ŠĶIDRI INTERFERONA SASTĀVI**  
**HUMAN SERUM ALBUMIN-FREE STABILISED INTERFERON LIQUID FORMULATIONS**  
(57) 1. HSA nesaturoša stabilizēta šķīdņa farmaceutiska kompozīcija, kas ietver interferonu-beta (IFN-beta), kur minētais sastāvs ir šķīdums, kas satur bufervielu, poloksamēra 188 virsmaktīvu vielu, līdzekli ar izotonisku iedarbību un antioksidantu, kurš ir metionīns.  
2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais IFN-beta ir rekombinants cilvēka IFN-beta.  
3. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā bufervielā ir daudzumā, kas ir pietiekams, lai minētās kompozīcijas pH līmeni uzturētu pie norādītā pH ar precizitāti plus vai mīnus 0,5 vienības, kur norādītais pH ir no aptuveni 3,0 līdz aptuveni 5,0.  
4. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais pH ir 3,5 ± 0,2.  
5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais pH ir 4,5 ± 0,2.  
6. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētās bufervielas koncentrācija ir no 5 līdz 500 mM.  
7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētās bufervielas koncentrācija ir 10 mM.  
8. Bufervielā saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur bufervielā ir acetāta bufervielā.  
9. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais līdzeklis ar izotonisku iedarbību ir mannīts.  
10. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā līdzekļa ar izotonisku iedarbību koncentrācija ir no 0,5 līdz 500 mg/ml.  
11. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā līdzekļa ar izotonisku iedarbību koncentrācija ir 55 mg/ml.  
12. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētās poloksamēra 188 virsmaktīvas vielas koncentrācija ir no 0,01 līdz 10 mg/ml.  
13. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētās poloksamēra 188 virsmaktīvas vielas koncentrācija ir 1 mg/ml.  
14. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā metionīna antioksidanta koncentrācija ir no 0,01 līdz 5,0 mg/ml.  
15. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā metionīna antioksidanta koncentrācija ir 0,1 mg/ml.  
16. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā interferona-beta koncentrācija ir no 10 līdz 800 µg/ml.  
17. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā interferona-beta koncentrācija ir 22, 44, 88 vai 264 µg/ml.  
18. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā kompozīcija ir ūdens šķīdums.



19. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur līdzekli ar bakteriostatisku iedarbību.

20. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais līdzeklis ar bakteriostatisku iedarbību ir benzilspirts.

21. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā līdzekļa ar bakteriostatisku iedarbību koncentrācija ir no 0,1 līdz 2,0 %.

22. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā līdzekļa ar bakteriostatisku iedarbību koncentrācija ir no 0,2 līdz 0,3 %.

23. HSA nesaturēšanas stabilizētas šķidrās farmaceitiskas kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 22. pretenzijai iegūšanas paņēmieni, kur minētais paņēmieni ietver bufervielas, poloksamēra 188 virsmaktīvas vielas, metionīna antioksidanta un līdzekļa ar izotonisku iedarbību aprēķināta daudzuma pievienošanu buferšķīdumam un pēc tam interferona-beta (IFN-beta) pievienošanu.

24. Trauks, kas hermētiski noslēgts sterilos apstākļos un piemērots uzglabāšanai pirms lietošanas, kurā ir šķidrā farmaceitiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 22. pretenzijai.

25. Trauks saskaņā ar 24. pretenziju, kur minētais trauks ir pilnšjirce vienas devas ievadīšanai.

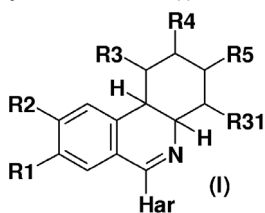
26. Trauks saskaņā ar 24. pretenziju, kur minētais trauks ir flakons.

27. Trauks saskaņā ar 24. pretenziju, kur minētais trauks ir kārtidz autinjektoram.

28. Trauks saskaņā ar 25. vai 26. pretenziju, kur minētais trauks ir paredzēts vienas devas vai multidevu ievadīšanai.

29. Komplekts farmaceitiskās kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 18. līdz 21. pretenzijai multidevu ievadīšanai, kur komplekts ietver pirmo trauku, kas piepildīts ar farmaceitisko kompozīciju saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai, un otro kārtidžu, kas piepildīts ar šķīdumu, kas satur līdzekli ar bakteriostatisku iedarbību.

- (51) **C07D 401/04**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1723135**  
 (21) 05716889.0 (22) 02.03.2005  
 (43) 22.11.2006  
 (45) 19.06.2013  
 (31) 04004973 (32) 03.03.2004 (33) EP  
 04106359 07.12.2004 EP  
 (86) PCT/EP2005/050931 02.03.2005  
 (87) WO 2005/085225 15.09.2005  
 (73) Takeda GmbH, Byk-Gulden-Strasse 2, 78467 Konstanz, DE  
 (72) KAUTZ, Ulrich, DE  
 SCHMIDT, Beate, DE  
 FLOCKERZI, Dieter, DE  
 HATZELMANN, Armin, DE  
 ZITT, Christof, DE  
 BARSIG, Johannes, DE  
 MARX, Degenhard, DE  
 KLEY, Hans-Peter, DE  
 (74) Wild, Robert, et al, Takeda GmbH, Postfach 10 03 10, 78403 Konstanz, DE  
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **JAUNI HIDROKSI-6-HETEROARILFENANTRIDĪNI UN TO IZMANTOŠANA PAR PDE4 INHIBITORIEM**  
**NOVEL HYDROXY-6-HEROARYLPHENANTHRIDINES AND THEIR USE AS PDE4 INHIBITORS**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu (I)



kurā

R1 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa, R2 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R3 ir ūdeņraža atoms,

R31 ir ūdeņraža atoms,

R4 ir -O-R41, kurā

R41 ir ūdeņraža atoms,

R5 ir ūdeņraža atoms,

Har ir eventuāli aizvietots ar R6 un/vai R7 un ir piridinilgrupa, izoksazolilgrupa, imidazolilgrupa, tiazolilgrupa, oksazolilgrupa, pirimidinilgrupa, pirazinilgrupa vai piridazinilgrupa, kurā

R6 ir 1-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkoksigrupa, piridilgrupa vai morfolin-4-ilgrupa,

R7 ir 1-4C-alkoksigrupa,

vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls.

2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā

R1 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R2 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R3 ir ūdeņraža atoms,

R31 ir ūdeņraža atoms,

R4 ir -O-R41, kurā

R41 ir ūdeņraža atoms,

R5 ir ūdeņraža atoms,

Har ir 6-(morfolin-4-il)piridin-3-ilgrupa, piridin-3-ilgrupa, piridin-4-ilgrupa, izoksazol-5-ilgrupa, 1-metilimidazol-2-ilgrupa, 1-metilimidazol-5-ilgrupa, 2-(piridin-3-il)tiazol-4-ilgrupa, 2,6-dimetokspiridin-4-ilgrupa vai 2,6-dimetokspiridin-3-ilgrupa,

vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls.

3. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā

R1 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R2 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R3 ir ūdeņraža atoms,

R31 ir ūdeņraža atoms,

R4 ir -O-R41, kurā

R41 ir ūdeņraža atoms,

R5 ir ūdeņraža atoms,

Har ir ar 1-4C-alkoksigrupu diaizvietota piridinilgrupa, vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls.

4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā

R1 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R2 ir 1-2C-alkoksigrupa, 2,2-difluoretoksigrupa vai pilnīgi vai pārsvarā ar fluora atomu aizvietota 1-2C-alkoksigrupa,

R3 ir ūdeņraža atoms,

R31 ir ūdeņraža atoms,

R4 ir -O-R41, kurā

R41 ir ūdeņraža atoms,

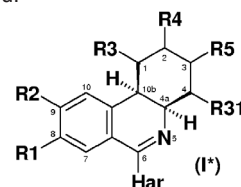
R5 ir ūdeņraža atoms,

Har ir 2,6-dimetokspiridin-3-ilgrupa,

vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls.

5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas attiecībā uz 4a. un 10b. pozīciju ir ar formulā (I\*)

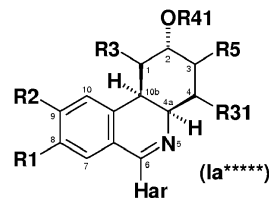
attēloto konfigurāciju:



vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls.

6. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas attiecībā uz 2., 4a. un 10b. pozīciju ir ar formulā (I\*\*\*\*\*)

attēloto konfigurāciju:



vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls.

7. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no (2R,4aR,10bR)-6-(2,6-dimetoksipiridin-3-il)-9-etoksi-8-metoksi-1,2,3,4,4a,10b-heksahydrofenantridin-2-ola vai šī savienojuma sāls, N-oksīda vai N-oksīda sāls.

8. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no (2R,4aR,10bR)-6-(2,6-dimetoksipiridin-3-il)-9-etoksi-8-metoksi-1,2,3,4,4a,10b-heksahydrofenantridin-2-ola vai šī savienojuma sāls.

9. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai slimību ārstēšanā.

10. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošanai slimību ārstēšanā.

11. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošanai slimību ārstēšanā.

12. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vienu vai vairākus savienojumu(-s) ar formulu (I) vai šī/šo savienojuma(-u) sāli, N-oksīdu vai N-oksīda sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai kopā ar parastām farmaceitiskām palīgvielām un/vai nesējvielām.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formulu (I) vai šī savienojuma sāli, N-oksīdu vai N-oksīda sāli saskaņā ar 7. pretenziju kopā ar parastām farmaceitiskām palīgvielām un/vai nesējvielām.

14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formulu (I) vai šī savienojuma sāli saskaņā ar 8. pretenziju kopā ar parastām farmaceitiskām palīgvielām un/vai nesējvielām.

15. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīda vai N-oksīda sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai psoriāzes vai atopiskās ekzēmas (atopiskā dermatīta) ārstēšanai.

16. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīda vai N-oksīda sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai cukura diabēta ārstēšanai.

17. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīda vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai cukura diabēta ārstēšanai.

18. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai cukura diabēta ārstēšanai.

19. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīda vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai psoriāzes ārstēšanai.

20. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai psoriāzes ārstēšanai.

21. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīda vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai atopiskās ekzēmas ārstēšanai.

22. Savienojuma ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošana farmaceitisku kompozīciju ražošanai atopiskās ekzēmas ārstēšanai.

23. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai psoriāzes vai atopiskās ekzēmas ārstēšanā.

24. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai cukura diabēta ārstēšanā.

25. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošanai cukura diabēta ārstēšanā.

26. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošanai cukura diabēta ārstēšanā.

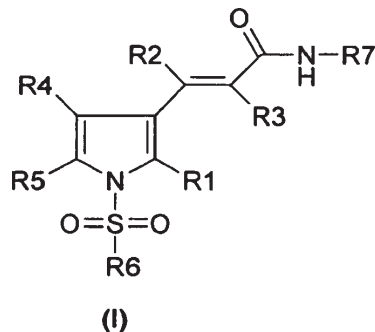
27. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošanai psoriāzes ārstēšanā.

28. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošanai psoriāzes ārstēšanā.

29. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls, N-oksīds vai N-oksīda sāls saskaņā ar 7. pretenziju izmantošanai atopiskās ekzēmas ārstēšanā.

30. Savienojums ar formulu (I) vai šī savienojuma sāls saskaņā ar 8. pretenziju izmantošanai atopiskās ekzēmas ārstēšanā.

- (51) **C07D 207/48**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1725528**  
 (21) 05716989.8 (22) 10.03.2005  
 (43) 29.11.2006  
 (45) 29.05.2013  
 (31) 04101003 (32) 11.03.2004 (33) EP  
 (86) PCT/EP2005/051086 10.03.2005  
 (87) WO 2005/087724 22.09.2005  
 (73) 4SC AG, Am Klopferspitz 19 a, 82152 Planegg - Martinsried, DE  
 (72) MAIER, Thomas, DE  
 BECKERS, Thomas, DE  
 BAER, Thomas, DE  
 GIMMICH, Petra, DE  
 DULLWEBER, Frank, DE  
 VENNEMANN, Matthias, DE  
 (74) Kilger, Ute, et al, Boehmert & Boehmert, Pettenkoferstrasse 20-22, 80336 München, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **SULFONILPIROLI KĀ HDAC (HISTONU DEACETILĀZES) INHIBITORI**  
**SULPHONYLPYRROLES AS HDAC INHIBITORS**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kur:

- R1 ir ūdeņraža atoms, 1-4C-alkilgrupa, halogēna atoms vai 1-4C-alkoksigrupa,  
 R2 ir ūdeņraža atoms vai 1-4C-alkilgrupa,  
 R3 ir ūdeņraža atoms vai 1-4C-alkilgrupa,  
 R4 ir ūdeņraža atoms, 1-4C-alkilgrupa, halogēna atoms vai 1-4C-alkoksigrupa,  
 R5 ir ūdeņraža atoms, 1-4C-alkilgrupa, halogēna atoms vai 1-4C-alkoksigrupa,  
 R6 ir -T1-Q1-grupa, kur:  
 T1 ir saite vai 1-4C-alkilēngrupa,  
 Q1 ir Ar1-grupa, Aa1-grupa, Hh1-grupa vai Ah1-grupa, kur:  
 Ar1 ir fenilgrupa vai ar R61- un/vai R62-aizvietota fenilgrupa, kur:  
 R61 ir 1-4C-alkilgrupa vai -T2-N(R611)R612-grupa, kur:  
 vai  
 T2 ir saite, un  
 R611 ir ūdeņraža atoms, 1-4C-alkilgrupa, hidroksi-2-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkoksi-2-4C-alkilgrupa, fenil-1-4C-alkilgrupa vai Har1-1-4C-alkilgrupa, kur:  
 Har1 ir iespējams aizvietota ar R6111-grupu un/vai R6112-grupu, un ir monocikliska vai kondensēta bicikliska 5- līdz 10-locekļu nepiesātināta heteroaromātiska gredzena grupa, kas satur vienu līdz trīs heteroatomus, katrs no tiem ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma, kur:  
 R6111 ir halogēna atoms vai 1-4C-alkilgrupa,  
 R6112 ir 1-4C-alkilgrupa, un  
 R612 ir halogēna atoms, 1-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkoksi-2-4C-alkilgrupa vai hidroksi-2-4C-alkilgrupa,  
 vai R611 kopā ar R612 un ar slāpekļa atomu, kuram ir pievienotas šīs grupas, veido heterociklisku gredzena grupu Het1, kur:  
 Het1 ir morfolinogrupa, tiomorfolinogrupa, S-okso-tiomorfolinogrupa, S,S-diookso-tiomorfolinogrupa, piperidinogrupa, pirolidinogrupa, piperazinogrupa vai 4N-(1-4C-alkil)-piperazinogrupa, vai

T2 ir 1-4C-alkilēngrupa vai 2-4C-alkilēngrupa, kurā iekļauts skābekļa atoms, un

R611 ir ūdeņraža atoms, 1-4C-alkilgrupa, hidroksi-2-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkoksi-2-4C-alkilgrupa, fenil-1-4C-alkilgrupa vai Har1-1-4C-alkilgrupa, kur:

Har1 ir iespējams aizvietota ar R6111-grupu un/vai R6112-grupu, un ir monocikliska vai kondensēta bicikliska 5- līdz 10-locekļu nepiesātināta heteroaromātiska gredzena grupa, kas satur vienu līdz trīs heteroatomus, katrs no tiem ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma, kur:

R6111 ir halogēna atoms vai 1-4C-alkilgrupa,

R6112 ir 1-4C-alkilgrupa, un

R612 ir ūdeņraža atoms, 1-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkoksi-2-4C-alkilgrupa vai hidroksi-2-4C-alkilgrupa,

vai R611 kopā ar R612 un ar slāpekļa atomu, kuram ir pievienotas šīs grupas, veido heterociklisku gredzena grupu Het1, kur:

Het1 ir morfolinogrupa, tiomorfolinogrupa, S-okso-tiomorfolinogrupa, S,S-dioksio-tiomorfolinogrupa, piperidinogrupa, piroolidinogrupa, piperazinogrupa, 4N-(1-4C-alkil)-piperazinogrupa, imidazologrupa, pirolologrupa vai pirazolologrupa,

R62 ir 1-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkoksigrupa, halogēna atoms, ciānogrupa, 1-4C-alkoksi-1-4C-alkilgrupa, 1-4C-alkilkarbonilaminogrupa vai 1-4C-alkilsulfonilaminogrupa,

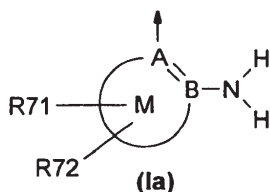
Aa1 ir bisarilgrupa, kas iegūta no divām arilgrupām, kas ir neatkarīgi izvēlētas no grupas, kas sastāv no fenilgrupas un naftilgrupas, un kas saistītas kopā ar vienkāršu saiti,

Hh1 ir bisheteroarilgrupa, kas iegūta no divām heteroarilgrupām, kas ir neatkarīgi izvēlētas no grupas, kas sastāv no monocikliskas 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupas, kas satur vienu vai divus heteroatomus, katrs no tiem ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma, un kuras saistītas kopā ar vienkāršu saiti,

Ah1 ir heteroaril-arilgrupa vai aril-heteroarilgrupa, kas iegūta no heteroarilgrupas, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no monocikliskas 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupas, kas satur vienu vai divus heteroatomus, katrs no tiem ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma, un arilgrupas, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no fenilgrupas un naftilgrupas, un rezultātā minētā heteroarilgrupa un arilgrupa saistās kopā ar vienkāršu saiti,

R7 ir hidroksilgrupa vai Cyc1-grupa, kur:

Cyc1-grupa ir gredzena sistēma ar formulu (Ia):



kur:

A ir oglekļa atoms,

B ir oglekļa atoms,

R71 ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, 1-4C-alkilgrupa vai 1-4C-alkoksigrupa,

R72 ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, 1-4C-alkilgrupa vai 1-4C-alkoksigrupa,

M ar A un B iekļaušanu ir gredzena grupa Ar2 vai gredzena grupa Har2, kur:

Ar2 ir benzola gredzena grupa,

Har2 ir monocikliska 5- vai 6-locekļu nepiesātināta heteroaromātiska gredzena grupa, kas satur vienu līdz trīs heteroatomus, katrs no tiem ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma, vai tā sāls.

14. Savienojums ar formulu (I), kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, vai tā farmakoloģiski pieņemams sāls, kuru izmanto slimību ārstēšanā.

15. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vienu vai vairākus savienojumus ar formulu (I), kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, vai tā farmakoloģiski pieņemamu sāli kopā ar parastām farmaceutiskām pildvielām un/vai nesējiem.

16. Savienojuma ar formulu (I), kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, vai tā farmakoloģiski pieņemama sāls izmantošana

farmaceutisku kompozīciju ražošanai slimību, kas reaģē uz vai kas ir jutīgas pret histonu deacetilāzes aktivitātes inhibēšanu, ārstēšanai.

17. Savienojuma ar formulu (I), kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, vai tā farmakoloģiski pieņemama sāls izmantošana farmaceutisku kompozīciju ražošanai celulārās neoplāzijas, kas ietver labdabīgu vai ļaundabīgu neoplāziju, ārstēšanai.

18. Izmantošana saskaņā ar 17. pretenziju, kur ļaundabīga neoplāzija ir izvēlēta no šādiem audzējiem, hematoloģiskiem audzējiem un pārmantotiem vēžiem, kas sastāv no krūts dziedzera vēža, urīnpūšļa vēža, kaulu vēža, smadzeņu vēža, centrālās un perifērās nervu sistēmas vēža, resnās zarnas vēža, endokrīno dziedzera vēža, kas ietver vairogdziedzera un virsnieru garozas vēzi, barības vada vēža, endometrija vēža, germinogēna vēža, galvas un kakla vēža, nieru vēža, aknu vēža, plaušu vēža, balsenes un rīkles apakšējās daļas (hipofarinks) vēža, mezoteliomas, olnīcu vēža, aizkuņģa dziedzera vēža, prostatas vēža, taisnās zarnas vēža, nieru vēža, tievās zarnas vēža, mīksto audu vēža, sēklinieka vēža, kuņģa vēža, ādas vēža, urīnvada vēža, maksts un vulvas vēža; retinoblastomas un Vilmsa audzēja, leukēmijas un limfomas agresīvajām un lēni augošām formām, ne-Hodžkina slimības, hroniskas un akūtas mieloleikozēs (CML/AML), akūtas limfoblastiskas leukēmijas (ALL), Hodžkina slimības, multiplās mielomas, T-šūnu limfomas, mielodisplastiskā sindroma, plazmas šūnu neoplāzijas, paraneoplastiskajiem sindromiem, nezināmas primāras lokalizācijas vēžiem un AIDS, kas saistīts ar malignizāciju.

19. Savienojuma ar formulu (I), kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, vai tā farmakoloģiski pieņemama sāls izmantošana farmaceutisku kompozīciju ražošanai slimības ārstēšanai, kas atšķiras no celulārās neoplāzijas, un kas ir jutīga pret histonu deacetilāzes inhibitoru terapiju.

20. Izmantošana saskaņā ar 19. pretenziju, kur neļaundabīga slimība ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no artropātijas un osteopātoloģiskiem stāvokļiem, piemēram, reimatoīdā artrīta, osteoartrīta, podagras, poliartīta un psoriātiskā artrīta, sistēmiskās sarkanās vilkēdes, gludo muskuļu šūnu proliferācijas, ieskaitot proliferatīvus asinsvadu traucējumus, aterosklerozes un restenozes, iekaisuma stāvokļiem un dermāliem stāvokļiem, piemēram, čūlainā kolīta, Krona slimības, alerģiskā rinīta, alerģiskā dermatīta, cistiskās fibrozes, hroniska bronhīta un astmas, endometriozes, dzemdes fibroīdiem, endometriālās hiperplāzijas un labdabīgas prostatas hiperplāzijas, sirds funkcijas traucējuma, imūnsupresīviem stāvokļiem, piemēram, HIV infekcijām, neiropātoloģiskiem traucējumiem, piemēram, Pārkinsona slimības, Alcheimera slimības vai ar poliglutamīnu saistītiem traucējumiem, patoloģiskiem traucējumiem, kuri pakļaujas ārstēšanai ar endogēnās gēnspresijas stimulēšanu, kā arī transgēna ekspresijas uzlabošanu gēnu terapijā.

- |      |  |      |                |
|------|--|------|----------------|
| (51) | <b>C07K 16/10</b> <sup>(2006.01)</sup>   | (11) | <b>2314620</b> |
|      | <b>C12N 15/63</b> <sup>(2006.01)</sup>   |      |                |
|      | <b>C12N 5/10</b> <sup>(2006.01)</sup>  |      |                |
|      | <b>C12N 15/13</b> <sup>(2006.01)</sup>   |      |                |
| (21) | 10180375.7   | (22) | 26.05.2005     |
| (43) | 27.04.2011   |      |                |
| (45) | 05.06.2013   |      |                |
| (31) | 575023 P   | (32) | 27.05.2004     |
|      | PCT/EP2005/050310  |      | 25.01.2005     |
|      | PCT/EP2004/052772  |      | 03.11.2004     |
|      | PCT/EP2004/052286  |      | 23.09.2004     |
|      | PCT/EP2004/051661  |      | 29.07.2004     |
|      | PCT/EP2004/050943  |      | 27.05.2004     |
|      | PCT/EP2005/050953  |      | 03.03.2005     |
| (62) | EP05747901.6 / EP1749029   |      |                |
| (73) | Crucell Holland B.V., Archimedesweg 4, 2333 CN, Leiden, NL   |      |                |
| (72) | BAKKER, Alexander, Berthold, Hendrik, NL<br>MARISSEN, Willem Egbert, NL<br>KRAMER, Robert Arjen, NL<br>DE KRUIF, Cornelis Adriaan, NL                                      |      |                |
| (74) | Manten, Annemieke, et al, Crucell Holland B.V., Archimedesweg 4-6, 2333 CN Leiden, NL<br>Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV |      |                |

(54) **PAŅĒMIENS SAISTOŠU MOLEKULU, KAS IR SPĒJĪGAS NEITRALIZĒT TRAKUMSĒRGAS VĪRUSU, IDENTIFICĒŠANAI**  
**METHOD OF IDENTIFYING BINDING MOLECULES CAPABLE OF NEUTRALIZING RABIES VIRUS**

(57) 1. Paņēmiens saistošas molekulas, kurai potenciāli piemīt neitralizējoša aktivitāte pret trakumsērgas vīrusu, vai nukleīnskābes molekulas, kas kodē saistošu molekulu, kurai potenciāli piemīt neitralizējoša aktivitāte pret trakumsērgas vīrusu, identificēšanai, kur minētais paņēmiens ietver šādas stadijas:

a) saistošu molekulu kolekcijas kontaktēšanu uz replicējamo ģenētisko pakešu virsmas ar trakumsērgas vīrusu tādos apstākļos, kas veicina saistīšanos, kur saistošo molekulu kolekcija tiek iegūta no RNS, kas tiek izdalīta no šūnām, kas iegūtas no cilvēka indivīda, kas ir vakcinēts pret trakumsērgu, vai kas ticis pakļauts trakumsērgas vīrusa iedarbībai;

b) saistošo molekulu, kas saistās pie trakumsērgas vīrusa, atdalīšanu un atkaliegūšanu no saistošajām molekulām, kas nesaistās;

c) vismaz vienas atkaliegūtas saistošas molekulas izolēšanu;

d) pārbaudīšanu, vai izdalītajai saistošajai molekulai piemīt neitralizējoša aktivitāte pret trakumsērgas vīrusu;

un turpmāk ietver saistošu molekulu, kas kodētas ar mainīgu smago 3-30 dīglu gēnu, sadalīšanas un atkaliegūšanas stadiju.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur trakumsērgas vīruss ir inaktivēts.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur saistošo molekulu kolekcija uz replicējamo ģenētisko pakešu virsmas ir vienkādes Fv bibliotēka.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kur objekts ir cilvēka indivīds, kas ticis vakcinēts pret trakumsērgu.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka replicējamā ģenētiskā pakete ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no fāgu daļiņas, baktērijas, rauga, sēnes, mikroorganisma sporas un ribosomas.

X<sub>5</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Thr un Ser;  
 X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala un Phe;  
 X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;  
 X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;  
 X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;  
 X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(b) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Thr un Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala un Phe;

X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;

X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;

X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;

X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(c) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala un Phe;

X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;

X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;

X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;

X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(d) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Ile, Val, Ala un Phe;

X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;

X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;

X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;

X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(e) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Ile, Val, Ala un Phe;

X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;

X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;

X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;

X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(f) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Ile, Val, Ala un Phe;

X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;

X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;

X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;

X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(g) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Ile, Val, Ala un Phe;

X<sub>7</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;

X<sub>8</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln un Asn;

X<sub>9</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;

X<sub>10</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

(h) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;

X<sub>5</sub> ir Ser;

X<sub>6</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Ile, Val, Ala un Phe;

(51) **C12N 15/19**<sup>(2006.01)</sup> (11) **2319928**

**C07K 14/52**<sup>(2006.01)</sup>

**C12N 5/10**<sup>(2006.01)</sup>

**C12N 1/21**<sup>(2006.01)</sup>

**A61K 38/19**<sup>(2006.01)</sup>

**A61P 7/06**<sup>(2006.01)</sup>

(21) 10011689.6 (22) 22.10.1999

(43) 11.05.2011

(45) 27.03.2013

(31) 105348 P (32) 23.10.1998 (33) US

(62) EP06022333.6 / EP1783222

EP99970998.3 / EP1124961

(73) Kirin-Amgen, Inc., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks CA 91320, US

(72) LIU, Chuan-Fa, US

FEIGE, Ulrich, US

CHEETHAM, Janet, US

(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **DIMĒRU TROMBOPOETĪNU PEPTIDOMIMĒTIKI, KAS PIESAISTA MP1 RECEPTORU, UN KAM PIEMĪT TROMBOPOĒTISKĀ AKTIVĪTĀTE**  
**DIMERIC THROMBOPOIETIN PEPTIDE MIMETICS BINDING TO MP1 RECEPTOR AND HAVING THROMBOPOIETIC ACTIVITY**

(57) 1. Savienojums, kas piesaista mp1 receptoru, atbilst struktūrai:

TMP<sub>1</sub>-(L<sub>1</sub>)<sub>n</sub>-TMP<sub>2</sub>,

kur TMP<sub>1</sub> peptīdā C-gals piesaista TMP<sub>2</sub> peptīdā C-galu ar L<sub>1</sub>, un kur katrs TMP<sub>1</sub> un TMP<sub>2</sub> ir neatkarīgi izvēlēti no kodola savienojumu grupas, kas atbilst struktūrai, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no:

(a) X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-X<sub>8</sub>-X<sub>9</sub>-X<sub>10</sub>,

kur:

X<sub>2</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Lys un Val;

X<sub>3</sub> ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;

X<sub>4</sub> ir Pro;



$X_7$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;  
 $X_8$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;  
 $X_9$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Tyr, Cys, Ala un Phe;  
 $X_{10}$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

un

(h)  $X_2$ - $X_3$ - $X_4$ - $X_5$ - $X_6$ - $X_7$ - $X_8$ - $X_9$ - $X_{10}$ ,

kur:

$X_2$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Glu, Asp, Lys un Val;  
 $X_3$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gly un Ala;  
 $X_4$  ir Pro;  
 $X_5$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Thr un Ser;  
 $X_6$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Ile, Val, Ala un Phe;  
 $X_7$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Arg un Lys;  
 $X_8$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Gln, Asn un Glu;  
 $X_9$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Trp, Tyr, Cys, Ala un Phe;  
 $X_{10}$  ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Leu, Val, Ala, Phe, Met un Lys;

un kur  $L_1$  ir saistītājs; un n ir 0 vai 1;

un tā fizioloģiski pieņemami sāļi.

11. Dimērs saskaņā ar 10. pretenziju, kas ir:

**TMP<sub>1</sub>-Gly<sub>3</sub>-Cys-Gly<sub>4</sub>-TMP<sub>2</sub>**

|

**TMP<sub>1</sub>-Gly<sub>3</sub>-Cys-Gly<sub>4</sub>-TMP<sub>2</sub>**

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, kuru izmanto:

(a) megakariocītu vai trombocītu palielināšanā pacientam, kam tā ir nepieciešama;

(b) trombocitopēnijas ārstēšanā pacientam, kam tā ir nepieciešama;

(c) idiopātiskas vai imūnas trombocitopēnijas (ITP) ārstēšanā pacientam, kam tā ir nepieciešama;

(d) mielodisplastiska sindroma ārstēšanā pacientam, kam tā ir nepieciešama.

15. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts:

(a) megakariocītu vai trombocītu palielināšanai pacientam, kam tā ir nepieciešama;

(b) trombocitopēnijas ārstēšanai pacientam, kam tā ir nepieciešama;

(c) idiopātiskas vai imūnas trombocitopēnijas (ITP) ārstēšanai pacientam, kam tā ir nepieciešama; vai

(d) mielodisplastiska sindroma ārstēšanai pacientam, kam tā ir nepieciešama.

17. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai kopā ar farmaceitiski pieņemamu nesēju.

18. Polinukleotīds, kas kodē savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai.

21. Vektors, kas ietver polinukleotīdu saskaņā ar 18. vai 19. pretenziju.

22. Saimniekšūna, kas ietver vektoru saskaņā ar 21. pretenziju.

25. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai iegūšanas paņēmiens, kurā ietilpst saimniekšūnas saskaņā ar jebkuru no 22. līdz 24. pretenzijai augšana piemērotā barotnē un savienojuma atdalīšana no minētās šūnas vai barotnes.

## Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

(Publikācijas saskaņā ar 1995. gada 30. marta LR Patentu likuma 19. panta trešo daļu)

Pieteikumi sakārtoti Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **C07K 16/42**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1610820**  
 (21) 04759018.7 (22) 29.03.2004  
 (43) 04.01.2006  
 (45) 08.09.2010  
 (45) 21.08.2013 (publikācija pēc iebilduma)  
 (31) 460659 P (32) 04.04.2003 (33) US  
 (86) PCT/US2004/009613 29.03.2004  
 (87) WO 2004/091658 28.10.2004  
 (73) Genentech, Inc., 1 DNA Way, South San Francisco CA 94080-4990, US  
 Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH  
 (72) LIU, Jun, US  
 SHIRE, Steven, US  
 (74) Kiddle, Simon John et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **AUGSTAS KONCENTRĀCIJAS ANTIVIELU UN PROTEĪNU SASTĀVI**  
**HIGH CONCENTRATION ANTIBODY AND PROTEIN FORMULATIONS**  
 (57) 1. Zemas opalescences stabils šķidrums sastāvs, kas satur:  
 (a) antivielu pret IgE daudzumā aptuveni 150 mg/ml, kur antivielu pret IgE ietver divas vienādas vieglās ķēdes un divas vienādas smagās ķēdes, katra vieglā ķēde satur aminoskābju sekvenci, kas identificēta kā E25 10A. zīm., un katra smagā ķēde satur aminoskābju sekvenci, kas identificēta kā E25 10B. zīm.; (b) arginīnu-HCl daudzumā 200 mM; (c) histidīnu daudzumā 20 mM; (d) polisorbātu daudzumā no 0,01 līdz 0,1 %, kur papildus sastāva pH ir 6,0.  
 3. Ražošanas produkts, kurā ietilpst trauks, kas ietver sastāvu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām.  
 7. Sastāva saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju izmantošana medikamenta iegūšanai ar IgE mediēta traucējuma ārstēšanai.  
 8. Sastāvs saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kuru izmanto ar IgE mediēta traucējuma ārstēšanas paņēmienā.  
 9. Izmantošana saskaņā ar 7. pretenziju vai sastāvs, kuru izmanto saskaņā ar 8. pretenziju, kur ar IgE mediētais traucējums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no alerģiskā rinīta, astmas, alerģiskās astmas, nealerģiskās astmas, atopiskā dermatīta un gastroenteropātijas.  
 11. Izmantošana saskaņā ar 7. pretenziju vai sastāvs, kuru izmanto saskaņā ar 8. pretenziju, kur ar IgE mediētais traucējums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no hipersensibilitātes, alerģiskas bronhopulmonālas aspergilozes, parazitārajām slimībām, intersticiālā cistīta, hiper-IgE sindroma, ataksijas-teleangiektāzijas, Viskota-Oldriča sindroma, aizkrūts dziedzera aplāzijas, IgE mielomas un transplantāta reakcijas pret saimnieku.  
 17. Izmantošana saskaņā ar 7. pretenziju vai sastāvs, kuru izmanto saskaņā ar 8. pretenziju, kur sastāvs ir kombinācijā ar antihistamīnu, bronhodilatatoru, glikokortikoīdu vai NSAID.

- (45) 21.08.2013 (publikācija pēc iebilduma)  
 (31) 200401312 (32) 31.05.2004 (33) ES  
 (86) PCT/EP2005/005841 31.05.2005  
 (87) WO 2005/115467 08.12.2005  
 (73) Almirall, S.A., Ronda del General Mitre 151, 08022 Barcelona, ES  
 (72) GRAS ESCARDO, Jordi, ES  
 LLENAS CALVO, Jesus, ES  
 RYDER, Hamish, ES  
 ORVIZ DIAZ, Pio, ES  
 (74) Srinivasan, Ravi Chandran, J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB  
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
 (54) **KOMBINĀCIJAS, KAS SATUR ANTIMUSKARĪNA LĪDZEKĻUS UN BETA-ADRENERĢISKUS AGONISTUS**  
**COMBINATIONS COMPRISING ANTIMUSCARINIC AGENTS AND BETA-ADRENERGIC AGONISTS**  
 (57) 1. Kombinācija, kas satur (a) ilgstošas darbības beta-2 agonistu un (b) M3 muskarīna receptoru antagonistu, kas ir 3(R)-(2-hidroksi-2,2-ditiēn-2-ilacetoksi)-1-(3-fenoksipropil)-1-azonij-biciklo[2.2.2]oktāns sāls formā ar anjonu X, kas ir farmaceitiski pieņemams mono vai daudzvērtīgas skābes anjons.  
 9. (a) Ilgstošas darbības beta-2 agonista, kā definēts jebkurā no 1. un 3. līdz 6. pretenzijai, un (b) M3 muskarīna receptoru antagonista, kā definēts 1. vai 2. pretenzijā, izmantošana medikamenta iegūšanai vienlaicīgai, līdztekus, atsevišķai vai secīgai ievadīšanai pacientam respiratorās slimības ārstēšanā, kas ir astma, akūts vai hronisks bronhīts, emfizēma vai hroniska obstruktīva plaušu slimība (HOPS).  
 10. Sastāvdaļu komplekts, kas satur (b) M3 muskarīna receptoru antagonistu, kā definēts 1. vai 2. pretenzijā, kopā ar instrukcijām vienlaicīgai, līdztekus, atsevišķai vai secīgai ievadīšanai kombinācijā ar (a) ilgstošas darbības beta-2 agonistu, kā definēts jebkurā no 1. un 3. līdz 6. pretenzijai, pacienta ārstēšanai, kas cieš no respiratoras slimības, kā definēts 9. pretenzijā, vai ir jutīgs pret to.  
 11. Iesaņojums, kas satur (b) M3 muskarīna receptoru antagonistu, kā definēts 1. vai 2. pretenzijā, un (a) ilgstošas darbības beta-2 agonistu, kā definēts jebkurā no 1. un 3. līdz 6. pretenzijai, vienlaicīgai, līdztekus, atsevišķai vai secīgai ievadīšanai respiratorās slimības ārstēšanā, kā definēts 9. pretenzijā.

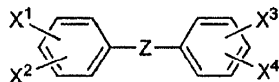
- (51) **A61K 45/00**<sup>(2006.01)</sup> (11) **1763368**  
**A61K 31/439**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61K 31/167**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61K 31/137**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 11/00**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 11/06**<sup>(2006.01)</sup>  
**A61P 11/08**<sup>(2006.01)</sup>  
 (21) 05750538.0 (22) 31.05.2005  
 (43) 21.03.2007  
 (45) 11.03.2009

## Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas

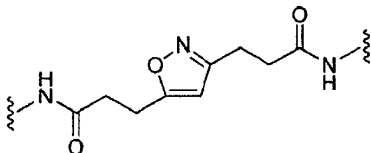
(Publikācijas saskaņā ar 2007. gada 15. februāra LR Patentu likuma 71. panta piekto daļu)

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **C07C 281/18**<sup>(200601)</sup> (11) **1778265**  
**C07D 333/38**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 38/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 05785277.4 (22) 17.08.2005  
 (43) 02.05.2007  
 (45) 24.04.2013  
 (31) 601992 P (32) 17.08.2004 (33) US  
 (86) PCT/US2005/029301 17.08.2005  
 (87) WO2006/023586 02.03.2006  
 (73) Ferring B.V., Polaris Avenue 144, 2132 JX Hoofddorp, NL  
 (72) SIELECKI-DZURDZ, Thais, M., US  
 (74) Horner, Martin Grenville, et al, Marks & Clerk LLP, Aurora, 120 Bothwell Street, Glasgow G2 7JS, GB  
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **GUANILHIDRAZONA SAVIENOJUMI, KOMPOZĪCIJAS, IEGŪŠANAS PAŅĒMIENI UN IZMANTOŠANA**  
**GUANYLHYDRAZONE COMPOUNDS, COMPOSITIONS, METHODS OF MAKING AND USING**
- (57) 1. Savienojums ar formulu:



vai tā sāls,  
 kur X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup> un X<sup>4</sup> katrs ir NH<sub>2</sub>C(=NH)-NH-N=CCH<sub>3</sub>-, un  
 kur Z ir:

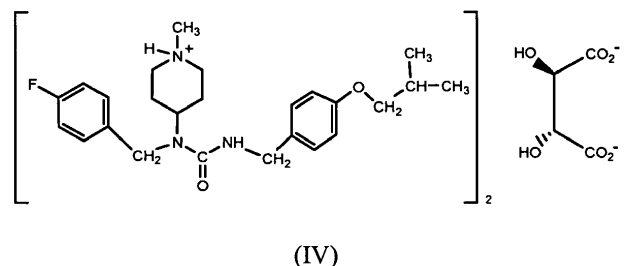


2. Kompozīcija, kas satur savienojumu, kā noteikts 1. pretenzijā, vai tā sāli, un vismaz vienu farmaceitiski pieņemamu nesēju, palīgvielu, adjuvantu vai šķīdinātāju.
3. Kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kur savienojums ir sāls veidā.
4. Savienojums, kā noteikts 1. pretenzijā, izmantošanai par medikamentu.
5. Savienojums, kā noteikts 1. pretenzijā, izmantošanai par medikamentu TNF $\alpha$ , NO vai to abu atbrīvošanās inhibēšanai.
6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kur medikaments ir medikaments TNF $\alpha$  atbrīvošanās inhibēšanai.
7. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kur medikaments ir medikaments NO atbrīvošanās inhibēšanai.
8. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanā.
9. Izmantošana saskaņā ar 8. pretenziju, kur medikaments ir medikaments TNF $\alpha$ , NO vai to abu atbrīvošanās inhibēšanai.
10. Izmantošana saskaņā ar 8. pretenziju, kur medikaments ir medikaments TNF $\alpha$  atbrīvošanās inhibēšanai.
11. Izmantošana saskaņā ar 8. pretenziju, kur medikaments ir medikaments NO atbrīvošanās inhibēšanai.
12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir sāls veidā.
13. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kur sāls ir savienojuma pievienotās skābes sāls ar vienu vai vairākām skābēm, kas izvēlētas no šādas virknes: sālsskābe, bromūdeņražskābe, sērskābe, fosforskābe, etiķskābe, citronskābe, skābeņskābe, malonskābe, salicilskābe, p-aminosalicilskābe, ābolskābe, fumarātskābe, dzintar-

skābe, askorbīnskābe, maleīnskābe, sulfonskābe, fosfonskābe, perhlorskābe, slāpekļskābe, skudrskābe, propionskābe, glikonskābe, pienskābe, vīnskābe, hidroksimaleīnskābe, pirovīnogskābe, feniletīķskābe, benzoskābe, p-aminobenzoskābe, p-hidroksibenzoskābe, metānsulfonskābe, etānsulfonskābe, slāpekļpaskābe, hidroksietānsulfonskābe, etilēnsulfonskābe, p-toluolsulfonskābe, naftilsulfonskābe, sulfanīlskābe, kamparsulfonskābe, hīnskābe, mandeļskābe, o-metilmandeļskābe, hidrogēnbenzolsulfonskābe, pikrīnskābe, adipīnskābe, d-o-tolilvīnskābe, tartronskābe, a-toluīlskābe, (o, m, p)-toluīlskābe, naftilamīnsulfonskābe un to kombinācija.

14. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kur sāls ir viena vai vairākas no šādu sāļu formām: mukāts, izetionāts, acetāts, glutamāts, L-laktāts, L-tartrāts, tozilāts, mezilāts, fumarāts, maleāts, citrāts vai sulfāts, vai to kombinācija.

- (51) **C07D 211/58**<sup>(200601)</sup> (11) **1794126**  
**A61K 31/4468**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 25/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 7/02**<sup>(200601)</sup>
- (21) 05805643.3 (22) 26.09.2005  
 (43) 13.06.2007  
 (45) 20.03.2013  
 (31) 614014 P (32) 27.09.2004 (33) US  
 (86) PCT/US2005/034813 26.09.2005  
 (87) WO2006/037043 06.04.2006  
 (73) Acadia Pharmaceuticals Inc., 3911 Sorrento Valley Blvd., San Diego, CA 92121-1402, US  
 (72) THYGESEN, Mikkel, DK  
 SCHLIENGER, Nathalie, DK  
 TOLF, Bo-Ragnar, SE  
 ANDERSSON, Carl-Magnus, A., SE  
 BLATTER, Fritz, CH  
 BERGHAUSEN, Jorg, DE
- (74) Jones Day, Rechtsanwältte, Attorneys-at-Law, Patentanwältte, Prinzregentenstrasse 11, 80538 München, DE  
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **N-(4-FLUORBENZIL)-N-(1-METILPIPERIDIN-4-IL)-N'-(4-(2-METILPROPILOKSI)FENILMETIL)KARBAMĪDA HEMI-TARTRĀTA KRISTĀLISKA FORMA**  
**CRYSTALLINE FORM OF N-(4-FLUOROBENZYL)-N-(1-METHYLPIPERIDIN-4-YL)-N'-(4-(2-METHYLPROPYLOXY)PHENYLMETHYL)CARBAMIDE HEMI-TARTRATE**
- (57) 1. N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta ar formulu (IV) kristāliska forma,



kas

- (a) rāda pulvera rentgenstaru difraktogrammu, kas satur pīķa maksimumus ar d-lielumiem angstrēmos apmēram 12,0, 10,7, 5,86, 4,84, 4,70, 4,57 un 3,77; vai
- (b) rāda endotermisku signālu pie 177°C ar kušanas entalpiju apmēram 129 J/g, kā noteikts saskaņā ar diferenciālo skenēšanas kalorimetriju.
2. Kristāliska forma saskaņā ar 1. pretenziju, kur kristāliskās formas tīrības pakāpe ir vismaz apmēram 70 %.
3. Kristāliska forma saskaņā ar 2. pretenziju, kur kristāliskās formas tīrības pakāpe ir vismaz apmēram 80 %.
4. Kristāliska forma saskaņā ar 3. pretenziju, kur kristāliskās formas tīrības pakāpe ir vismaz apmēram 90 %.
5. Kristāliska forma saskaņā ar 4. pretenziju, kur kristāliskās formas tīrības pakāpe ir vismaz apmēram 95 %.

6. Kristāliska forma saskaņā ar 5. pretenziju, kur kristāliskās formas tīrības pakāpe ir vismaz apmēram 98 %.

7. Kristāliska forma saskaņā ar 1. pretenziju, kur kristāliskā forma rāda pulvera rentgenstaru difraktogrammu, kas satur piķa maksimumus ar d-lielumiem angstrēmās apmēram 12,0, 10,7, 7,4, 6,9, 6,6, 6,2, 5,86, 5,53, 5,28, 5,16, 4,84, 4,70, 4,57, 4,38, 4,09, 3,94, 3,77, 3,71, 3,49, 3,46, 3,25, 3,08 un 2,93.

8. Kristāliska forma saskaņā ar 1. pretenziju, kur kristāliskās formas pirmā sadalīšana tiek novērota diferenciālajā skenēšanas kalorimetrijā pie temperatūras augstākas par 170°C.

9. Kristāliska forma saskaņā ar 1. pretenziju, kuru var iegūt ar paņēmieni, kas ietver:

N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta kristāliskas formas vai N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta kristālisku formu maisījumu suspendēšanu polārā un aprotonā šķīdinātājā pie temperatūras no apmēram 30 līdz 70°C;

suspensijas maisīšanu, pievienojot kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju kristalizācijas aizmetņus; un kristāliskās cietas vielas izolēšanu no suspensijas.

10. Kristāliska forma saskaņā ar 1. pretenziju, kuru var iegūt ar paņēmieni, kas ietver:

N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta sāls šķīdināšanu tetrahidrofurānā vai acetona pie temperatūras apmēram no 0 līdz 70°C;

iegūtā šķīduma maisīšanu pie temperatūras no apmēram 50 līdz 70°C, pievienojot kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju kristalizācijas aizmetņus;

iegūtās suspensijas dzesēšanu ar dzesēšanas ātrumu apmēram no 5 līdz 15°C stundā, sasniedzot temperatūru robežās no apmēram -20°C līdz istabas temperatūrai; un kristāliskās cietas vielas izolēšana no suspensijas.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur kristālisku formu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu nesēju vai atšķaidītāju.

12. Kristāliska forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai monoamīna receptora aktivitātes inhibēšanai.

13. Kristāliska forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai neiropsihiatrisku slimību ārstēšanai.

14. Kristāliska forma izmantošanai saskaņā ar 13. pretenziju, kur neiropsihiatriskā slimība ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no psihozes, šizofrēnijas, šizoafektīviem traucējumiem, mānijas, psihotiskas depresijas, afektīviem traucējumiem, demences, nemiera sajūtas, miega traucējumiem, ēstgribas traucējumiem, bipolāra traucējuma, psihozes kā hipertensijas sekas, migrēnas, vazospazmām un išēmijas, motoriskā tika, trīces, psihomotorās attīstības aiztures, bradikinēzijas un neiroipātiskām sāpēm.

15. Kristāliska forma izmantošanai saskaņā ar 14. pretenziju, kur neiropsihiatriskā slimība ir šizofrēnija.

16. Kristāliska forma izmantošanai saskaņā ar 14. pretenziju, kur neiropsihiatriskā slimība ir psihoze.

17. Kristāliska forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai neiroleģeneratīvu slimību ārstēšanai.

18. Kristāliska forma izmantošanai saskaņā ar 17. pretenziju, kur neiroleģeneratīvā slimība ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Pārkinsona slimības, Hantingtona slimības, Alcheimera slimības, spinocerebrālas atrofijas, Tureta sindroma, Frīdriha ataksijas, Mahado-Jozefa slimības, Levī ķermenīšu demences, distonijas, progresīvas supranukleāras paralīzes un frontotemporālas demences.

19. Kristāliska forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai diskinēzijas, kas asociēta ar dopamīnerģisko terapiju, ārstēšanai.

20. Kristāliska forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai distonijas, mioklonijas vai trīces, kas asociēta ar dopamīnerģisko terapiju, ārstēšanai.

21. Kristāliska forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai trombotiska stāvokļa ārstēšanai.

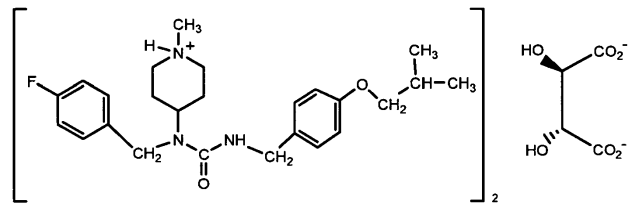
22. Kristāliska forma izmantošanai saskaņā ar 21. pretenziju, kur trombotiskais stāvoklis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no miokarda infarkta, trombotiskas vai išēmiskas triekas, idiopātiskas un trombotiskas trombocitopēniskas purpuras, perifēro asinsvadu slimības un Reino sindroma.

23. Kristāliskās formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošana farmaceutiskas kompozīcijas iegūšanai, kas paredzēta monoamīna receptora aktivitātes inhibēšanai.

24. Kristāliskās formas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošana farmaceutiskas kompozīcijas iegūšanai, kas paredzēta neiropsihiatrisku slimību; neiroleģeneratīvu slimību; diskinēzijas, kas asociēta ar dopamīnerģisko terapiju; distonijas, mioklonijas vai trīces, kas asociēta ar dopamīnerģisko terapiju; vai trombotiska stāvokļa ārstēšanai.

25. Paņēmieni kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

savienojuma ar formulu (IV) cietas formas suspendēšanu aprotonā šķīdinātājā:



(IV)

suspensijas maisīšanu, pievienojot kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju kristalizācijas aizmetņus; un kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju izolēšanu no suspensijas.

26. Paņēmieni saskaņā ar 25. pretenziju, kur šķīdinātāja temperatūra suspendēšanas stadijas laikā ir no apmēram 30 līdz 100°C.

27. Paņēmieni saskaņā ar 25. pretenziju, kur aprotonais šķīdinātājs ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no viena vai vairākiem alifātiskiem vai cikliskiem ēteriem, karbonskābes esteriem, laktoniem, alkāniem un alifātiskiem C<sub>3-8</sub> ketoniem.

28. Paņēmieni saskaņā ar 25. pretenziju, kur kristalizācijas aizmetņu pievienošanu veic pie temperatūras no apmēram 40 līdz 80°C.

29. Paņēmieni saskaņā ar 25. pretenziju, kas turpmāk ietver suspensijas dzesēšanu ar ātrumu no apmēram 0,1 līdz 1°C/minūtē.

30. Paņēmieni saskaņā ar 25. pretenziju, kur suspensija tiek dzesēta līdz apmēram istabas temperatūrai.

31. Paņēmieni kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta kristāliskas formas vai N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta kristālisku formu maisījumu suspendēšanu polārā un aprotonā šķīdinātājā pie temperatūras no apmēram 30 līdz 70°C;

suspensijas maisīšanu, pievienojot kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju kristalizācijas aizmetņus; un kristāliskās cietas vielas izolēšanu no suspensijas.

32. Paņēmieni kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

N-(4-fluorbenzil)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-N'-(4-(2-metilpropiloksi)fenilmetil)karbamīda hemi-tartrāta sāls šķīdināšanu šķīdinātājā pie temperatūras no apmēram 0 līdz 70°C;

iegūtā šķīduma maisīšanu pie temperatūras no apmēram 50 līdz 70°C, pievienojot kristāliskās formas saskaņā ar 1. pretenziju kristalizācijas aizmetņus;

iegūtās suspensijas dzesēšanu ar dzesēšanas ātrumu no apmēram 5 līdz apmēram 15°C stundā, sasniedzot temperatūru robežās no apmēram -20°C līdz istabas temperatūrai; un kristāliskās cietas vielas izolēšana no suspensijas.

33. Paņēmieni saskaņā ar 32. pretenziju, kur šķīdinātājs ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tetrahidrofurāna, acetona, dihlormetāna, 1,4-diksoāna, etanola, izopropanola un acetonitrila.

(51) **A61K 31/135**<sup>(200601)</sup>**A61K 38/02**<sup>(200601)</sup>**A61P 25/28**<sup>(200601)</sup>

(21) 06720863.7

(11) **1848415**

(22) 17.02.2006



- (43) 31.10.2007  
 (45) 03.04.2013  
 (31) 654012 P (32) 17.02.2005 (33) US  
 (86) PCT/US2006/005741 17.02.2006  
 (87) WO2006/089164 24.08.2006  
 (73) TEVA PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD., 5 Basel Street, P.O. Box 3190, 49131 Petach-Tikva, IL  
 (72) KREITMAN, Rivka, US  
 HAYARDENY, Liat, IL  
 LEVY, Ruth, IL  
 BLAUGRUND, Eran, IL  
 (74) Nachshen, Neil Jacob, D Young & Co LLP, 120 Holborn, London EC1N 2DY, GB  
 Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga LV-1083, LV  
 (54) **KOMBINĒTĀ TERAPIJA AR GLATIRAMERA ACETĀTU UN RASAGILĪNU IZKAISĪTĀS SKLEROZES ĀRSTĒŠANAI COMBINATION THERAPY WITH GLATIRAMER ACETATE AND RASAGILINE FOR THE TREATMENT OF MULTIPLE SCLEROSIS**
- (57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur glatiramera acetātu un rasagilīnu vai farmaceutiski pieņemamu sāli, lai mazinātu simptomu, kas parādās izkaisītās sklerozes formā, periodiski ievadot pacientam farmaceutisku kompozīciju.
2. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur glatiramera acetātu, lai mazinātu simptomu, kas parādās izkaisītās sklerozes formā, kombinācijā ar rasagilīnu vai farmaceutiski pieņemamu sāli, periodiski ievadot pacientam farmaceutisku kompozīciju un rasagilīnu vai farmaceutiski pieņemamu sāli.
3. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur rasagilīnu vai farmaceutiski pieņemamu sāli, lai mazinātu simptomu, kas parādās izkaisītās sklerozes formā, kombinācijā ar glatiramera acetātu, periodiski ievadot pacientam farmaceutisku kompozīciju un glatiramera acetātu.
4. Kompozīciju pakete i) un ii) simptomu, kas parādās izkaisītās sklerozes formā, mazināšanai, kas ietver sekojošo:
- i) pirmā farmaceutiskā kompozīcija, kas satur glatiramera acetātu un farmaceutiski pieņemamu nesēju;
- ii) otrā farmaceutiskā kompozīcija, kas satur rasagilīnu vai farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu nesēju; un
- iii) pirmās un otrās farmaceutiskās kompozīcijas norādījumi lietošanai kopā, lai mazinātu simptomu, kas parādās izkaisītās sklerozes formā.
5. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai pakete izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kur izkaisītās sklerozes forma ir recidivējoši remitējoša izkaisītā skleroze.
6. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai 5. pretenziju vai pakete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 5. pretenzijai, kur simptoms ir recidivējoša atkārtšanās, klīnisko paasinājumu atkārtšanās vai fiziskās invaliditātes veidošanās.
7. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. vai no 5. līdz 6. pretenzijai vai pakete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 5. pretenzijai, kur glatiramera acetāta saturs ir robežās no 10 līdz 600 mg/nedēļā.
8. Farmaceutiska kompozīcija vai pakete izmantošanai saskaņā ar 7. pretenziju, kur glatiramera acetāta saturs ir 300 mg/nedēļā.
9. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. vai no 5. līdz 8. pretenzijai vai pakete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 8. pretenzijai, kur glatiramera acetāta saturs ir robežās no 50 līdz 150 mg/dienā.
10. Farmaceutiska kompozīcija vai pakete izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, kur glatiramera acetāta saturs ir 100 mg/dienā.
11. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. vai no 5. līdz 6. pretenzijai vai pakete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 6. pretenzijai, kur glatiramera acetāta saturs ir robežās no 10 līdz 80 mg/dienā.
12. Farmaceutiska kompozīcija vai pakete izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju, kur glatiramera acetāta saturs ir 20 mg/dienā.
13. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. vai no 5. līdz 12. pretenzijai vai pakete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 12. pretenzijai, kur rasagilīna vai

farmaceutiski pieņemama sāls daudzums ir robežās no 0,01 līdz 100 mg/dienā.

14. Farmaceutiska kompozīcija vai pakete izmantošanai saskaņā ar 13. pretenziju, kur rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls daudzums ir robežās no 2 mg/dienā.

15. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 3. vai no 5. līdz 14. pretenzijai, kur periodiski katru dienu pacientam ievada glatiramera acetātu.

16. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 3. vai no 5. līdz 14. pretenzijai, kur periodiski divreiz dienā pacientam ievada pusi no glatiramera acetāta daudzuma.

17. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 3. vai no 5. līdz 14. pretenzijai, kur glatiramera acetātu pacientam ievada periodiski no katras 5. līdz 9. dienai.

18. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 3. vai no 5. līdz 17. pretenzijai, kur glatiramera acetāta ievadīšana būtībā notiek pirms rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls ievadīšanas.

19. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 3. vai no 5. līdz 17. pretenzijai, kur rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls ievadīšana notiek pirms glatiramera acetāta ievadīšanas.

20. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 3. vai no 5. līdz 19. pretenzijai, kur glatiramera acetāta ievadīšana notiek subkutāni, intraperitoneāli, intravenozi, intramuskulāri, intraokulāri vai perorāli un rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls ievadīšana notiek perorāli.

21. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 20. pretenziju, kur glatiramera acetāta ievadīšana notiek subkutāni un rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls ievadīšana notiek perorāli.

22. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kur glatiramera acetāta daudzums ir robežās no 10 līdz 600 mg.

23. Pakete izmantošanai saskaņā ar 22. pretenziju, kur glatiramera acetāta daudzums ir 300 mg.

24. Pakete izmantošanai saskaņā ar 22. pretenziju, kur glatiramera acetāta daudzums ir 20 mg.

25. Pakete izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju un jebkuru no 22. līdz 24. pretenzijai, kur rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls daudzums ir robežās no 0,1 līdz 100 mg.

26. Pakete izmantošanai saskaņā ar 25. pretenziju, kur rasagilīna vai farmaceutiski pieņemama sāls daudzums ir 2 mg.

27. Produkts, kas satur glatiramera acetātu un rasagilīnu kā kombinētu preparātu vienlaicīgai, atsevišķai vai secīgai izmantošanai terapijā.

28. Produkts izmantošanai saskaņā ar 27. pretenziju vienlaicīgai, atsevišķai vai secīgai izmantošanai izkaisītās sklerozes terapijai.

29. Produkts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 27. līdz 28. pretenzijai, kur lietošana seko ik pēc 24 stundu intervāla.

30. Produkts izmantošanai saskaņā ar 29. pretenziju, kur intervāls ir no 1 līdz 12 stundām.

31. Produkts izmantošanai saskaņā ar 30. pretenziju, kur intervāls ir 2 stundas.

32. Produkts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 27. līdz 28. pretenzijai, kur lietošana notiek atsevišķi.

33. Produkts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 27. līdz 28. pretenzijai, kur lietošana notiek vienlaicīgi.

34. Glatiramera acetāts un rasagilīns izkaisītās sklerozes ārstēšanai, kur glatiramera acetātu un rasagilīnu ievada vienlaicīgi, atsevišķi vai secīgi.

35. Glatiramera acetāts un rasagilīns izmantošanai saskaņā ar 34. pretenziju, kur glatiramera acetātu un rasagilīnu ievada ik pēc 24 stundu intervāla.

36. Glatiramera acetāts un rasagilīns izmantošanai saskaņā ar 35. pretenziju, kur intervāls ir no 1 līdz 12 stundām.

37. Glatiramera acetāts un rasagilīns izmantošanai saskaņā ar 36. pretenziju, kur intervāls ir 2 stundas.

38. Glatiramera acetāts un rasagilīns izmantošanai saskaņā ar 34. pretenziju, kur glatiramera acetāts un rasagilīns tiek ievadīts atsevišķi.

39. Glatiramera acetāts un rasagilīns izmantošanai saskaņā ar 34. pretenziju, kur glatiramera acetāts un rasagilīns tiek ievadīts vienlaicīgi.

40. Rasagilīns izkaisītās sklerozei ārstēšanai pacientam, kura ārstēšanai izmanto glatiramera acetātu izkaisītās sklerozei ārstēšanai.

41. Rasagilīns izkaisītās sklerozei ārstēšanai pacientu populācijai, kuras ārstēšanai izmanto glatiramera acetātu.

- (51) **C12Q 1/68**<sup>(200601)</sup> (11) **1856295**  
 (21) 06748221.6 (22) 16.02.2006  
 (43) 21.11.2007  
 (45) 03.04.2013  
 (31) RM20050068 (32) 17.02.2005 (33) IT  
 137935 25.05.2005 US  
 (86) PCT/US2006/005792 16.02.2006  
 (87) WO2006/089203 24.08.2006  
 (73) TrovaGene, Inc., 11055 Flintkote Avenue, San Diego, CA 92121, US  
 (72) MELKONYAN, Hovsep, US  
 CANNAS, Angela, IT  
 TOMEI, Louis, David, IT  
 UMANSKY, Samuil, R., US  
 (74) Roques, Sarah Elizabeth, J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB  
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
 (54) **KOMPOZĪCIJAS UN METODES VĪRUSU SPECIFISKU NUKLEĪNSKĀBJU DETEKTĒŠANAI URĪNĀ COMPOSITIONS AND METHODS FOR DETECTING VIRAL SPECIFIC NUCLEIC ACIDS IN URINE**

(57) 1. Metode vīrusu infekcijas diagnosticēšanai pacientam, kur šī metode ietver ārpusšūnu frakciju atdalīšanu no urīna parauga, kas iegūts no minētā pacienta, un vienas vai vairāku transrenālā vīrusa nukleīnskābju klātbūtnes detektēšanu minētajā ārpusšūnu frakcijā, tādējādi diagnosticējot vīrusu infekciju minētajā pacientā, kur minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābe ir fragments vai fragmenti, kas ir mazāki aptuveni par 1000 bāzes pāriem vai 1000 nukleotīdiem, ja veic denaturāciju.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētās transrenālā vīrusa nukleīnskābes ir DNS.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur posmu, kurā veic minēto transrenālā vīrusa nukleīnskābju kvantitatīvo noteikšanu.

4. Metode saskaņā ar 3. pretenziju, kur minēto kvantitatīvo noteikšanu veic ar paņēmienu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no konjugācijas ar molekulārām zondēm, kuras ir specifiskas pret šiem patogēnajiem līdzekļiem, hibridizācijas, polimerāzes ķēdes reakcijas (PCR), PCR ar iekšējo praimēšanu, PCR ar daļēju iekšējo praimēšanu, vienpavediena konformācijas polimorfisma (SSCP), ligāzes ķēdes reakcijas (LCR) un amplifikācijas ar ķēdes pārvietošanu (SDA).

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētā atdalīšana ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no minētā urīna parauga filtrēšanas un centrifugēšanas.

6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābju garums ir mazāks aptuveni par 500 bāzes pāriem (bp).

7. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētās transrenālā vīrusa nukleīnskābes satur DNS fragmentus, un minēto fragmentu garums ir aptuveni 100 līdz aptuveni 200 bp.

8. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur posmu, kur minētās transrenālā vīrusa nukleīnskābes izolē vai attīra.

9. Metode saskaņā ar 8. pretenziju, kur minēto attīrīšanu veic ar ķīmiskām vai fizikālām metodēm.

10. Metode saskaņā ar 8. pretenziju, kurā minēto izolēšanu vai attīrīšanu veic ar metodi, kas izvēlēta no rindas, kas sastāv no ekstrahēšanas ar organiskiem šķīdinātājiem, filtrēšanas, nogulsnešanas, absorbcijas uz cietas matricas ar afinitāti pret nukleīnskābēm, un hromatogrāfijas.

11. Metode saskaņā ar 10. pretenziju, kurā minētās cietās matricas sastāv no sveķiem uz silīcija dioksīda pamata, jonu apmaiņas sveķiem vai hidroksiapatīta.

12. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, kurā minētā cietā matrice ir sveķi uz silīcija dioksīda pamata un minēto izolēšanu vai attīrīšanu veic haotropa līdzekļa klātbūtnē.

13. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur urīna parauga iepriekšēju apstrādi ar vienu vai vairākiem līdzekļiem, kuri inhibē nukleīnskābju sairšanu.

14. Metode saskaņā ar 13. pretenziju, kurā minētie līdzekļi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no jonu helatējošiem līdzekļiem, denaturējošiem līdzekļiem un jonu deterģentiem.

15. Metode saskaņā ar 14. pretenziju, kur minētie jonu helatējošie līdzekļi ir EDTA; minētie denaturējošie līdzekļi ir guanidīna HCl vai guanidīna izotiocianāts; un minētie jonu deterģenti ir N-laurilsarkozīns vai nātrija dodecilsulfāts.

16. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābju klātbūtnes detektēšanu veic ar metodi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no nukleīnskābju hibridizācijas, cikliskās zondes reakcijas, PCR, SSCP, LCR un SDA.

17. Metode saskaņā ar 16. pretenziju, kurā minētā PCR ir ar iekšējo praimēšanu vai PCR ar daļēju iekšējo praimēšanu.

18. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābe ir atvasināta no RNS vai DNS vīrusa.

19. Metode saskaņā ar 18. pretenziju, kurā minētais vīruss ir integrēts vai episomāls.

20. Metode saskaņā ar 18. pretenziju, kurā minētais vīruss ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no rekombinanta un dabiska HIV-1, HIV-2, variolas vīrusa, poliovīrusa, herpes simplex vīrusa (HSV), Epstein-Barr vīrusa (EBV), C hepatīta vīrusa (HCV), B hepatīta vīrusa (HBV) un adenovīrusa (AAV).

21. Metode saskaņā ar 18. pretenziju, kur minētais vīruss ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no EBV un HIV-1.

22. Metode saskaņā ar 18. pretenziju, kur minētais vīruss ir HIV-1.

23. Metode saskaņā ar 8. pretenziju, kurā minēto izolēto vai attīrīto nukleīnskābi izmanto minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābes detektēšanai.

24. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur minēto metodi izmanto *in vitro*, un minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābe ir HIV nukleīnskābe.

25. Metode saskaņā ar 24. pretenziju, kur minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābes minēto detektēšanu veic ar polimerāzes ķēdes reakciju (PCR).

26. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kur minētā PCR ir ar iekšējo praimēšanu vai PCR ar daļēju iekšējo praimēšanu.

27. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kurā minēto polimerāzes ķēdes reakciju veic, izmantojot vienu vai vairākus praimērus, kuri ir specifiski pret HIV-1 GAG vai POL gēnu.

28. Metode saskaņā ar 27. pretenziju, kurā vienu vai vairākus praimērus izvēlas no rindas, kas sastāv no SEQ ID NO: 1 līdz 11.

29. Metode vīrusu infekcijas novērošanai pacientā, kur šī metode ietver:

a) pirmās ārpusšūnu frakcijas atdalīšanu no pirmā urīna parauga, ko iegūst no minētā pacienta, un transrenālā vīrusa nukleīnskābes daudzuma noteikšanu minētajā pirmajā ārpusšūnu frakcijā;

b) otrās ārpusšūnu frakcijas atdalīšanu no otrā urīna parauga, ko iegūst no minētā pacienta, un transrenālā vīrusa nukleīnskābes daudzuma noteikšanu minētajā otrajā ārpusšūnu frakcijā;

c) minētās transrenālā vīrusa nukleīnskābes daudzuma salīdzināšanu minētajā pirmajā un minētajā otrajā ārpusšūnu frakcijā, tādējādi novērojot vīrusu infekciju minētajā pacientā, kur minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābe ir fragments vai fragmenti, kas ir mazāki aptuveni par 1000 bāzes pāriem vai 1000 nukleotīdiem, ja veic denaturāciju.

30. Metode saskaņā ar 29. pretenziju, kur minētais pacients ir pakļauts ārstēšanai ar savienojumu, kas samazina vai inhibē minēto vīrusu infekciju.

31. Metode saskaņā ar 30. pretenziju, kur minētā vīrusu infekcija ir HIV infekcija un minētais savienojums ir pretvīrusu līdzeklis.

32. Metode saskaņā ar 29. pretenziju, kur minēto daudzumu noteikšanu, veic ar paņēmienu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no konjugācijas ar molekulārām zondēm, kuras ir specifiskas pret šiem patogēnajiem līdzekļiem, hibridizāciju, PCR, PCR ar iekšējo praimēšanu, PCR ar daļēju iekšējo praimēšanu, SSCP, LCR un SDA.

33. Metode saskaņā ar 29. pretenziju, kurā minētā atdalīšana ietver minētā urīna parauga centrifugēšanu.

34. Metode saskaņā ar 29. pretenziju, kurā minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābes satur DNS fragmentus, un minēto fragmentu garums ir aptuveni 100 līdz aptuveni 200 bp.

35. Metode saskaņā ar 29. pretenziju, kur minētais pacients ir pakļauts recidivējošas vīrusu infekcijas attīstīšanās riskam.

36. Komplekts transrenālā vīrusa nukleīnskābes klātbūtnes noteikšanai urīna paraugā, kur minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābe ir fragments vai fragmenti, kas ir mazāki aptuveni par 1000 bāzes pāriem vai 1000 nukleotīdiem, ja veic denaturāciju, kur minētais komplekts satur līdzekļus minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābes izolēšanai vai attīrīšanai urīna parauga ārpusēnu frakcijā, kas ietver cieta matrici un līdzekli, kas inhibē minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābes sairšanu, un līdzekļus minētā transrenālā vīrusa nukleīnskābes klātbūtnes noteikšanai ar hibridizāciju ar vismaz vienu vīrusam specifisku zondi.

37. Komplekts saskaņā ar 36. pretenziju, kurā minētā vīrusam specifiskā zonde satur praimeru polimerāzes ķēdes reakcijai.

38. Komplekts saskaņā ar 36. pretenziju, kurā minētais praimers ir specifisks pret HIV-1 GAG vai POL gēnu.

- (51) **A61K 31/221**<sup>(200601)</sup> (11) **1874288**  
**A61P 25/02**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06754750.5 (22) 18.04.2006  
 (43) 09.01.2008  
 (45) 17.07.2013
- (31) 05009056 (32) 26.04.2005 (33) EP  
 114224 26.04.2005 US
- (86) PCT/EP2006/061632 18.04.2006  
 (87) WO2006/114372 02.11.2006
- (73) SIGMA-TAU Industrie Farmaceutiche Riunite S.p.A., Viale Shakespeare 47, 00144 Roma, IT
- (72) CALVANI, Menotti, IT  
 AMATO, Antonino, US
- (74) Spadaro, Marco, et al, Cantaluppi & Partners, Viale della Tecnica, 205, 00144 Roma, IT
- (54) **ACETIL-L-KARNITĪNS SĀPĪGAS PERIFĒRĀS DIABĒTISKĀS NEIROPĀTIJAS NOVĒRŠANAI**  
**ACETYL L-CARNITINE FOR PREVENTING PAINFUL PERIPHERAL DIABETIC NEUROPATHY**
- (57) 1. Acetil-L-karnitīna vai kāda tā farmaceitiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta gatavošanai sāpīgas perifērās neiropātijas novēršanai pacientiem, kas cieš no 2. tipa diabēta, turklāt minētā sāpīgā perifērā neiropātija ir raksturīga ar simptomiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no sāpēm, parestēzijas un/vai hiperestēzijas.
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt acetil-L-karnitīna farmaceitiski pieņemamais sāls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no hlorīda, bromīda, orotāta, skābā aspartāta, skābā citrāta, magnija citrāta, skābā fosfāta, fumarāta un skābā fumarāta, magnija fumarāta, laktāta, maleāta un skābā maleāta, mukāta, skābā oksalāta, pamoāta, skābā pamoāta, skābā sulfāta, gliukozes fosfāta, tartrāta, skābā tartrāta, magnija tartrāta, 2-aminoetānsulfonāta, magnija 2-aminoetānsulfonāta, holīna tartrāta un trihloracetāta.
3. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt acetil-L-karnitīns tiek ievadīts perorāli devā vismaz 3 grami/dienā.

- (51) **A61K 47/48**<sup>(200601)</sup> (11) **1877098**
- (21) 06727008.2 (22) 04.05.2006  
 (43) 16.01.2008  
 (45) 24.04.2013
- (31) 0509226 (32) 05.05.2005 (33) GB  
 680542 P 13.05.2005 US
- (86) PCT/GB2006/001635 04.05.2006  
 (87) WO2006/117567 09.11.2006
- (73) Chroma Therapeutics Limited, 93 Milton Park, Abingdon, Oxfordshire OX14 4RY, GB
- (72) DAVIDSON, Alan Hornsby, GB  
 DRUMMOND, Alan Hastings, GB  
 NEEDHAM, Lindsey Ann, GB
- (74) Simons, Amanda Louise, et al, J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB

Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **AR KARBOKSILESTERĀZI HIDROLIZĒJAMI ALFA AMINOSKĀBES ESTERA UN ZĀĻU KONJUGĀTI**  
**ALPHA AMINOACID ESTER-DRUG CONJUGATES**  
**HYDROLYSABLE BY CARBOXYLESTERASE**

(57) 1. Kovalents alfa aminoskābes estera un mērķa iekššūnu enzīma histona deacetilāzes aktivitātes inhibitora konjugāts izmantošanai cilvēka vai dzīvnieka ķermeņa terapeitiskas ārstēšanas paņēmienā, kur: konjugāta estera grupa ir hidrolizējama ar vienu vai vairākiem iekššūnu karboksilesterāzes enzīmiem līdz attiecīgajai skābei; aminoskābes estera aminogrupas slāpekļis nav tieši saistīts ar karbonilgrupas fragmentu vai ir atstāts neaizvietots; un alfa aminoskābes esteris ir konjugēts līdz inhibitoram pozīcijā attālināti no inhibitora un histona deacetilāzes enzīma sasaistīšanās zonas, kur konjugēšanas zona ir attālināta, ja konjugāta aktivitāte šūnu aktivitātes testā ir vismaz tikpat liela kā nekonjugēta inhibitora aktivitāte tajā pašā testā, kur šūnu aktivitātes tests ir šūnu proliferācijas inhibēšanas tests, ko veic U937 vēža šūnās.

2. Kovalents alfa aminoskābes estera un mērķa iekššūnu enzīma histona deacetilāzes aktivitātes inhibitora konjugāts izmantošanai cilvēka vai dzīvnieka ķermeņa terapeitiskas ārstēšanas paņēmienā, kur: konjugāta estera grupa ir hidrolizējama ar vienu vai vairākiem iekššūnu karboksilesterāzes enzīmiem līdz attiecīgajai skābei; aminoskābes estera aminogrupas slāpekļis nav tieši saistīts ar karbonilgrupu vai ir atstāts neaizvietots; un alfa aminoskābes esteris ir konjugēts līdz inhibitoram tā, ka konjugētā inhibitora un minētās attiecīgās skābes sasaistīšanās ar histona deacetilāzes enzīmu ir tāda pati, kā nekonjugētam inhibitoram, kur sasaistīšanās veids ir tāds pats, ja konjugāta aktivitāte šūnu aktivitātes testā ir vismaz tikpat liela kā nekonjugēta inhibitora aktivitāte tajā pašā testā, kur šūnu aktivitātes tests ir šūnu proliferācijas inhibēšanas tests, ko veic U937 vēža šūnās.

3. Kovalents konjugāts izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur konjugāts ir paredzēts izmantošanai proliferatīva traucējuma ārstēšanai.

4. Kovalents konjugāts izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur kovalenti konjugēts alfa aminoskābes esteris nav konjugēta inhibitora dipeptīdu motīva C gala elements.

5. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur inhibitori ir tāds, kas nekovalenti saistās ar histona deacetilāzes enzīmu.

6. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur alfa aminoskābes esteris ir kovalenti konjugēts ar inhibitoru caur saistītājgrupu.

7. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur alfa aminoskābes esteris ir konjugēts ar inhibitoru caur aminoskābes estera aminogrupu.

8. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur alfa aminoskābes esteris ir konjugēts ar inhibitoru caur aminoskābes estera alfa oglekli.

9. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur esteris ir hidrolizējams ar šūnām, kas satur vienu vai vairākus iekššūnu karboksilesterāzes enzīmus hCE-1, hCE-2 un hCE-3, līdz attiecīgajai aminoskābei.

10. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur esteris ir hidrolizējams ar šūnām, kas satur iekššūnu karboksilesterāzes enzīmu hCE-1, līdz attiecīgajai aminoskābei, bet ne ar šūnām, kas satur hCE-2 vai hCE-3.

11. Konjugāts izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur aminoskābes estera aminogrupas slāpekļis ir aizvietots, bet nav tieši saistīts ar karbonilgrupu.

12. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai cilvēka vai dzīvnieka ķermeņa terapeitiskas ārstēšanas paņēmienā, kur kompozīcija satur konjugātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

13. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 12. pretenziju, kas ir piemērota lokālai ievadīšanai un kur konjugāts (a) ja alfa aminoskābes esteris ar inhibitoru ir saistīts caur tā aminogrupu, tad oglekļa atoms, kas ir blakus alfa aminoskābes estera alfa ogleklim, ir vienaizvietots, vai (b) ja alfa aminoskābes esteris ar inhibitoru ir saistīts caur aminoskābes oglekļa atomu, tad oglekļa atoms, kas ir blakus šim aminoskābes oglekļa atomam, nav aizvietots.



14. *In vitro* paņēmieni mērķa iekššūnu enzīma histona deacetilāzes inhibitora iekššūnu aktivitātes palielināšanai un/vai noturēšanas laika selektīvai pagarināšanai makrofāgos un/vai monocītos attiecībā pret citiem šūnu tipiem, kurā jauktu šūnu populāciju apstrādā ar inhibitora konjugātu saskaņā ar 11. pretenziju.

15. Paņēmieni mērķa iekššūnu enzīma histona deacetilāzes aktivitātes dotā inhibitora alfa aminoskābes estera kovalenta konjugāta identificēšanai, kur minētajam konjugātam ir palielināta vai pagarināta šūnu aktivitāte attiecībā pret doto inhibitoru, kur metode:

(i) identificē pozīciju vai pozīcijas uz mērķa iekššūnu enzīma histona deacetilāzes aktivitātes dotā inhibitora vai uz vairākiem mērķa iekššūnu enzīma histona deacetilāzes aktivitātes dotajiem inhibitoriem ar vienādu sasaistīšanās veidu ar mērķa histona deacetilāzes enzīmu, kur minētā pozīcija vai pozīcijas ir attālinātas no sasaistīšanas zonas starp inhibitoru(-iem) un mērķa histona deacetilāzes enzīmu;

(ii) kovalenti modificē inhibitoru(-s), alfa aminoskābes estera grupai vai vairākām dažādām alfa aminoskābes estera grupām pievienojoties vienā vai vairākās (i) stadijā minētajās pozīcijās;

(iii) testē (ii) stadijā iegūtos ar alfa aminoskābi konjugētos inhibitorus, nosakot to aktivitāti pret mērķa histona deacetilāzes enzīmu; un

(iv) no (iii) stadijā iegūtajiem datiem izvēlas vienu vai vairākas no testētām alfa aminoskābes estera konjugāta versijām minētajam inhibitoram(-iem), kuras izraisa histona deacetilāzes aktivitātes modulāciju šūnās, tiek pārvērstas attiecīgajās karbonskābēs un kā attiecīgās karbonskābes uzkrājas šūnās, un kuras uzrāda palielinātu vai pagarinātu šūnu aktivitāti.

rindas, kas sastāv no AKT signālu pārnese ceļa, NF-κB signālu pārnese ceļa un mitogēna aktivētas proteīnu kināzes (MAPK) signālu pārnese ceļa, un minēto CD40L mediēta CD40 signālu pārnese ceļa biomarkieri izvēlas no rindas, kas sastāv no fosfo-PI3K proteīna, fosfo-PDK1 proteīna, fosfo-AKT proteīna, fosfo-MEK proteīna, fosfo-ERK proteīna, fosfo-p38 proteīna, fosfo-IKKα/β proteīna, fosfo-IκB proteīna un aktivēta NF-κB; un

(iii) šūnu izdzīvošanas biomarkiera, kur minēto šūnu izdzīvošanas biomarkieri izvēlas no rindas, kas sastāv no antiapoptozes proteīna, kas ir Bcl-2 saimes loceklis, IAP apoptozes inhibitora proteīna un ar TNF receptoru saistīta faktora-1 (TRAF-1); un

d) minētā vismaz viena biomarkiera līmeni minētajā testa bioloģiskajā paraugā salīdzina ar minētā vismaz viena biomarkiera līmeni minētajā kontroles bioloģiskajā paraugā, kur minētais kontroles bioloģiskais paraugs nebija kontaktējies ar minēto anti-CD40 terapeitisko līdzekli, kur

(i) vismaz viena no minēto apoptozes biomarkieru līmeņa palielinājums; un/vai

(ii) vismaz viena no minētajiem CD40L-mediētajiem CD40 signālu pārnese ceļu vismaz viena no minētajiem biomarkieriem līmeņa samazinājums; un/vai

(iii) vismaz viena no minēto šūnu izdzīvošanas biomarkieru līmeņa samazinājums

minētajā testa bioloģiskajā paraugā salīdzinājumā ar kontroles bioloģisko paraugu norāda uz pacientu, kuram būtu lietderīga ārstēšana ar minēto anti-CD40 terapeitisko līdzekli, un kur minētais anti-CD40 terapeitiskais līdzeklis ir antagonista anti-CD40 monoklonāla antivielas vai tās antigēnu saistošs fragments, kas spēj specifiski saistīties ar cilvēka CD40 antigēnu, kas ir izteikts uz cilvēka B šūnu virsmas un ir brīvs no būtiskas agonista aktivitātes, sasaistoties ar CD40 antigēnu, kas ir izteikts uz minēto B šūnu virsmas.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētās CD40 izteicošās šūnas tika stimulētas *ex vivo* ar CD40 ligandu pirms minētā kontaktēšanās posma.

3. Metode saskaņā ar 2. pretenziju, kur minēto CD40 ligandu izvēlas no rindas, kas sastāv no šķīstoša CD40L un membrānu saistīta CD40L.

4. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā antagonista anti-CD40 monoklonālā antivielas vai tās antigēnu saistošais fragments ir brīvs no būtiskas agonista aktivitātes vienā šūnu atbildē.

5. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā antagonista anti-CD40 monoklonālā antivielas vai tās antigēnu saistošais fragments ir brīvs no būtiskas agonista aktivitātes vairāk kā vienas šūnu atbildes eksperimentos.

6. Metode saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur minētā antagonista anti-CD40 antivielas vai tās antigēnu saistošais fragments darbojas kā antagonists vismaz vienā B šūnu atbildē, izvēloties no rindas, kas sastāv no B šūnu proliferācijas, B šūnu diferenciācijas, antivielas producēšanas, starpšūnu adhēzijas, B šūnu atmiņas ģenerēšanas, izotipa pārslēgšanas, MHC klases II un CD80/86 ekspresijas uz šūnu virsmas stimulācijas un proiekaisuma citokīnu sekrēcijas.

7. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minēto sašķelto kaspāzes proteīnu izvēlas no rindas, kas sastāv no sašķeltās kaspāzes-3, sašķeltās kaspāzes-7 un sašķeltās kaspāzes-9.

8. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur šūnu virsmas PS detektē ar krāsošanu ar aneksīnu V un kur genoma DNS fragmentāciju detektē ar TUNEL krāsošanu.

9. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minēto MAPK signālu pārnese ceļu izvēlas no rindas, kas sastāv no MEK/ERK signālu pārnese ceļa un MEK/p38 signālu pārnese ceļa.

10. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minēto Bcl-2 saimes locekli izvēlas no rindas, kas sastāv no Bcl-xl un Mcl-1.

11. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai 10. pretenziju, kur minēto IAP apoptozes inhibitoru proteīnu izvēlas no rindas, kas sastāv no survivīna, XIAP un cIAP1.

12. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētajā testa bioloģiskajā paraugā un minētajā kontroles bioloģiskajā paraugā detektē arī vismaz viena CD40 signālu pārnese citokīna marķiera līmeni.

- |      |   |      |                          |               |
|------|---|------|--------------------------|---------------|
| (51) | <b>G01N 33/564</b> <sup>(200601)</sup><br><b>G01N 33/68</b> <sup>(200601)</sup><br><b>A61P 37/00</b> <sup>(200601)</sup>  | (11) | <b>1889065</b>           |               |
| (21) | 06770605.1  | (22) | 18.05.2006               |               |
| (43) | 20.02.2008  |      |                          |               |
| (45) | 10.07.2013  |      |                          |               |
| (31) | 682575 P<br>749336 P  | (32) | 18.05.2005<br>09.12.2005 | (33) US<br>US |
| (86) | PCT/US2006/019325   |      | 18.05.2006               |               |
| (87) | WO2006/125117   |      | 23.11.2006               |               |
| (73) | Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH<br>XOMA Technology Ltd., 2910 Seventh Street, Berkeley CA 94701, US  |      |                          |               |
| (72) | AUKERMAN, Sharon, Lea, US<br>JALLAL, Bahija, US<br>LUQMAN, Mohammad, US   |      |                          |               |
| (74) | Marshall, Cameron John, et al, Carpmaels & Ransford, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB<br>Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV   |      |                          |               |
| (54) | <b>METODES SLIMĪBU AR AUTOIMŪNU UN/VAI IEKAISUMA KOMPONENTI DIAGNOSTICĒŠANAI UN ĀRSTĒŠANAI METHODS FOR DIAGNOSIS AND TREATMENT OF DISEASES HAVING AN AUTOIMMUNE AND/OR INFLAMMATORY COMPONENT</b>   |      |                          |               |
| (57) | 1. Metode pacienta, kuram ir iekaisuma slimība vai autoimūna slimība, kas atbild uz ārstēšanu ar anti-CD40 terapeitisku līdzekli, identificēšanai, kur minētajā metodē:<br>a) no minētā pacienta iegūst testa bioloģisku paraugu un kontroles bioloģisku paraugu, kur minētais bioloģiskais paraugs un minētais kontroles paraugs satur CD40 izteicošās šūnas, kuras tika stimulētas ar CD40 ligandu;<br>b) minēto testa bioloģisko paraugu pakļauj kontaktam ar efektīvu minētā anti-CD40 terapeitiska līdzekļa daudzumu;<br>c) detektē vismaz viena biomarkiera līmeni minētajā testa bioloģiskajā paraugā, kur minēto biomarkieri izvēlas no rindas, kas sastāv no:<br>(i) šūnu apoptozes biomarkiera, kur minēto apoptozes biomarkieri izvēlas no rindas, kas sastāv no sašķelta kaspāzes proteīna, sašķeltas poli-ADP-ribozes polimerāzes, fosfotildiserīna šūnu virsmas ekspresijas (PS), genoma DNA fragmentācijas un jebkuras to kombinācijas;<br>(ii) CD40L mediēta CD40 signālu pārnese ceļa biomarkiera, kur minēto CD40L mediēto CD40 signālu pārnese ceļu izvēlas no |      |                          |               |



13. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, kur minēto citokīna marķieri izvēlas no rindas, kas sastāv no vaskulārās endoteliālās augšanas faktora (VEGF), interleikīna (IL)-6, IL-8, IL-10, granulocītu monocītu kolonijas stimulējošā faktora (GM-CSF), audzēja nekrozes faktora- $\alpha$  (TNF- $\alpha$ ), monocītu hemoatraktanta proteīna-1 (MCP-1) un makrofāga iekaisuma proteīna-1 $\beta$  (MIP-1 $\beta$ ).

14. Metode saskaņā ar 12. vai 13. pretenziju, kur vismaz viena no minētajiem citokīnu marķieriem līmeņa samazinājums minētajā testa bioloģiskajā paraugā salīdzinājumā ar minēto kontroles bioloģisko paraugu norāda uz pacientu, kuram būtu lietderīga ārstēšana ar minēto anti-CD40 terapeitisko līdzekli.

15. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā anti-CD40 monoklonālā antivielā spēj specifiski saistīties ar cilvēka CD40 antigēnu, kas tiek izteikts uz CD40 izteicošo šūnu virsmas, līdz ar to modulējot antivielas atkarīgas šūnu mediētas citotoksicitātes (ADCC) aktivitāti, un kur minētais biomarķieris ir apoptozes biomarķieris.

16. Metode saskaņā ar 15. pretenziju, kur vismaz viena no minētajiem apoptozes biomarķieriem līmeņa palielinājums minētajā testa bioloģiskajā paraugā salīdzinājumā ar minēto kontroles bioloģisko paraugu norāda uz pacientu, kuram būtu lietderīga ārstēšana ar minēto anti-CD40 antivielu.

17. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā pacienta bioloģiskajā paraugā papildus detektē CD40 ekspresijas līmeni uz šūnu virsmas, CD40L ekspresijas līmeni uz šūnu virsmas vai abus uz CD40 izteicošajām šūnām minētajā bioloģiskajā paraugā.

18. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur papildus detektē cirkulējošā šķīstošā CD40 vai cirkulējošā šķīstošā CD40L līmeni bioloģiskajā paraugā, ko iegūst no pacienta.

19. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā biomarķiera līmeņa detektēšana ietver antivielas izmantošanu, lai detektētu biomarķiera proteīna ekspresiju.

20. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā biomarķiera līmeņa detektēšana ietver nukleīnskābes hibridizāciju.

21. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētā biomarķiera līmeņa detektēšana ietver kvantitatīvas RT-PCR veikšanu.

22. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minēto anti-CD40 antivielu vai tās antigēnu saistošo fragmentu izvēlas no rindas, kas sastāv no:

a) antivielas vai tās antigēnu saistoša fragmenta, kas saistās ar epitopu, kurš satur cilvēka CD40 secības SEQ ID NO: 10 vai SEQ ID NO: 12 82. - 87. atlikumu; un

b) antivielas vai tās antigēnu saistoša fragmenta, kas saistās ar epitopu, kurš satur cilvēka CD40 secības SEQ ID NO: 10 vai SEQ ID NO: 12 82. - 89. atlikumu.

23. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, minēto antagonista anti-CD40 monoklonālo antivielu vai tās antigēnu saistošo fragmentu izvēlas no rindas, kas sastāv no:

(i) antivielas vai tās antigēnu saistoša fragmenta, kas satur vieglās ķēdes variablu domēnu, kurš satur SEQ ID NO: 2 komplementaritāti noteicoša rajona (CDR) atlikumus, un smagās ķēdes variablu domēnu, kurš satur SEQ ID NO: 4 komplementaritāti noteicoša rajona (CDR) atlikumus; un

(ii) antivielas vai tās antigēnu saistoša fragmenta, kas satur vieglās ķēdes variablu domēnu, kurš satur SEQ ID NO: 6 komplementaritāti noteicoša rajona (CDR) atlikumus, un smagās ķēdes variablu domēnu, kurš satur SEQ ID NO: 7 komplementaritāti noteicoša rajona (CDR) atlikumus.

24. Metode saskaņā ar 23. pretenziju, kur minētā antivielā vai tās antigēnu saistošais fragments satur aminoskābes secību, izvēloties no rindas, kas sastāv no:

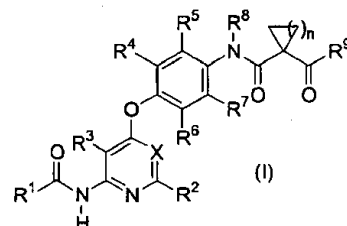
- (i) SEQ ID NO: 2;
- (ii) SEQ ID NO: 4;
- (iii) SEQ ID NO: 5;
- (iv) SEQ ID NO: 2 un SEQ ID NO: 4;
- (v) SEQ ID NO: 2 un SEQ ID NO: 5;
- (vi) SEQ ID NO: 6;
- (vii) SEQ ID NO: 7;
- (viii) SEQ ID NO: 8;
- (ix) SEQ ID NO: 6 un SEQ ID NO: 7; un
- (x) SEQ ID NO: 6 un SEQ ID NO: 8,

vai tās antigēnu saistošu fragmentu, kur minētais fragments saglabā spēju specifiski saistīties ar cilvēka CD40 antigēnu.

25. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minēto anti-CD40 antivielas antigēnu saistošo fragmentu izvēlas no rindas, kas sastāv no Fab fragmenta, F(ab')<sub>2</sub> fragmenta, Fv fragmenta un vienas ķēdes Fv fragmenta.

26. Metode saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minēto iekaisuma slimību vai minēto autoimūno slimību izvēlas no rindas, kas sastāv no sistēmiskas sarkanās vilkēdes (SLE), diskoidā lupus, lupus nefrīta, sarkoidozes, jauniešu artrīta, reimatoīdā artrīta, psoriāzes artrīta, Reitera sindroma, ankilozējošā spondilīta, podagras artrīta, orgāna vai audu transplantāta tremes, transplantāts-pret-saimnieku slimības, multiplās sklerozes, hiper-IgE sindroma, nodozā poliarterīta, primārās biliārās aknu cirozes, iekaisīgu zarnu slimības, Krona slimības, celiakijas (glutēna sensitīvās anteropātijas), autoimūnā hepatīta, perniciozās anēmijas, autoimūnās hemolītiskās anēmijas, psoriāzes, sklerodermas, *Myasthenia gravis*, autoimūnās trombocitopēniskās purpuras, autoimūna tiroidīta, Greivsa slimības, Hašimoto tiroidīta, imūnās kompleksās slimības, hroniskā noguruma imūnās disfunkcijas sindroma (CFIDS), polimiozīta un dermatomiozīta, krieglobulīnēmijas, trombozes, kardiomiopātijas, vienkāršās pūšlodes, plaušu intersticiālās fibrozes, sarkoidozes, I un II tipa cukura diabēta, 1., 2., 3. un 4. tipa aizkavētas hipersensitivitātes, alerģijas vai alerģiskiem traucējumiem, astmas, Čerģa-Strosa sindroma (alerģiskās granulomatozes), atopiskā dermatīta, alerģiskā un kairinošā kontakta dermatīta, nātrēnes, IgE pastarpinātas alerģijas, aterosklerozes, vaskulīta, idiopātiskajām iekaisuma miopātijām, hemolītiskās slimības, Alcheimera slimības un hroniskās iekaisuma demielinizējošās polineuropātijas.

- (51) **C07D 213/75<sup>(200601)</sup>** (11) **1889836**  
**A61K 31/4409<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/496<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/506<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/5377<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 35/00<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 35/04<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 43/00<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 239/47<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 401/12<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 401/14<sup>(200601)</sup>**
- (21) 06796594.7 (22) 21.08.2006  
(43) 20.02.2008  
(45) 12.06.2013  
(31) 710671 P (32) 24.08.2005 (33) US  
(86) PCT/JP2006/316331 21.08.2006  
(87) WO2007/023768 01.03.2007  
(73) Eisai R&D Management Co., Ltd., 6-10, Koishikawa 4-chome Bunkyo-ku, Tokyo 112-8088, JP  
(72) MATSUSHIMA, Tomohiro, JP  
TAKAHASHI, Keiko, JP  
FUNASAKA, Setsuo, JP  
OBAISHI, Hiroshi, JP  
SHIROTORI, Shuji, JP  
(74) HOFFMANN EITL, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE  
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
(54) **JAUNS PIRIDĪNA ATVASINĀJUMS UN PIRIMIDĪNA ATVASINĀJUMS (3)**  
**NOVEL PYRIDINE DERIVATIVE AND PYRIMIDINE DERIVATIVE (3)**  
(57) 1. Savienojums, kas attēlots ar šādu formulu, tā sāls vai hidrāts:



kurā:

R<sup>1</sup> apzīmē 3- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

- (1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,
- (2) kas satur no 3 līdz 10 atomiem gredzenā,
- (3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā,

kur grupa ir ierobežota līdz grupai, kas satur slāpekļa atomu kā gredzenu veidojošu atomu, un slāpekļa atomam ir valences saite, vai līdz grupai, kas attēlota ar formulu NR<sup>11a</sup>R<sup>11b</sup>, kur R<sup>11a</sup> un R<sup>11b</sup> var būt vienādi vai dažādi, un katrs apzīmē ūdeņraža atomu, C<sub>1-6</sub>alkilgrupu, C<sub>3-6</sub>alkenilgrupu, C<sub>3-6</sub>alkinilgrupu, C<sub>3-10</sub>cikloalkilgrupu, kas apzīmē mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, C<sub>6-10</sub>arilgrupu, 5- līdz 10-locekļu heteroarilgrupu vai 4- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

(1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,

(2) kas satur no 4 līdz 10 atomiem gredzenā,

(3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā, un R<sup>11a</sup> un R<sup>11b</sup> var būt aizvietoti ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, un R<sup>1</sup> var būt aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B;

R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> apzīmē ūdeņraža atomu;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> var būt vienādi vai dažādi, un katrs apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu, hidroksilgrupu, ciāngrupu, trifluorometilgrupu, C<sub>1-6</sub>alkilgrupu, C<sub>2-6</sub>alkenilgrupu, C<sub>2-6</sub>alkinilgrupu, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupu, aminogrupu, mono-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupu vai grupu, kas attēlota ar formulu -CO-R<sup>12</sup>, kur R<sup>12</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, C<sub>1-6</sub>alkilgrupu, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupu, aminogrupu, mono-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupu vai di-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupu;

R<sup>8</sup> apzīmē ūdeņraža atomu vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupu;

R<sup>9</sup> apzīmē 3- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

- (1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,
- (2) kas satur no 3 līdz 10 atomiem gredzenā,
- (3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā,

kur grupa ir ierobežota līdz grupai, kas satur slāpekļa atomu kā gredzenu veidojošu atomu, un slāpekļa atomam ir valences saite, vai līdz grupai, kas attēlota ar formulu NR<sup>11a</sup>R<sup>11b</sup>, kur R<sup>11a</sup> un R<sup>11b</sup> nozīmes ir iepriekšminētās, un R<sup>9</sup> var būt aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B; n apzīmē veselu skaitli 1 vai 2; un

X apzīmē grupu ar formulu -C(R<sup>10</sup>)= vai slāpekļa atomu, kur R<sup>10</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu, ciāngrupu, C<sub>1-6</sub>alkilgrupu, C<sub>2-6</sub>alkenilgrupu, C<sub>2-6</sub>alkinilgrupu vai grupu ar formulu -CO-R<sup>12</sup>, kur R<sup>12</sup> nozīme ir iepriekšminētā;

kur aizvietotāju grupa A sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, merkaptogrupas, nitrogrupas, ciāngrupas un oksogrupas;

kur aizvietotāju grupa B sastāv no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>2-6</sub>alkenilgrupas, C<sub>2-6</sub>alkinilgrupas, C<sub>3-10</sub>cikloalkilgrupas, kas apzīmē mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, C<sub>6-10</sub>arilgrupu, 5- līdz 10-locekļu heteroarilgrupu, 3- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

(1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,

(2) kas satur no 3 līdz 10 atomiem gredzenā,

(3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupu, C<sub>3-6</sub>alkeniloksigrupu, C<sub>3-6</sub>alkiniloksigrupu, C<sub>3-10</sub>cikloalkoksigrupu, kas apzīmē mono- vai diciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, ar gala skābekļa atomu, C<sub>6-10</sub>ariloksigrupu, 5- līdz 10-locekļu heteroariloksigrupu, 4- līdz 10-locekļu nearomātisku heterocikliloksigrupu, C<sub>1-6</sub>alkiltiogrupu, C<sub>3-6</sub>alkeniltiogrupu, C<sub>3-6</sub>alkiniltiogrupu, C<sub>3-10</sub>cikloalkiltiogrupu, kas apzīmē mono- vai diciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, ar gala sēra atomu, C<sub>6-10</sub>ariltiogrupu, 5- līdz 10-locekļu heteroariltiogrupu, 4- līdz 10-locekļu nearomātisku heterocikliltiogrupu un grupu ar formulu -T<sup>1</sup>-T<sup>2</sup>-T<sup>3</sup>, un katra aizvietotāju grupa B var būt aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas C, kur T<sup>1</sup> apzīmē tiešu saiti vai C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu, T<sup>2</sup> apzīmē karbonilgrupu, sulfīnīlgrupu, sulfonilgrupu, grupu ar formulu -C(=O)-O-, grupu ar formulu -O-C(=O)-, grupu ar formulu -SO<sub>2</sub>-O-, grupu ar formulu -O-SO<sub>2</sub>-, grupu ar formulu -NR<sup>T1</sup>-, grupu ar formulu -C(=O)-NR<sup>T1</sup>-, grupu ar formulu -NR<sup>T1</sup>-C(=O)-, grupu ar formulu -SO<sub>2</sub>-NR<sup>T1</sup>- vai grupu ar formula -NR<sup>T1</sup>-SO<sub>2</sub>-, T<sup>3</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, C<sub>1-6</sub>alkilgrupu, C<sub>3-6</sub>alkenilgrupu, C<sub>3-6</sub>alkinilgrupu, C<sub>3-10</sub>cikloalkilgrupu, kas apzīmē mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, C<sub>6-10</sub>arilgrupu, 5- līdz 10-locekļu heteroarilgrupu vai 4- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

(1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,

(2) kas satur no 4 līdz 10 atomiem gredzenā,

(3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā, un R<sup>T1</sup> apzīmē ūdeņraža atomu vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupu; un

kur aizvietotāju grupa C sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, merkaptogrupas, nitrogrupas, ciāngrupas, oksogrupas, C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>2-6</sub>alkenilgrupas, C<sub>2-6</sub>alkinilgrupas, C<sub>3-10</sub>cikloalkilgrupas, kas apzīmē mono- vai diciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, C<sub>6-10</sub>arilgrupu, 5- līdz 10-locekļu heteroarilgrupu, 3- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

(1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,

(2) kas satur no 3 līdz 10 atomiem gredzenā,

(3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupu, C<sub>1-6</sub>alkiltiogrupu, mono-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupu un di-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupu.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur R<sup>1</sup> apzīmē 3- līdz 10-locekļu nearomātisku heterociklisku grupu, kas apzīmē:

(1) monociklisku vai biciklisku nearomātisku heterociklisku grupu,

(2) kas satur no 3 līdz 10 atomiem gredzenā,

(3) kas satur 1 vai 2 heteroatomus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma starp gredzena atomiem,

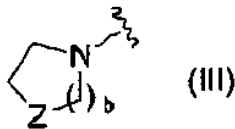
(4) kas neobligāti satur 1 vai 2 dubultsaites gredzenā,

(5) kas neobligāti satur no 1 līdz 3 karbonil-, sulfīnīl- vai sulfonilgrupām gredzenā, kas neobligāti ir aizvietotas ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā, kur grupa ir ierobežota līdz grupai, kas satur slāpekļa atomu kā gredzenu veidojošu atomu, un slāpekļa atomam ir valences saite.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur R<sup>1</sup> apzīmē grupu ar formulu (II):



kur a apzīmē veselu skaitli no 1 līdz 4;  
vai grupu ar formulu (III):



kur b apzīmē veselu skaitli no 1 līdz 3; un Z apzīmē skābekļa atomu, sēra atomu, karbonilgrupu, sulfonilgrupu vai grupu ar formulu  $-NR^2$ , kur  $R^2$  apzīmē ūdeņraža atomu vai  $C_{1-6}$ alkilgrupu, un grupas, kas apzīmētas ar formulu (II) vai formulu (III), var būt aizvietotas ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē azetidīn-1-ilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, pīrolidīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, piperidīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, azepan-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, piperazīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, diazepan-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, morfolin-4-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, tiomorfolin-4-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, kur aizvietotāju grupa D sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, merkaptogrupas, ciāngrupas, formilgrupas, oksogrupas,  $C_{1-6}$ alkilgrupas,  $C_{3-10}$ cikloalkilgrupas, kas apzīmē mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem,  $C_{1-6}$ alkoksigrupu, aminogrupu, mono- $C_{1-6}$ alkilaminogrupu, di- $C_{1-6}$ alkilaminogrupu, azetidīn-ilgrupu, pīrolidīn-ilgrupu, piperidīn-ilgrupu, piperazīn-ilgrupu, diazepan-ilgrupu un grupu, kas apzīmēta ar  $-T^4-T^5$ , kur  $T^4$  apzīmē karbonilgrupu vai sulfonilgrupu, un  $T^5$  apzīmē  $C_{1-6}$ alkilgrupu,  $C_{3-10}$ cikloalkilgrupu, kas apzīmē mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, azetidīn-ilgrupu, pīrolidīn-ilgrupu, piperidīn-ilgrupu, hidroksilgrupu,  $C_{1-6}$ alkoksigrupu, aminogrupu, mono- $C_{1-6}$ alkilaminogrupu vai di- $C_{1-6}$ alkilaminogrupu, kur katra grupa, kas iekļauta aizvietotāju grupā D, var būt aizvietota ar hidroksilgrupu,  $C_{1-6}$ alkilgrupu, di- $C_{1-6}$ alkilaminogrupu, azetidīn-ilgrupu vai pīrolidīn-ilgrupu.

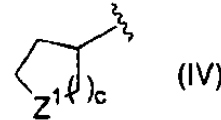
5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē azetidīn-1-ilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas E, pīrolidīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas E, piperidīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas E, piperazīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas E, diazepan-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas E, vai morfolin-4-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas E, kur aizvietotāju grupa E sastāv no metilgrupas, etilgrupas, dimetilaminogrupas, azetidīn-ilgrupas, pīrolidīn-ilgrupas, piperidīn-ilgrupas un piperazīn-ilgrupas, kur katra grupa, kas iekļauta aizvietotāju grupā E, var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, metilgrupu, dimetilaminogrupu, azetidīn-ilgrupu, pīrolidīn-ilgrupu vai piperidīn-ilgrupu.

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē azetidīn-1-ilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas G, pīrolidīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas G, piperidīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas G, vai piperazīn-1-ilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas G, kur aizvietotāju grupa G sastāv no dimetilaminogrupas, azetidīn-ilgrupas, pīrolidīn-ilgrupas, piperidīn-ilgrupas, piperazīn-ilgrupas, dimetilaminometilgrupas, dimetilaminoetilgrupas, azetidīn-1-ilmetilgrupas, pīrolidīn-1-ilmetilgrupas un piperidīn-1-ilmetilgrupas,

kur katra grupa, kas iekļauta aizvietotāju grupā G, var būt aizvietota ar metilgrupu vai dimetilaminogrupu.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē grupu ar formulu  $-NR^{11a}R^{11b}$ , kur  $R^{11a}$  un  $R^{11b}$  nozīmes ir 1. pretenzijā minētās.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē grupu ar formulu  $-NR^{11c}R^{11d}$ , kur  $R^{11c}$  apzīmē ūdeņraža atomu vai  $C_{1-6}$ alkilgrupu, un  $R^{11d}$  apzīmē  $C_{1-6}$ alkilgrupu vai grupu ar formulu (IV):



kur c apzīmē veselu skaitli no 1 līdz 3, un  $Z^1$  apzīmē skābekļa atomu, sēra atomu, karbonilgrupu, sulfonilgrupu vai grupu ar formulu  $-NR^{21}$ , kur  $R^{21}$  apzīmē ūdeņraža atomu vai  $C_{1-6}$ alkilgrupu, un  $R^{11d}$  var būt aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē grupu ar formulu  $-NR^{11e}R^{11f}$ , kur  $R^{11e}$  apzīmē ūdeņraža atomu vai  $C_{1-6}$ alkilgrupu, un  $R^{11f}$  apzīmē  $C_{1-6}$ alkilgrupu, pīrolidīn-3-ilgrupu, piperidīn-3-ilgrupu, piperidīn-4-ilgrupu vai tetrahidropīran-4-ilgrupu, un  $R^{11f}$  var būt aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas D, kā definēts 4. pretenzijā.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē grupu ar formulu  $-NR^{11g}R^{11h}$ , kur  $R^{11g}$  apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu, un  $R^{11h}$  apzīmē n-propilgrupu, n-butilgrupu, pīrolidīn-3-ilgrupu, piperidīn-3-ilgrupu, piperidīn-4-ilgrupu vai tetrahidropīran-4-ilgrupu, un  $R^{11h}$  var būt aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas F, kur aizvietotāju grupa F sastāv no metilgrupas, etilgrupas, n-propilgrupas, acetilgrupas, dimetilaminogrupas, dietilaminogrupas, azetidīn-ilgrupas, pīrolidīn-ilgrupas un piperazīn-ilgrupas, kur katra grupa, kas iekļauta aizvietotāju grupā F, var būt aizvietota ar metilgrupu vai dimetilaminogrupu.

11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē grupu ar formulu  $-N(CH_2)R^{11i}$ , kur  $R^{11i}$  apzīmē n-propilgrupu, n-butilgrupu, pīrolidīn-3-ilgrupu vai piperidīn-4-ilgrupu, un  $R^{11i}$  var būt aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas H, kur aizvietotāju grupa H sastāv no dimetilaminogrupas, dietilaminogrupas, dimetilaminoetilgrupas, dimetilaminopropilgrupas un 1-metilazetidīn-3-ilgrupas.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^1$  apzīmē grupu ar formulu  $-N(CH_2)R^{11j}$ , kur  $R^{11j}$  apzīmē 1-metilpiperidīn-4-ilgrupu vai 1-etilpiperidīn-4-ilgrupu.

13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  un  $R^7$  var būt vienādi vai dažādi un katrs apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu vai  $C_{1-6}$ alkilgrupu.

14. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^8$  apzīmē ūdeņraža atomu.

15. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur X apzīmē grupu ar formulu  $-C(R^{10a})=$ , kur  $R^{10a}$  apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu vai ciāngrupu.

16. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur X apzīmē slāpekļa atomu.

17. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur n apzīmē 1.

18. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur  $R^9$  apzīmē mono- $C_{1-6}$ alkilaminogrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā, mono- $C_{3-10}$ cikloalkilaminogrupu, kas apzīmē grupu, kurā viens aminogrupas ūdeņraža atoms ir aizvietots ar mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā, mono- $C_{6-10}$ arilaminogrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā, mono- 5- līdz 10-locekļu heteroarilaminogrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā, vai mono- 4- līdz 10-locekļu nearomatisku heterociklisku aminogrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā.



19. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur R<sup>9</sup> apzīmē mono-C<sub>3-10</sub>cikloalkilaminogrupu, kas apzīmē grupu, kurā viens aminogrupas ūdeņraža atoms ir aizvietots ar mono- vai biciklisku piesātinātu alifātisku ogļūdeņraža grupu ar 3 līdz 10 oglekļa atomiem, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā, vai mono-C<sub>6-10</sub>arilaminogrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no aizvietotāju grupas A vai aizvietotāju grupas B, kā definēts 1. pretenzijā.

20. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāls vai hidrāts, kur savienojums ar formulu (I) ir:

- (1) N-[4-({2-[[4-(2-dimetilamino)etil]piperazin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (2) N-(2-fluor-4-[[2-[[metil(1-metilpiperidin-4-il)amino]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (3) N-(4-fluorfenil)-N'-{2-fluor-4-[[2-[[4-pirolidin-1-il]piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (4) N-[4-({2-[[4-((dimetilamino)metil]piperidin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (5) N-{4-[[2-[[4-azetidīn-1-il]piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (6) N-[4-({2-[[4-3-(dimetilamino)azetidīn-1-il]piperidin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (7) N-(2-fluor-4-[[2-[[4-(4-metilpiperazin-1-il]piperidin-1-il]karbonil]amino)piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (8) N-(2-fluor-4-[[2-[[4-(1-metilpiperidin-4-il]piperazin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (9) N-(2-fluor-4-[[2-[[4-(1-metilazetidīn-3-il]piperazin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (10) N-(4-[[2-[[4-(dimetilamino)piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (11) N-(4-[[2-[[4-(azetidīn-1-ilmetil]piperidin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (12) N-(4-fluorfenil)-N'-(2-fluor-4-[[2-[[4-(pirolidin-1-ilmetil]piperidin-1-il]karbonil]amino)piridin-4-il]oksi}fenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (13) N-(4-[[2-[[3-(3S)-3-(dimetilamino)pirolidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (14) N-(4-[[2-[[3-(3R)-3-(dimetilamino)pirolidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (15) N-(2-fluor-4-[[2-[[metil(1-metilpiperidin-4-il)amino]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-fenilciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (16) N-(2-fluor-4-[[2-[[4-(4-metilpiperazin-1-il]piperidin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-fenilciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (17) N-[4-({2-[[4-3-(dimetilamino)azetidīn-1-il]piperidin-1-il]karbonil}amino)piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-fenilciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (18) N-(4-[[2-[[1-etilpiperidin-4-il](metil)amino]karbonil]amino)piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-fenilciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (19) N-[4-({2-[[azetidīn-1-ilkarbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (20) N-(4-fluorfenil)-N'-[2-fluor-4-[[2-[[pirolidin-1-ilkarbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil]ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (21) N-{2-fluor-4-[[2-[[3-(3-hidroksiazetidīn-1-il]karbonil]amino)piridin-4-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (22) N-[4-({2-[[1,3'-biazetidīn-1'-ilkarbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (23) N-(2-fluor-4-[[2-[[3-(hidroksimetil)azetidīn-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (24) N-(4-[[2-[[3-(dimetilamino)azetidīn-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;

- (25) N-[4-({2-[[3-[[dimetilamino]metil]azetidīn-1-il]karbonil}amino]piridin-4-il]oksi)-2-fluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (26) N-{2-fluor-4-[[2-[[4-(4-hidroksipiperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (27) N-(2-fluor-4-[[2-[[4-(hidroksimetil)piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (28) N-(2-fluor-4-[[2-[[3-(3R)-3-hidroksipirrolidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (29) N-(2-fluor-4-[[2-[[3-(3S)-3-hidroksipirrolidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (30) N-[4-({2-[[azetidīn-1-ilkarbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2,5-difluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (31) N-{2,5-difluor-4-[[2-[[3-(3-hidroksiazetidīn-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (32) N-(2,5-difluor-4-[[2-[[4-(4-metilpiperazin-1-il]piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (33) N-{2,5-difluor-4-[[2-[[3-[[dimetilamino]metil]azetidīn-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (34) N-(2,5-difluor-4-[[2-[[metil(1-metilpiperidin-4-il)amino]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (35) N-{4-[[2-[[3-(azetidīn-1-ilmetil)azetidīn-1-ilkarbonil]amino]piridin-4-il]oksi]-2,5-difluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (36) N-(2,5-difluor-4-[[2-[[3-(hidroksimetil)azetidīn-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (37) N-{2,5-difluor-4-[[4-[[3-(3-hidroksiazetidīn-1-il]karbonil]amino]pirimidin-6-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (38) N-[4-({4-[[3-[[dimetilamino]metil]azetidīn-1-il]karbonil]amino]pirimidin-6-il]oksi)-2,5-difluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (39) N-(2,5-difluor-4-[[4-[[3-(hidroksimetil)azetidīn-1-il]karbonil]amino]pirimidin-6-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (40) N-(2,5-difluor-4-[[4-[[metil(1-metilpiperidin-4-il)amino]karbonil]amino]pirimidin-6-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (41) N-(2,5-difluor-4-[[4-[[4-(4-metilpiperazin-1-il]piperidin-1-il]karbonil]amino]pirimidin-6-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (42) N-(4-[[2-[[4-(dimetilamino)piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi)-2,5-difluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (43) N-{2,5-difluor-4-[[2-[[4-(4-metilpiperazin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (44) N-{2,5-difluor-4-[[2-[[4-(4-hidroksipiperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (45) N-{4-[[2-[[4-azetidīn-1-il]piperidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}-2,5-difluorfenil]-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (46) N-(2,5-difluor-4-[[2-[[3-(2-dimetilaminoacetoksi)azetidīn-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds;
- (47) N-(2,5-difluor-4-[[2-[[3-(3S)-3-hidroksipirrolidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds; vai
- (48) N-(2,5-difluor-4-[[2-[[3-(3R)-3-hidroksipirrolidin-1-il]karbonil]amino]piridin-4-il]oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds

21. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāli vai hidrātu.

22. Hepatocīta augšanas faktora receptora inhibitors, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāli vai hidrātu.

23. Angioģenēzes inhibitors, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāli vai hidrātu.

24. Pretaudzēju līdzeklis, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāli vai hidrātu.

25. Pretaudzēju līdzeklis saskaņā ar 24. pretenziju, kur audzējs ir aizkuņģa dziedzera vēzis, kuņģa vēzis, kolorektāls vēzis, krūts vēzis, prostatas vēzis, plaušu vēzis, nieru vēzis, smadzeņu audzējs vai olnīcu vēzis.

26. Vēža metastāžu inhibitors, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts.

27. N-[4-((2-((4-[3-(dimetilamino)azetidīn-1-il]piperidīn-1-il)karbonilamino)piridīn-4-il]oksi)-2-fluorofenil]-N'-(4-fluorofenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds, tā sāļi vai hidrāts.

28. N-(2-fluor-4-((2-((4-(4-metilpiperazīn-1-il)piperidīn-1-il)karbonilamino)piridīn-4-il]oksi)fenil)-N'-(4-fluorofenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds, tā sāļi vai hidrāts.

29. N-(2,5-difluor-4-((2-((3-hidroksiazetidīn-1-il)karbonilamino)piridīn-4-il]oksi)fenil)-N'-(4-fluorofenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds, tā sāļi vai hidrāts.

30. N-(2,5-difluor-4-((2-((4-(4-metilpiperazīn-1-il)piperidīn-1-il)karbonilamino)piridīn-4-il]oksi)fenil)-N'-(4-fluorofenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds, tā sāļi vai hidrāts.

31. N-(2,5-difluor-4-((2-((metil(1-metilpiperidīn-4-il)amino)karbonilamino)piridīn-4-il]oksi)fenil)-N'-(4-fluorofenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīds, tā sāļi vai hidrāts.

32. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāta izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts hepatocīta augšanas faktora receptora inhibēšanai.

33. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāta izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts angioģenēzes inhibēšanai.

34. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāta izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts audzēju ārstēšanai.

35. Izmantošana saskaņā ar 34. punktu, kur audzējs ir aizkuņģa dziedzera vēzis, kuņģa vēzis, kolorektāls vēzis, krūts vēzis, prostatas vēzis, plaušu vēzis, nieru vēzis, smadzeņu audzējs vai olnīcu vēzis.

36. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāta izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts vēža metastāžu inhibēšanai.

37. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts izmantošanai par medikamentu.

38. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts izmantošanai par hepatocīta augšanas faktora receptora inhibitoru.

39. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts izmantošanai par angioģenēzes inhibitoru.

40. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts izmantošanai par pretaudzēju līdzekli.

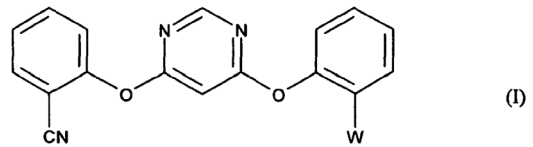
41. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts izmantošanai saskaņā ar 40. pretenziju, kur audzējs ir aizkuņģa dziedzera vēzis, kuņģa vēzis, kolorektāls vēzis, krūts vēzis, prostatas vēzis, plaušu vēzis, nieru vēzis, smadzeņu audzējs vai olnīcu vēzis.

42. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, tā sāļi vai hidrāts izmantošanai par vēža metastāžu inhibitoru.

Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV

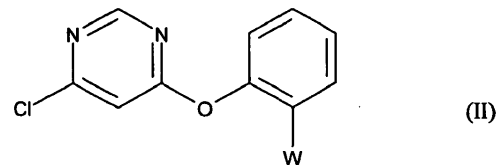
- (54) **PAŅĒMIENI AZOKSISTROBĪNA IEGŪŠANAI, IZMANTOJOT DABCO KĀ KATALIZATORU, UN JAUNI STARPPRODUKTI, KURUS IZMANTO MINĒTAJOS PAŅĒMIENOS PROCESSES FOR THE PREPARATION OF AZOXYSTROBIN USING DABCO AS A CATALYST AND NOVEL INTERMEDIATES USED IN THE PROCESSES**

(57) 1. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I):



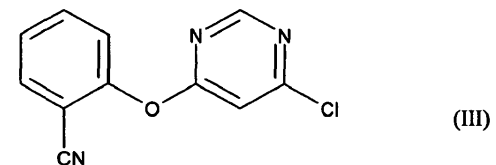
iegūšanai, kas ietver vai nu

(a) savienojuma ar formulu (II):

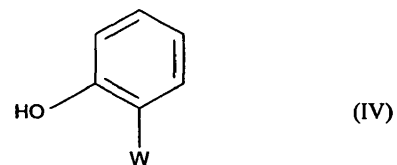


pakļaušanu reakcijai ar 2-ciānfenolu vai tā sāļi, vairāk par 0,1 un mazāk par 2 mol % 1,4-diazabicyclo[2.2.2]oktāna klātbūtnē, vai

(b) savienojuma ar formulu (III):



pakļaušanu reakcijai ar savienojumu ar formulu (IV):



vairāk par 0,1 un mazāk par 2 mol % 1,4-diazabicyclo[2.2.2]oktāna klātbūtnē,

kur W ir (E)-2-(3-metoksi)akrilskābes metilestera grupa C(CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)=CHOCH<sub>3</sub> vai 2-(3,3-dimetoksi)propānskābes metilestera grupa C(CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)CH(OCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, vai divu grupu maisījums, un kur 1,4-diazabicyclo[2.2.2]oktāns ir pēdējais pievienotais komponents.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kuru veic starp 0,2 un 1,4 mol % 1,4-diazabicyclo[2.2.2]oktāna klātbūtnē.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kuru veic inertā šķīdinātājā vai atšķaidītājā.

4. Paņēmiens saskaņā ar 3. pretenziju, kurā inertais šķīdinātājs vai atšķaidītājs ir metilizobutilketons, cikloheksanons, N,N-diizopropil-etilamīns, etiķskābes izopropilesteris vai N,N-dimetilformamīds.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kurā inertais šķīdinātājs vai atšķaidītājs ir N,N-dimetilformamīds.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kuru veic 0,1 mol % 1,4-diazabicyclo[2.2.2]oktāna klātbūtnē.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kuru veic ūdens sistēmā.

8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, kurā kā sāļi tiek izmantots 2-ciānfenols, kālija 2-ciānfenoksīds.

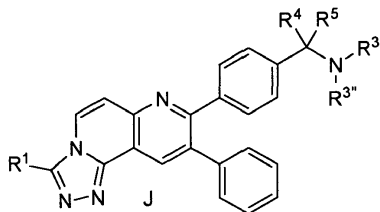
9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kuru veic skābes akceptora klātbūtnē.

10. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kurā skābes akceptors ir kālija karbonāts vai nātrija karbonāts.

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kuru veic temperatūrā no 0 līdz 100°C.

(51) <b>C07D 239/52</b> <sup>(200601)</sup>	(11) <b>1891020</b>	
<b>C07C 59/64</b> <sup>(200601)</sup>		
<b>C07C 67/31</b> <sup>(200601)</sup>		
<b>C07C 67/327</b> <sup>(200601)</sup>		
<b>C07C 69/734</b> <sup>(200601)</sup>		
(21) 06726760.9	(22) 13.04.2006	
(43) 27.02.2008		
(45) 05.06.2013		
(31) 0508422	(32) 26.04.2005	(33) GB
(86) PCT/GB2006/001361	13.04.2006	
(87) WO2006/114572	02.11.2006	
(73) Syngenta Limited, European Regional Centre, Priestley Road, Surrey R, Guildford, Surrey GU2 7YH, GB		
(72) WHITTON, Alan, John, GB BOYD, Ewan, Campbell, GB VASS, Jack, GB		
(74) Elliott, Kathryn, et al, Intellectual Property Department, Syngenta Limited, Jealott's Hill, International Research Centre, PO Box No 3538, Bracknell, Berkshire RG42 6YA, GB		

- (51) **A61K 31/41**<sup>(200601)</sup> (11) **1898903**  
**C07D 249/00**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 06772406.2 (22) 07.06.2006  
 (43) 19.03.2008  
 (45) 27.03.2013  
 (31) 689726 P (32) 10.06.2005 (33) US  
 734188 P 07.11.2005 US  
 (86) PCT/US2006/022079 07.06.2006  
 (87) WO2006/135627 21.12.2006  
 (73) Merck Sharp & Dohme Corp., 126 East Lincoln Avenue, Rahway, NJ 07065-0907, US  
 (72) ARMSTRONG, Donna, J., US  
 HU, Essa, H., US  
 KELLY, Michael, J. III, US  
 LAYTON, Mark, E., US  
 LI, Yiwei, US  
 LIANG, Jun, US  
 RODZINAK, Kevin, J., US  
 ROSSI, Michael, A., US  
 SANDERSON, Philip, E., US  
 WANG, Jiabing, US  
 (74) Hussain, Deeba, Merck & Co., Inc. Hertford Road, Hoddesdon, Hertfordshire EN11 9BU, GB  
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
 (54) **AKT AKTIVITĀTES INHIBITORI**  
**INHIBITORS OF AKT ACTIVITY**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu (J):



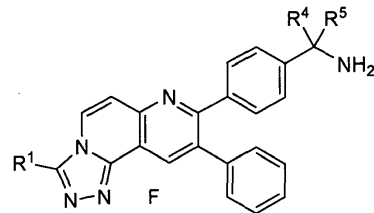
kur:

a ir 0 vai 1; b ir 0 vai 1; m ir 0, 1 vai 2;  
 R<sup>1</sup> ir izvēlēts no: CF<sup>3</sup>, H, oksogrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>1-10</sub> alkilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub> arilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>2-10</sub> alkenilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>2-10</sub> alkinilgrupas, CO<sub>2</sub>H, halogēna atoma, OH, O<sub>b</sub>-C<sub>1-6</sub>perfluoralkilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, CN, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupas, S(O)<sub>m</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, SH, S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1-10</sub>alkilgrupas un (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>-heterociklilgrupas, minētā alkilgrupa, arilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa un heterociklilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu līdz sešiem aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6</sup>;  
 R<sup>3</sup> un R<sup>3'</sup> neatkarīgi ir izvēlēti no: CF<sup>3</sup>, H, oksogrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>1-10</sub> alkilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>-arilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>2-10</sub> alkenilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>2-10</sub> alkinilgrupas, CO<sub>2</sub>H, halogēna atoma, OH, O<sub>b</sub>-C<sub>1-6</sub>perfluoralkilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, CN, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupas, S(O)<sub>m</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, SH, S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1-10</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkilheterociklilgrupas un (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>-heterociklilgrupas, minētā alkilgrupa, arilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa un heterociklilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu līdz pieciem aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6</sup>; vai R<sup>3</sup> un R<sup>3'</sup> var būt ņemti kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, lai veidotu piperidīna vai piroldīna grupu, kura var būt neobligāti aizvietota ar vienu līdz pieciem aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6</sup>;  
 R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> neatkarīgi ir: H, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkenilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkinilgrupa, kur minētā alkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar līdz trim aizvietotājiem, izvēlētiem no OH un halogēna atoma; un kur R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> var būt ņemti kopā, lai veidotu C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupu, kur minētā cikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar līdz trim aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6</sup>;  
 R<sup>6</sup> ir: CF<sup>3</sup>, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>1-10</sub> alkilgrupa, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub> arilgrupa, C<sub>2-10</sub> alkenilgrupa, C<sub>2-10</sub> alkinilgrupa, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub> heterociklilgrupa, CO<sub>2</sub>H, halogēna atoms, CN, OH, O<sub>b</sub>-C<sub>1-6</sub>perfluoralkilgrupa, O<sub>a</sub>(C=O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, oksogrupa, CHO, (N=O)R<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, S(O)<sub>m</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, SH, S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1-10</sub>alkilgrupa vai (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, minētā alkilgrupa, arilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, heterociklilgrupa un cikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu līdz pieciem aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6</sup>; R<sup>6a</sup> ir izvēlēts no: CF<sup>3</sup>, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>1-10</sub> alkilgrupas, O<sub>a</sub>C<sub>1-3</sub>perfluoralkilgrupas, C<sub>0-6</sub>alkilēn-S(O)<sub>m</sub>R<sup>a</sup>, SH, oksogrupas, OH, halogēna

atoma, CN, C<sub>2-10</sub> alkenilgrupas, C<sub>2-10</sub> alkinilgrupas, C<sub>3-6</sub> cikloalkilgrupas, C<sub>0-6</sub> alkilēn arilgrupas, C<sub>0-6</sub> alkilēn heterociklilgrupas, C<sub>0-6</sub> alkilēn-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>, (C=O)<sub>a</sub>NR<sup>b</sup>, C(O)R<sup>a</sup>, C<sub>0-6</sub> alkilēn-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>, C(O)H un C<sub>0-6</sub> alkilēn-CO<sub>2</sub>H, minētā alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, arilgrupa un heterociklilgrupa ir neobligāti aizvietota ar līdz trim aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>b</sup>, OH, C<sub>1-6</sub> alkoksigrupas, halogēna atoma, CO<sub>2</sub>H, CN, O<sub>a</sub>(C=O)<sub>b</sub>C<sub>1-6</sub> alkilgrupas, oksogrupas un N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>;  
 R<sup>7</sup> un R<sup>8</sup> neatkarīgi ir izvēlēti no: CF<sup>3</sup>, H, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>1-10</sub> alkilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>3-8</sub> cikloalkilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>-arilgrupas, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>-heterociklilgrupas, C<sub>2-10</sub> alkenilgrupas, C<sub>2-10</sub> alkinilgrupas, SH, SO<sub>2</sub>R<sup>a</sup> un (C=O)<sub>a</sub>NR<sup>b</sup>, minētā alkilgrupa, cikloalkilgrupa, arilgrupa, heterociklilgrupa, alkenilgrupa un alkinilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu līdz pieciem aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6a</sup>; vai R<sup>7</sup> un R<sup>8</sup> var būt ņemti kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, lai veidotu monociklisku vai biciklisku heterocikla grupu ar 3 - 7 locekļiem katrā gredzenā un, papildus slāpekļa atomam, neobligāti satur vienu vai divus papildu heteroatomus, izvēlētiem no N, O un S, minētā monocikliskā vai bicikliskā heterocikla grupa neobligāti aizvietota ar vienu līdz sešiem aizvietotājiem, izvēlētiem no R<sup>6a</sup>;  
 R<sup>a</sup> ir C<sub>1-6</sub> alkilgrupa, NR<sup>b</sup>, C<sub>3-6</sub> cikloalkilgrupa, arilgrupa vai heterociklilgrupa; un  
 R<sup>b</sup> neatkarīgi ir: H, C<sub>1-6</sub> alkilgrupa, NH<sub>2</sub>, arilgrupa, heterociklilgrupa, C<sub>3-6</sub> cikloalkilgrupa, (C=O)<sub>a</sub>O<sub>b</sub>C<sub>1-6</sub> alkilgrupa vai S(O)<sub>m</sub>R<sup>a</sup>; arilgrupa ir stabils monociklisks vai biciklisks oglekļa atoma gredzens ar līdz 7 atomiem katrā gredzenā, kur vismaz viens gredzens ir aromātisks; heterociklilgrupa ir 3 līdz 10 locekļu aromātiska vai nearomātiska heterocikla grupa, kas satur no 1 līdz 4 heteroatomiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no O, N un S, un ietver bicikliskas grupas; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, tautomērs vai stereoizomērs.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>1</sup> ir izvēlēts no: H, oksogrupas, NH<sub>2</sub>, OH, SH, O<sub>a</sub>C<sub>1-6</sub> alkilgrupas, minētā alkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar R<sup>6a</sup>, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, tautomērs vai stereoizomērs.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (F):



kur:

R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> neatkarīgi ir: H un C<sub>1-6</sub> alkilgrupa, kur minētā alkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar līdz trim aizvietotājiem, izvēlētiem no: OH un halogēna atoma; un kur R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> var būt savienoti, lai veidotu C<sub>3-7</sub> cikloalkilgrupu; un  
 R<sup>1</sup> ir izvēlēts no: H, oksogrupas, NH<sub>2</sub>, OH, SH, O<sub>a</sub>C<sub>1-6</sub> alkilgrupas, minētā alkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar R<sup>6a</sup>, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, tautomērs vai stereoizomērs.

4. Savienojums, kurš ir izvēlēts no:  
 9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīn-3-amīna;  
 9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīn-3-ola;  
 9-fenil-8-(4-{{4-(4-piridin-2-il-1H-imidazol-1-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīn-3-amīna;  
 9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīn-3-ola;  
 3-metil-9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(hlormetil)-9-fenil-8-(4-{{4-(4-piridin-2-il-1H-imidazol-1-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-{{4-metilpiperidin-1-il}metil}-9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 2-{{9-fenil-8-(4-{{4-(5-piridin-2-il-1H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīn-3-il}metil}amino)etanola;  
 8-(4-aminometil-fenil)-9-fenil-[1,2,4]triazolo[3,4-f][1,6]naftiridīn-3-ola;  
 1-[4-(9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīn-8-il)fenil]metanamīna;



4-(3-metil-9-fenil-[1,2,4]triazolo[3,4-f][1,6]naftiridin-8-il)-benzilamīna;  
 8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-amīna;  
 1-[4-(9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etānamīna;  
 9-fenil-8-[4-[4-(5-piridin-2-il-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-piperidin-1-ilmetil]-fenil]-[1,2,4]triazolo[3,4-f][1,6]naftiridīna;  
 9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)-3-(1H-1,2,3-triazol-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1H-imidazol-4-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
*terc*-butil[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metilkarbamāta;  
 [9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metanola;  
 5-[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona;  
 3-(3-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-imidazo[2,1-b][1,3]tiazol-6-il-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)-3-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-imidazo[1,2-a]piridin-2-il-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)-3-(1H-1,2,4-triazol-5-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1H-benzimidazol-6-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-imidazo[1,2-a]pirimidin-2-il-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 5-[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]piridīn-2-amīna;  
 9-fenil-3-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-il-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(5-metil-1H-pirazol-3-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]piridīn-2-amīna;  
 4-[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]fenola;  
 3-[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]fenola;  
 2-[9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]fenola;  
 1-[4-[3-(5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]piperidīn-4-karboksamīda;  
 1-[4-(3-imidazo[1,2-a]piridin-2-il-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]piperidīn-4-karboksamīda;  
 9-fenil-8-(4-[[4-(5-pirazin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 9-fenil-8-(4-[[4-(5-pirimidin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)-3-(1H-1,2,3-triazol-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-pirimidin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil-8-(4-[[4-(5-pirazin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 N<sup>1</sup>-[2-(4-metil-1H-imidazol-2-il)etil]-N<sup>4</sup>-[3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]amīna;  
 N<sup>1</sup>-(2-hidroksifenil)-N<sup>3</sup>-[4-(3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]-beta-alanīnamīda;  
 1-[4-[3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]piperidīn-4-karboksamīda;  
 5-[[4-[3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]amino]metil]piridīn-2-ola;  
 N<sup>1</sup>,N<sup>2</sup>,2-tetrametil-N<sup>3</sup>-[4-(3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1,3-diamīna;  
 3-hidroksi-2,2-dimetil-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1-amīna;

2-fluor-3-hidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1-amīna;  
 2,2-difluor-3-hidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1-amīna;  
 2,3-dihidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1-amīna;  
 4-hidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]cikloheksānamīna;  
 4-hidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]cikloheksānamīna;  
 3-hidroksi-2,2-dimetil-N-[4-[3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]propān-1-amīna;  
 3-hidroksi-2,2-dimetil-N-[4-(9-fenil-3-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1-amīna;  
 3-hidroksi-2,2-dimetil-N-[4-(9-fenil-3-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-il[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propān-1-amīna;  
 3-hidroksi-2,2-dimetil-N-[4-[9-fenil-3-(1H-1,2,3-triazol-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]propān-1-amīna;  
*terc*-butil[[8-(4-[[3-(3-hidroksi-2,2-dimetilpropil)amino]metil]fenil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metil]karbamāta;  
 N-[4-[3-(amoniemetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]-3-hidroksi-2,2-dimetilpropān-1-amīna;  
 [9-fenil-8-(4-[[4-(5-pirazin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metanola;  
 N<sup>3</sup>-[4-[3-(hidroksimetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]-N<sup>1</sup>-(2-hidroksifenil)-beta-alanīnamīda;  
 (8-[4-[(cikloheksilamino)metil]fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il)metanola;  
 N<sup>3</sup>-[4-[3-(hidroksimetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]-N<sup>1</sup>-(4-hidroksifenil)-beta-alanīnamīda;  
 [9-fenil-8-(4-[[4-(5-piridin-3-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil]fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metanola;  
 1-[4-[3-(hidroksimetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]piperidīn-4-karboksamīda;  
 {8-[4-(1-aminociklopropil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metanola;  
 1-[4-(9-fenil-3-piridin-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[3-(1-oksīdpiridin-3-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-(3,9-difenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]metānamīna;  
 1-[4-[3-(4-fluorfenil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 4-[8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]benzitrila;  
 4-(9-fenil-3-pirimidin-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
 1-[4-[3-(1-oksīdpiridin-2-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 5-[8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]piridin-2-ola;  
 1-[4-(9-fenil-3-piridin-3-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 4-(9-fenil-3-pirimidin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
 1-[4-(9-fenil-3-piridin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[9-fenil-3-(1H-1,2,4-triazol-3-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[9-fenil-3-(1,3-tiazol-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[9-fenil-3-(1H-pirazol-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[3-(3-metil-1H-pirazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[3-(3-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[3-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;  
 1-[4-[9-fenil-3-(1,2,5-tiadiazol-3-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metānamīna;

- 1-{4-[9-fenil-3-(1,2,3-tiadiazol-4-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(9-fenil-3-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-il)(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metānamīna;  
{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metanola;  
1-{4-[9-fenil-3-(2,2,2-trifluoretil)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(1H-tetrazol-1-ilmetil)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-karboksamīda;  
1-{4-[3-(1H-imidazol-1-ilmetil)-9-fenil](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(metilsulfonil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]acetamīda;  
2-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]etanola;  
N-({8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il)metil]acetamīda;  
4-[3-(2-metilimidazo[1,2-a]piridin-3-il)-9-fenil](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-(9-fenil-3-pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(3-imidazo[1,2-a]piridin-2-il-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(4,5,6,7-tetrahidro-1,2-benzizoksazol-3-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(3-imidazo[2,1-b][1,3]tiazol-6-il-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1-metil-1H-imidazol-5-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[3-(1-metil-5-fenil-1H-pirazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(4,5,6,7-tetrahidro-1-benzotien-3-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1-izopropil-1H-pirazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(1,4,5,6-tetrahidrociklopenta[c]pirazol-3-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-((2S)-pirolidin-2-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[3-(1-aminoetil)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[3-(1H-imidazol-2-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(3-ciklopropil-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(trifluometil)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(5-metil-1H-pirazol-3-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[3-(1H-indol-2-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[3-(1-metil-1H-imidazol-2-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(3-metil-2H-*lambda*<sup>5</sup>-imidazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[3-(6-hlorimidazo[1,2-a]piridin-2-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[3-(1H-benzimidazol-2-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[3-(5-ciklopropil-4H-pirazol-3-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-3-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[9-fenil-3-(3-fenil-1H-pirazol-5-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-(4-{9-fenil-3-[3-(trifluometil)-1H-pirazol-5-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(9-fenil-3-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-il)(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1-benzil-1H-pirazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(9-fenil-3-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il)(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[9-fenil-3-(1-fenil-1H-pirazol-4-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(4,5,6,7-tetrahidro-2-benzotien-1-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[9-fenil-3-(5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
2-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]propān-2-amīna;  
1-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]etān-1,2-diola;  
4-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]imidazolidīn-2-ona;  
(2R)-2-amino-2-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]etanola;  
(2R)-2-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}-2-(metilamino)etanola;  
1-{4-[3-(5-etilizoksazol-3-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
5-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona;  
6-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}-4,5-dihidropiridazīn-3(2H)-ona;  
6-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}piridazīn-3(2H)-ona;  
N-(4-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}fenil)acetamīda;  
1-{4-[3-(4-fenoksifenil)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1H-benzimidazol-5-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
(4-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}fenil)metanola;  
4-[3-(4-cikloheksilfenil)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
4-{8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}-1,3-dihidro-2H-imidazol-2-ona;  
1-{4-[3-(4-metil-1H-imidazol-5-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
4-[9-fenil-3-(1-propil-1H-imidazol-4-il)](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
1-{4-[3-(1-izopropil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-[3-(1-butil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(3-imidazo[1,2-a]pirimidin-2-il-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
5-({4-[3-metil-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīno)metil)piridin-2-ola;  
1-(6-metoksipiridin-3-il)-N-[4-(3-metil-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzil]metānamīna;  
N-((2-metoksipirimidin-5-il)metil)-N-[4-(3-metil-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amīna;  
1-{4-(3-etil-9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
1-{4-(9-fenil-3-propil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
N-[4-(9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
4-({4-(9-fenil}(1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzilamīno)metil}fenola;  
1-[9-fenil-8-(4-{4-(5-piridin-2-il-4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil)fenil](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il]metānamīna;  
9-fenil-3-(1H-1,2,3-triazol-4-il)-8-(4-{4-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il}metil)fenil](1,2,4)triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;



- 1-[4-{3-(1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 1-[4-{9-fenil-3-(3H-1*lambda*<sup>4</sup>,3-tiazol-5-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 1-[4-{9-fenil-3-(1H-pirazol-3-il)-2H-4*lambda*<sup>5</sup>[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 1-[4-{9-fenil-3-(1,3-tiazol-4-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 4-[9-fenil-3-(pirolidin-1-ilmetil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
 1-[4-{3-(azetidīn-1-ilmetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 1-({8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}metil)piperidīn-4-karboksamīda;  
 1-[4-{3-(morfolin-4-ilmetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 2-({8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}metil)amino)etanola;  
 1-[4-{3-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]metānamīna;  
 4-[9-fenil-3-(piperazin-1-ilmetil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]benzilamīna;  
 N-({8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}metil)-N-metilamīna;  
 N-({8-[4-(aminometil)fenil]-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-il}metil)-N,N-dimetilamīna;  
 [4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]metanola;  
 {4-[3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il]fenil]metanola;  
 1-[4-(9-fenil-3-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]etanola;  
 9-fenil-8-(4-{[4-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-metil-9-fenil-8-(4-{[4-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 9-fenil-8-(4-{[4-(4H-1,2,4-triazol-3-il)piperidin-1-il]metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-3-ola;  
 1-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]ciklopropānamīna;  
 1-[4-{3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]ciklopropānamīna;  
 1-[4-(9-fenil-3-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]ciklopropānamīna;  
 1-[4-(9-fenil-3-(5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]ciklopropānamīna;  
 1-[4-(9-fenil-3-pirimidin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]ciklopropānamīna;  
 1-[4-{3-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]ciklopropānamīna;  
 (1R)-1-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-(9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-(9-fenil-3-(5-piridin-2-il-1H-pirazol-3-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-{3-(hidroksimetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-{3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-(9-fenil-3-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-(3-imidazo[2,1-b][1,3]tiazol-6-il-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-(9-fenil-3-pirimidin-2-il)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il}fenil]etānamīna;  
 (1R)-1-[4-(9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]propānamīna;  
 2-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]propānamīna;  
 2-[4-(9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]propānamīna;  
 3-(2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)piridīna;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-5-piridin-4-il-2-furamīda;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-5-piridin-3-il-2-furamīda;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-5-piridin-3-il-1H-pirōl-3-karboksamīda;  
 2-hidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
*terc*-butil (2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)karbamāta;  
 4-(2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)morfolīna;  
 2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetānamīna;  
 4-(2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)piridīna;  
 2,4-dihidroksi-6-(2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)pirimidīna;  
 2-(2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)piridīna;  
 2-(2-{[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-2-oksoetil)piridīna;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-2-pirazin-2-ilacetamīda;  
 3-metil-9-fenil-8-[4-({(piridin-3-ilamino)karbonil}amino)metil]fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 2-(2-hidroksifenil)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 2-(3-hidroksifenil)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 2-(4-hidroksifenil)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 2-(3,4-dihidroksifenil)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-2-fenilacetamīda;  
 3-metil-9-fenil-8-(4-({(piridin-3-ilkarbonil)amino)metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 2-hidroksi-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]benzamīda;  
 2-(4-hidroksifenil)-2-metil-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propānamīda;  
 metil 4-({[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino}-4-oksobutanāta;  
 2-hidroksi-N-(2-([4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]amino)-2-oksoetil)benzamīda;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-2-(5-fenil-4H-1,2,4-triazol-3-il)acetamīda;  
 3-metil-9-fenil-8-(4-({(hinolin-3-ilkarbonil)amino)metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-2-(4-oksohinazolin-3(4H)-il)acetamīda;  
 N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-2-(2-okso-1,3-benzoksazol-3(2H)-il)acetamīda;  
 8-(4-({(1H-benzimidazol-1-ilacetil)amino)metil}fenil)-3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 8-(4-({(1H-benzimidazol-2-ilacetil)amino)metil}fenil)-3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 2-(4-metil-1,2,5-oksadiazol-3-il)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 2-(1H-indazol-1-il)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 2-(5,6-dimetil-4-okso-tieno[2,3-d]pirimidin-3(4H)-il)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 3-metil-8-[4-({(6-morfolin-4-ilpiridin-3-il)karbonil}amino)metil]fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 2-(6-hlorpiridin-3-il)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 3-ciān-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]propānamīda;  
 3-metil-9-fenil-8-(4-({(3-piridin-3-ilpropanoil)amino)metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil-8-(4-({(piridin-3-ilacetil)amino)metil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;

9-fenil-3-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-il-8-(4-[[piridin-3-il-acetil]amino]metil)fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 N-(3-hidroksi-2,2-dimetilpropil)-N-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]acetamīda;  
 N-(3-hidroksi-2,2-dimetilpropil)-N-[4-(3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil]-2-(4-oksohinazolīn-3(4H)-il)acetamīda;  
*terc*-butil {2-[[4-(3-[[*terc*-butoksikarbonil]amino]metil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)benzil](3-hidroksi-2,2-dimetilpropil)amino-2-oksoetil}karbamāta;  
 2-metil-9-fenil-8-(4-{1-[[piridin-3-il-acetil]amino]ciklopropil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 3-metil-9-fenil-8-(4-{1-[[hinolīn-3-il-karbonil]amino]ciklopropil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 N-{1-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]ciklopropil}-2-(4-oksohinazolīn-3(4H)-il)acetamīda;  
 3-(1-metil-1H-imidazol-4-il)-9-fenil-8-(4-{1-[[piridin-3-il-acetil]amino]ciklopropil}fenil)[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridīna;  
 N-((1R)-1-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etil)-2-piridin-3-ilacetamīda;  
 N-((1R)-1-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etil)acetamīda;  
 N-((1R)-1-[4-(3-(hidroksimetil)-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etil)-2-piridin-3-ilacetamīda;  
 N-{1-metil-1-[4-(9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etil}acetamīda; un  
 N-{1-metil-1-[4-(3-metil-9-fenil[1,2,4]triazolo[3,4-f]-1,6-naftiridin-8-il)fenil]etil}acetamīda;  
 vai tā farmaceitiski pieņemama sāls, tautomēra vai stereozomēra.  
 5. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceitisku nesēju un savienojumu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli, tautomēru vai stereozomēru.  
 6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, tautomērs vai stereozomērs izmantošanai terapijā.  
 7. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls, tautomēra vai stereozomēra izmantošana medikamenta iegūšanai, kas izmantojams vēža ārstēšanā vai profilaksē.  
 8. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls tautomēra vai stereozomēra izmantošana medikamenta iegūšanai, kas izmantojams stāvokļu, kuri var tikt uzlaboti ar Akt inhibēšanu, ārstēšanā vai profilaksē.  
 9. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls, tautomēra vai stereozomēra, un terapeitisku, ķīmijterapietisku, un pretvēžu līdzekļu kombinācija.  
 10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, tautomērs vai stereozomērs izmantošanai vēža ārstēšanā vai profilaksē.

spoli (100) ar horizontāli vērstu asi ar svaru, kas vairāk par 20 % pārsniedz konteineru nominālo komerciālo kravnesību, un līdzekļus kravās stiprināšanai, kas satur atdalošus elementus (104, 105, 106), kuri atbalsta spoles no apakšpuses, kuru forma precīzi atbilst spoļu cilindriskai formai un kuri precīzi atbilst attālumam starp konteineru pretējām sānu sienām (107, 108) un atdalošiem elementiem (110, 111; 109, 112), kas atdala spoles vienu no otras un no konteineru galu sienām (113, 114), pie kam katrs no minētajiem atdalošajiem elementiem ir veidots galvenokārt kā ciets putuplasta bloks, turklāt atdalošo elementu forma, izmērs un izvietojums konteinerā tiem paredzētajās vietās attiecībā pret spolēm ir tādi, ka konstruktīvais mezgls, kas ietver spoles un atdalošos elementus, ir blīvi iestarpināts starp konteineru galu sienām (113, 114) un saskaras ar konteineru iekšējām virsmām (107, 108, 113, 114) tādā veidā, lai ierobežotu mezgla pārvietošanos konteineru kustības laikā.

2. Kombinācija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā putuplasts ir putupolistiols.

3. Kombinācija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā spoles ir izgatavotas no slokšņu materiāla.

4. Kombinācija saskaņā ar 3. pretenziju, kur minētais materiāls satur tēraudu.

5. Kombinācija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā katram no atdalošajiem elementiem, kas atbalsta spoles no apakšpuses, ir uz augšu vērsta iedobe (6) puscilindra formā, kas pieņem un notur konstruktīvā mezgla attiecīgu kravu vienību.

6. Kravas sakraušanas paņēmiens standartveida 20 pēdu (6 m) vai 40 pēdu (12 m) konteinerā jūras kravu pārvadāšanai, kas raksturīgs ar to, ka kravu vienības tiek izvietotas noteiktajā stāvoklī konteinerā paredzētajās pozīcijās, un katra no kravu vienībām satur spoli (100), kuras svars vairāk par 20 % pārsniedz konteineru nominālo komerciālo kravnesību, un kravās stiprināšanas līdzekļus, kas satur atdalošus elementus (104, 105, 106), kuri atbalsta spoles no apakšas, kuru forma precīzi atbilst spoļu cilindriskai formai un kuri precīzi atbilst attālumam starp konteineru pretējām sānu sienām (107, 108) un atdalošajiem elementiem (110, 111; 109, 112), kas atdala spoles vienu no otras un no konteineru gala sienām (113, 114), pie kam katrs no minētajiem atdalošajiem elementiem ir izveidots galvenokārt kā ciets putuplasta bloks, kurā atdalošo elementu forma, izmērs un izvietojums konteinerā attiecībā pret spolēm ir tādi, ka konstruktīvais mezgls, kurš ietver spoles un atdalošos elementus un kurā katrai spolei ir horizontāli vērsta ass, ir blīvi iestarpināts starp konteineru galu sienām (113, 114) un saskaras ar konteineru iekšējām virsmām (107, 108, 113, 114) tādā veidā, lai ierobežotu mezgla pārvietošanos konteineru kustības laikā.

7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam vismaz viens atdalošais elements, kas uzņem minētās kravu vienības svaru, tiek izvietots konteinerā, bet pēc tam kravu vienību nolaiž tam virsū.

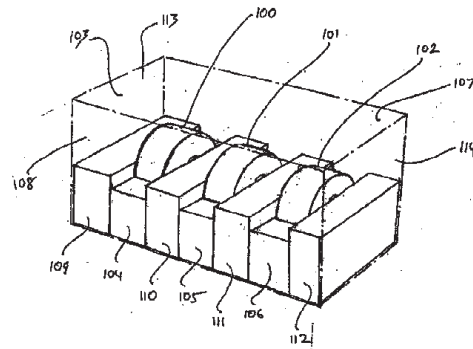


Fig. 11

- (51) **B65D 90/00**<sup>(200601)</sup> (11) **1907301**  
**B66F 9/19**<sup>(200601)</sup>  
**B66F 19/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06760901.6 (22) 27.07.2006
- (43) 09.04.2008
- (45) 01.05.2013
- (31) 2005904009 (32) 27.07.2005 (33) AU
- (86) PCT/AU2006/001040 27.07.2006
- (87) WO2007/012115 01.02.2007
- (73) Strang LPP Nominees Pty Ltd, 94 Errol Street, North Melbourne, VIC 3051, AU
- (72) STRANG, Robert, William, Alistair, AU
- (74) Merrifield, Sarah Elizabeth, Boulton Wade Tennant, Verulam Gardens, 70 Gray's Inn Road, London WC1X 8BT, GB  
 Aleksandrs SMIRNOVS, patenti aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **KONTEINERS JŪRAS KRAVU PĀRVADĀJUMIEM UN PAŅĒMIENS KRAVAS SAKRAUŠANAI KONTEINERĀ SHIPPING CONTAINER WITH CARGO AND METHOD OF STOWING CARGO IN A SHIPPING CONTAINER**
- (57) 1. Kombinācija, kurā ietilpst: standartveida 20 pēdu (6 metru) konteiners vai 40 pēdu (12 metru) konteiners jūras kravu pārvadāšanai un konteinerā iekrautās kravu vienības, katru no kurām satur

- (51) **A61K 35/74**<sup>(200601)</sup> (11) **1911455**  
**A61K 31/19**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 36/8962**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 9/20**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 9/28**<sup>(200601)</sup>
- (21) 07019269.5 (22) 01.10.2007
- (43) 16.04.2008
- (45) 12.06.2013

- (31) mi20061912 (32) 04.10.2006 (33) IT  
 (73) S.I.I.T. S.r.l.-Servizio Internazionale Imballaggi Termosaldanti, Via L. Ariosto, 50/60, 20090 Trezzano sul Naviglio MI, IT  
 (72) DI PIERRO, Francesco, 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) **LOKĀLAS LIETOŠANAS VAGINĀLIE FARMACEITISKIE SASTĀVI**

**TOPICAL VAGINAL PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS**

(57) 1. Lokālas lietošanas vaginālie farmaceutiskie sastāvi, kas satur iedarbīgu koncentrāciju laktobaktēriju, pienskābes un ķiploku ekstrakta.

2. Sastāvi saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur *Lactobacillus acidophilus*, pienskābi un izžāvētu ķiploku ekstraktu.

3. Sastāvi saskaņā ar 1. un 2. pretenziju, kas satur no 100000 līdz 20 miljardiem *Lactobacillus acidophilus* vienā vaginālā tabletē vai kapsulā; 60 % pienskābi daudzumā no 1 līdz 50 mg un izžāvētu ķiploku ekstraktu daudzumā no 10 līdz 220 mg.

4. Sastāvi saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur 1 miljardu *Lactobacillus acidophilus* vienā vaginālā tabletē vai kapsulā; 60 % pienskābi 15 mg daudzumā un 100 mg izžāvētu ķiploku ekstraktu.

5. Sastāvi saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā ķiploku ekstrakts ir dezodorēta izžāvēta ekstrakta formā, kurš titrēts uz 1 % alicīna saturu.

6. Sastāvi saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ir tablešu, kapsulu, pesāriju, ovulu, skalošanas līdzekļu, krēmu un ziedes veidā.

- (51) **A61K 31/47**<sup>(200601)</sup> (11) **1912648**  
**A61P 31/04**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 215/22**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 215/18**<sup>(200601)</sup>

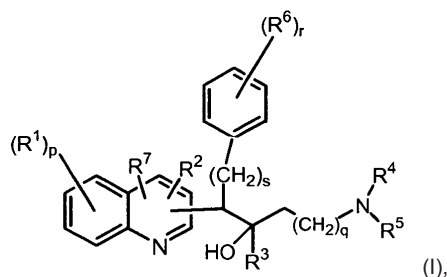
- (21) 06778083.3 (22) 31.07.2006  
 (43) 23.04.2008  
 (45) 10.04.2013  
 (31) 05107164 (32) 03.08.2005 (33) EP  
 (86) PCT/EP2006/064858 31.07.2006  
 (87) WO2007/014941 08.02.2007  
 (73) Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE

- (72) GUILLEMONT, J. E. G., FR  
 PASQUIER, E. T. J., FR  
 LANÇOIS, David Francis Alain, FR  
 ANDRIES, Koenraad Jozef Lodewijk Marcel, BE  
 KOUL, Anil, BE  
 BACKX, Leo Jacobus Jozef, BE  
 MEERPOEL, Lieven, BE  
 (74) Vervoort, Liesbeth, Janssen Pharmaceutica N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE  
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV

(54) **HINOLĪNA ATVASINĀJUMI KĀ ANTIBAKTERIĀLIE LĪDZEKĻI**

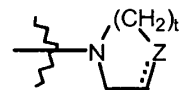
**QUINOLINE DERIVATIVES AS ANTIBACTERIAL AGENTS**

(57) 1. Savienojuma izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts bakteriālas infekcijas, kuru izraisa *Staphylococcus*, *Enterococcus* vai *Streptococcus*, ārstēšanai, minētais savienojums ir savienojums ar formulu (I):

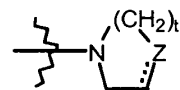


tā farmaceutiski pieņemams pievienotās skābes vai bāzes sāls, tā ceturtējs amīns, tā stereoķīmiski izomēra forma, tā tautomēra forma vai tā *N*-oksīda forma, kur:

$R^1$  ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, ciāngrupa, hidroksilgrupa, Ar, Het, alkilgrupa, alkiloksigrupa, alkiltiogrupa, alkiloksialkilgrupa, alkiltioalkilgrupa, Ar-alkilgrupa vai di(Ar)alkilgrupa; p ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 1, 2 vai 3; s ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 0, 1, 2, 3 vai 4;  $R^2$  ir ūdeņraža atoms; halogēna atoms; alkilgrupa; hidroksilgrupa; merkaptogrupa; alkiloksigrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar amino- grupu vai mono- vai di(alkil)aminogrupu, vai atlikums ar formulu:



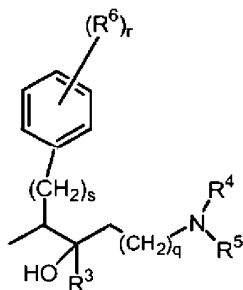
kur Z ir  $CH_2$ ,  $CH-R^8$ , O, S,  $N-R^8$  un t ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 1 vai 2, un punktētā līnija apzīmē iespējamu saiti; alkiloksialkiloksigrupa; alkiltiogrupa; mono- vai di(alkil)aminogrupa, kur alkilgrupa var būt neobligāti aizvietota ar vienu vai diviem aizvietotājiem, no kuriem katrs ir neatkarīgi izvēlēts no alkiloksigrupas vai Ar vai Het vai morfolinilgrupas vai 2-oksopirolidinilgrupas; Ar; Het vai atlikums ar formulu:



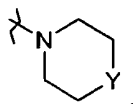
kur Z ir  $CH_2$ ,  $CH-R^8$ , O, S,  $N-R^8$ ; t ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 1 vai 2, un punktētā līnija apzīmē iespējamu saiti;  $R^3$  ir alkilgrupa, Ar, Ar-alkilgrupa, Het vai Het-alkilgrupa; q ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 0, 1, 2, 3 vai 4;  $R^4$  un  $R^5$  katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa vai benzilgrupa; vai

$R^4$  un  $R^5$ , ņemti kopā ar N, kuram tie ir pievienoti, var veidot atlikumu, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no pirolidinilgrupas, 2-pirolinilgrupas, 3-pirolinilgrupas, pirolilgrupas, imidazolidinilgrupas, pirazolidinilgrupas, 2-imidazolinilgrupas, 2-pirazolinilgrupas, imidazolilgrupas, pirazolilgrupas, triazolilgrupas, piperidinilgrupas, pirdinilgrupas, piperazinilgrupas, piridazinilgrupas, pirimidinilgrupas, pirazinilgrupas, triazinilgrupas, morfolinilgrupas un tiomorfolinilgrupas, katrs no minētajiem gredzeniem ir neobligāti aizvietots ar alkilgrupu, halogēna atomu, halogēnalkilgrupu, hidroksilgrupu, alkiloksigrupu, aminogrupu, mono- vai dialkilaminogrupu, alkiltiogrupu, alkiloksialkilgrupu, alkiltioalkilgrupu un pirimidinilgrupu;  $R^6$  ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, halogēnalkilgrupa, hidroksilgrupa, Ar, alkilgrupa, alkiloksigrupa, alkiltiogrupa, alkiloksialkilgrupa, alkiltioalkilgrupa, Ar-alkilgrupa vai di(Ar)alkilgrupa; vai divi blakus esošie  $R^6$  atlikumi var būt ņemti kopā, lai veidotu kopā ar fenilgredzenu, kam tie ir pievienoti, naftilgrupu; r ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 1, 2, 3, 4 vai 5; un  $R^7$  ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, Ar vai Het;  $R^8$  ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, hidroksilgrupa, aminokarbonilgrupa, mono- vai di(alkil)aminokarbonilgrupa, Ar, Het, alkilgrupa, kas ir aizvietota ar vienu vai diviem Het, alkilgrupa, kas ir aizvietota ar vienu vai diviem Ar, Het-C(=O)- vai Ar-C(=O)-; alkilgrupa ir lineāra vai sazarota piesātināta ogļūdeņraža grupa ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem; vai cikliska piesātināta ogļūdeņraža grupa ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem; vai cikliska piesātināta ogļūdeņraža grupa ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem, kas ir pievienota lineārai vai sazarotai piesātinātai ogļūdeņraža grupai ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem; kur katrs oglekļa atoms var būt neobligāti aizvietots ar hidroksilgrupu, alkiloksigrupu vai oksogrupu; Ar ir homocikls, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fenilgrupas, naftilgrupas, acenaftilgrupas, tetrahidronaftilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, pie tam katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, amino- grupas, mono- vai dialkilaminogrupas, alkilgrupas, halogēnalkil- grupas, alkiloksigrupas, halogēnalkiloksigrupas, karboksilgrupas, alkiloksikarbonilgrupas, alkilkarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, morfolinilgrupas un mono- vai dialkilaminokarbonilgrupas; Het ir monociklisks heterocikls, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no *N*-fenoksipiperidinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolilgrupas, pirazolilgrupas, imidazolilgrupas, furanilgrupas, tienilgrupas,

oksazolilgrupas, izoksazolilgrupas, tiazolilgrupas, izotiazolilgrupas, triazolilgrupas, piridinilgrupas, pirimidinilgrupas, pirazinilgrupas un piridazinilgrupas; vai biciklisks heterocikls, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no hinolinilgrupas, izohinolinilgrupas, 1,2,3,4-tetrahidroizohinolinilgrupas, hinoksalinilgrupas, indolilgrupas, indazolilgrupas, benzimidazolilgrupas, benzoksazolilgrupas, benzizoksazolilgrupas, benzotiazolilgrupas, benzofuranilgrupas, benzotienilgrupas, 2,3-dihidrobenzo[1,4]dioxinilgrupas vai benzo[1,3]dioxolilgrupas; katrs monociklisks un biciklisks heterocikls var būt neobligāti aizvietots pie oglekļa atoma ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, pie tam katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkilgrupas vai alkiloksigrupas; halogēna atoms ir aizvietotājs, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no fluora, hlora, broma un joda atoma; un halogēnalkilgrupa ir lineāra vai sazarota piesātināta ogļūdeņraža grupa ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem vai cikliska piesātināta ogļūdeņraža grupa ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem, vai cikliska piesātināta ogļūdeņraža grupa ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem, kas ir pievienota lineārai vai sazarotai piesātinātai ogļūdeņraža grupai ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem; kur viens vai vairāki oglekļa atomi ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem; ar nosacījumu, ka tad, kad atlikums:

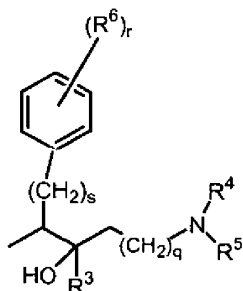


atrodas hinolīna grupējuma 3. pozīcijā; R<sup>7</sup> atrodas hinolīna grupējuma 4. pozīcijā un R<sup>2</sup> atrodas hinolīna grupējuma 2. pozīcijā un apzīmē ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, merkaptogrupu, alkiloksigrupu, alkiloksialkiloksigrupu, alkiltiogrupu, mono- vai di(alkil)aminogrupu vai atlikumu ar formulu:



kur Y ir CH<sub>2</sub>, O, S, NH vai N-alkilgrupa; s ir 1, 2, 3 vai 4;

2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju ar nosacījumu, ka atlikums:



savienojumā ar formulu (I) neatrodas hinolīna grupējuma 3. pozīcijā.

3. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur R<sup>1</sup> ir ūdeņraža vai halogēna atoms.

4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur p ir vienlīdzīgs 1.

5. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur R<sup>2</sup> ir ūdeņraža vai halogēna atoms.

6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur R<sup>3</sup> ir neobligāti aizvietota naftilgrupa vai neobligāti aizvietota fenilgrupa.

7. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur q ir vienlīdzīgs 1 vai 3.

8. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> katrs neatkarīgi ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupa.

9. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur R<sup>6</sup> ir ūdeņraža atoms.

10. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur R<sup>7</sup> ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa.

11. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur s ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 0 vai 1.

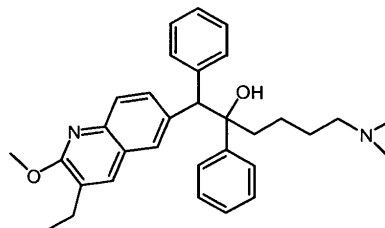
12. Kombinācija, kurā ietilpst (a) savienojums ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, un (b) viens vai vairāki citi antibakteriāli līdzekļi, ar nosacījumu, ka viens vai vairāki citi antibakteriālie līdzekļi ir citi, nekā antimikobakteriāli līdzekļi, kur kombinācija ir paredzēta izmantošanai bakteriālas infekcijas, kuru izraisa *Staphylococcus*, *Enterococcus* vai *Streptococcus*, ārstēšanai.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceutiski pieņemamu nesēju un kā aktīvo ingredientu (a) savienojuma ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, terapeitiski efektīvu daudzumu, un (b) viena vai vairāku citu antibakteriālu līdzekļu terapeitiski efektīvu daudzumu, ar nosacījumu, ka viens vai vairāki citi antibakteriālie līdzekļi ir citi, nekā antimikobakteriāli līdzekļi, kur kompozīcija ir paredzēta izmantošanai bakteriālas infekcijas, kuru izraisa *Staphylococcus*, *Enterococcus* vai *Streptococcus*, ārstēšanai.

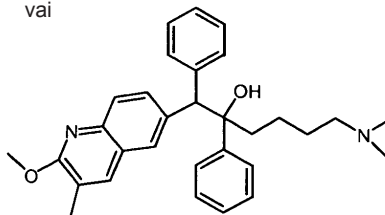
14. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, izmantošanai bakteriālas infekcijas, kuru izraisa *Staphylococcus*, *Enterococcus* vai *Streptococcus*, ārstēšanai.

15. Produkts, kas satur (a) savienojumu ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, un (b) vienu vai vairākus citus antibakteriālus līdzekļus, ar nosacījumu, ka viens vai vairāki citi antibakteriālie līdzekļi ir citi, nekā antimikobakteriāli līdzekļi, kā kombinēts preparāts vienlaicīgai, atsevišķai vai secīgai izmantošanai bakteriālas infekcijas, kuru izraisa *Staphylococcus*, *Enterococcus* vai *Streptococcus*, ārstēšanā.

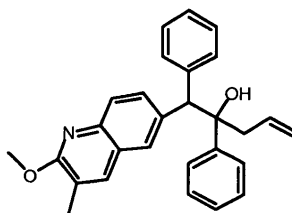
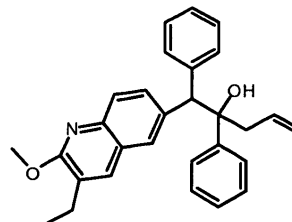
16. Paņēmiens savienojuma, kas izvēlēts no:



vai



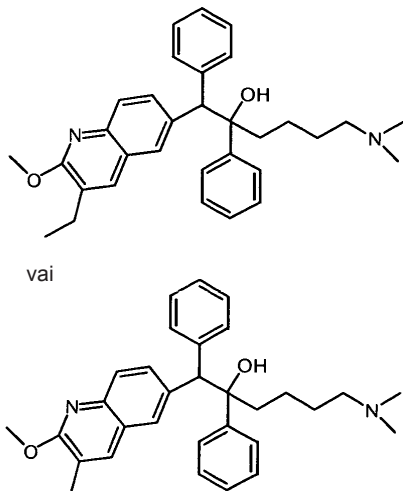
iegūšanai, kur minētais paņēmiens ietver šāda attiecīga starpprodukta:





pakļaušanu reakcijai ar pirmējo vai otrējo amīnu  $\text{HN}(\text{CH}_3)_2$  piemērota katalizatora klātbūtnē, neobligāti otra katalizatora klātbūtnē, piemērota liganda, piemērota šķīdinātāja klātbūtnē un CO un  $\text{H}_2$  klātbūtnē (zem spiediena) pie paaugstinātas temperatūras.

17. Savienojums, kas izvēlēts no:

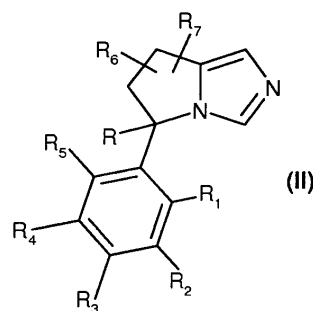


tā farmaceutiski pieņemams pievienotās skābes vai bāzes sāls, tā ceturtējs amīns, tā stereokīmiski izomēra forma, tā tautomēra forma vai tā N-oksīda forma.

18. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kombinācija saskaņā ar 12. pretenziju, kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, savienojums saskaņā ar 14. pretenziju vai produkts saskaņā ar 15. pretenziju, kur bakteriālā infekcija ir infekcija ar meticilīna rezistentu *Staphylococcus aureus* (MRSA), meticilīna rezistentiem koagulāzes negatīviem stafilokokiem (MRCNS), penicilīna rezistentu *Streptococcus pneumoniae* vai multirezistentu *Enterococcus faecium*.

19. Izmantošana, kombinācija, kompozīcija, savienojums vai produkts saskaņā ar 18. pretenziju, kur bakteriālā infekcija ir infekcija ar *Staphylococcus aureus* vai *Streptococcus pneumoniae*.

20. Izmantošana, kombinācija, kompozīcija, savienojums vai produkts saskaņā ar 19. pretenziju, kur bakteriālā infekcija ir infekcija ar *Staphylococcus aureus* (MRSA).



kur

R ir ūdeņraža atoms,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupa vai  $\text{C}_{2-7}$ alkenilgrupa, minētā  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupa un  $\text{C}_{2-7}$ alkenilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu līdz pieciem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no  $-\text{O}-\text{R}_8$  un  $-\text{N}(\text{R}_9)(\text{R}_{10})$ , kur  $\text{R}_8$  un  $\text{R}_9$  neatkarīgi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas, acilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, no kurām katra ir papildus neobligāti aizvietota ar vienu līdz četriem aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupas un  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas; vai

R ir  $-\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{R}_{10}$  vai  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{11})(\text{R}_{12})$ , kur  $\text{R}_{10}$ ,  $\text{R}_{11}$  un  $\text{R}_{12}$  neatkarīgi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas,  $\text{C}_{3-8}$ cikloalkilgrupas, arilgrupas, aril- $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkilgrupas un heteroarilgrupas, no kurām katra ir papildus neobligāti aizvietota ar vienu līdz četriem aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas un arilgrupas, kur  $\text{R}_{11}$  un  $\text{R}_{12}$ , kopā ņemti ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, neobligāti veido 3- līdz 8-locekļu gredzenu;

$\text{R}_{11}$ ,  $\text{R}_{12}$ ,  $\text{R}_4$  un  $\text{R}_5$  neatkarīgi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma,  $\text{C}_{2-7}$ alkenilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas,  $\text{C}_{3-8}$ cikloalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas,  $\text{H}_2\text{N}-$ ,  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupas,  $\text{C}_{3-8}$ cikloalkoksigrupas, ariloksigrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$  un  $-\text{N}(\text{R}_{13})(\text{R}_{14})$ , minētā  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupa,  $\text{C}_{2-7}$ alkenilgrupa,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupa, arilgrupa un heteroarilgrupa ir papildus neobligāti aizvietota ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēlētiem no  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupas, nitrogrupas, ciāngrupas,  $\text{C}_{1-7}$ dialkilaminogrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksi- $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas un  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkilgrupas, minētajam  $\text{R}_{10}$  ir tādas pašas nozīmes, kā definēts iepriekš, minētie  $\text{R}_{13}$  un  $\text{R}_{14}$  neatkarīgi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas,  $\text{C}_{3-8}$ cikloalkilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkoksigrupas, arilgrupas un ciāngrupas,

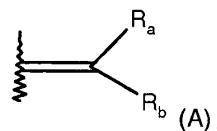
$\text{R}_3$  ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma,  $\text{C}_{2-7}$ alkenilgrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas,  $\text{C}_{3-8}$ cikloalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas,  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkilgrupas,  $\text{C}_{3-8}$ cikloalkoksigrupas, ariloksigrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas un  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$ , minētā  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupa,  $\text{C}_{2-7}$ alkenilgrupa,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupa, arilgrupa un heteroarilgrupa ir papildus neobligāti aizvietota ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēlētiem no  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupas, nitrogrupas, ciāngrupas,  $\text{C}_{1-7}$ dialkilaminogrupas,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksi- $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas un  $\text{C}_{1-7}$ halogēnalkilgrupas, minētajam  $\text{R}_{10}$  ir tādas pašas nozīmes, kā definēts iepriekš, ar nosacījumu, ka ne vairāk kā trīs no  $\text{R}_1$ ,  $\text{R}_2$ ,  $\text{R}_3$ ,  $\text{R}_4$  un  $\text{R}_5$  vienlaikus ir ūdeņraža atomi;

$\text{R}_{13}$  un  $\text{R}_{14}$  kopā ņemti ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, neobligāti veido 3- līdz 8-locekļu gredzenu;

R un  $\text{R}_1$ , kopā ņemti, neobligāti veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, kas satur 0 vai 1 heteroatomu, kas izvēlēts no O, N vai S;

$\text{R}_6$  un  $\text{R}_7$  neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, hidroksilgrupa,  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupa,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupa, fenilgrupa vai benzilgrupa, kur fenilgrupa un benzilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar vienu līdz četriem aizvietotājiem, neatkarīgi izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma,  $\text{C}_{1-7}$ alkoksigrupas un  $\text{C}_{1-7}$ alkilgrupas;

kad  $\text{R}_6$  un  $\text{R}_7$  ir pievienoti pie viena un tā paša oglekļa atoma, tie neobligāti veido daļu (A), kas atēlota ar sekojošu struktūru:



- (51) **C07D 487/04**<sup>(200601)</sup> (11) **1919916**  
**C07D 471/04**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/50**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 35/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06789951.8 (22) 23.08.2006  
(43) 14.05.2008  
(45) 03.04.2013  
(31) 711442 P (32) 25.08.2005 (33) US  
(86) PCT/US2006/032912 23.08.2006  
(87) WO2007/024945 01.03.2007  
(73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH  
(72) KSANDER, Gary Michael, US  
MEREDITH, Erik, US  
MONOVICH, Lauren G., US  
PAPILLON, Julien, US  
FIROOZNI, Fariborz, US  
HU, Qi-Ying, US
- (74) Pfister-Fu, Yixin, et al, Novartis Pharma AG, Patent Department, 4002 Basel, CH  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **KONDENSĒTI IMIDAZOLA ATVASINĀJUMI ALDOSTERONA SINTĀZES UN AROMATĀZES INHIBĒŠANAI**  
**CONDENSED IMIDAZOLO DERIVATIVES FOR THE INHIBITION OF ALDOSTERONE SYNTHASE AND AROMATASE**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (II)

kur  $R_a$  un  $R_b$  neatkarīgi ir ūdeņraža atoms,  $C_{1-7}$ alkilgrupa,  $C_{1-7}$ alkoksigrupa, acilgrupa,  $-COOR_{15}$  vai  $-COR_{15}$ , minētais  $R_{15}$  ir ūdeņraža atoms,  $C_{1-7}$ alkilgrupa,  $C_{1-7}$ halogēnalkilgrupa, arilgrupa vai  $-NH_2$ ; vai,

kad  $R_6$  un  $R_7$  ir pievienoti pie viena un tā paša oglekļa atoma, tie, kopā ņemti ar minēto oglekļa atomu, neobligāti veido 3- līdz 8-locekļu gredzenu; vai

farmaceutiski pieņemams tā sāls; vai tā optisks izomērs; vai optisko izomēru maisījums; vai savienojums, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

5-(3-fluor-4-metoksifenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes metilestera,

5-(3-fluor-4-metoksifenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazola;

1-[5-ciān-3-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)fenil]-3-etilurīnvielas;

5-(2-brom-4-ciānfenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes cikloheksilmetilamīda;

1,2,6',7'-tetrahidro-2-okso-1-(2,2,2-trifluoretil)spiro[3H-indol-3,5'-[5H]pirololo[1,2-c]imidazol]-6-karbonitrila,

1-(cikloheksilmetil)-1,2,6',7'-tetrahidro-2-oksospiro[3H-indol-3,5'-[5H]pirololo[1,2-c]imidazol]-6-karbonitrila un

1-etil-1,2,6',7'-tetrahidro-2-oksospiro[3H-indol-3,5'-[5H]pirololo[1,2-c]imidazol]-6-karbonitrila;

vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; vai tā izomēra; vai optisko izomēru maisījuma.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-3-etil-benznitrila;

4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-2-etil-benznitrila;

4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-3-metil-benznitrila;

4-(R)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il-3-fluor-benznitrila;

4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-2-metoksi-benznitrila;

4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-3-metoksi-benznitrila;

3-brom-4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-benznitrila;

3-hlor-4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-benznitrila;

4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-2-metil-benznitrila;

3-amino-4-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-benznitrila;

5-(4-ciān-2-metoksi-fenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes butilestera;

5-(4-ciān-2-metoksi-fenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes (4-metoksi-benzil)-metil-amīda;

5-(4-ciān-2-trifluormetoksi-fenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes metilestera;

5-(4-ciān-2-metoksi-fenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes 2-izopropoksi-estere;

5-(2-hlor-4-ciān-fenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes 4-fluor-benzilestera;

5-(2-hlor-4-ciānfenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes;

5-(2-hlor-4-ciānfenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes metilestera;

5-(4-ciān-2-metoksifenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes (4-fluorbenzil)metilamīda;

5-(4-ciān-2,5-dimetoksifenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes metilestera;

3-hlor-4-[5-(morfolin-4-karbonil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il]benznitrila;

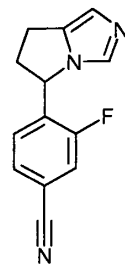
5-(4-ciān-2-trifluormetilfenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-karbonskābes metilestera; un

5-(3-fluor-4-metoksifenil)-6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazola.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 4-(R)-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-3-fluor-benznitrils brīvā formā vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 4-(R)-(6,7-dihidro-5H-pirololo[1,2-c]imidazol-5-il)-3-fluor-benznitrils.

5. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju R enantiomērs, kura formula ir



6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošanai par medikamentu dzīvnieka vai cilvēka ārstēšanas paņēmienā.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai traucējuma vai slimības, kas tiek pārnesta ar aldosterona sintēzi vai atbildīga par aldosterona sintēzes aktivitātes inhibēšanu, ārstēšanas paņēmienā.

8. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 7. pretenziju, kur traucējums vai slimība ir raksturīga ar anormālu aldosterona sintēzes aktivitāti.

9. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 7. pretenziju, kur traucējums vai slimība ir izvēlēta no hipokalēmijas, hipertensijas, sastrēguma sirds mazspējas, priekškambara fibrilācijas, nieru mazspējas, sevišķi, hroniskas nieru mazspējas, restenozes, aterosklerozes, X sindroma, aptaukošanās, nefropātijas, pēc miokarda infarkta, koronārām sirds slimībām, iekaisuma, pastiprinātas kolagēna veidošanas, fibrozes, tādas kā sirds vai miokarda fibrozes, un kas pārveidojas sekojošā hipertensijā un endotēlija disfunkcijā.

10. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošana medikamenta pagatavošanai traucējuma vai slimības, kas tiek pārnesta ar aldosterona sintēzi vai atbildīga par aldosterona sintēzes aktivitātes inhibēšanu, ārstēšanai.

11. Savienojuma saskaņā ar 10. pretenziju izmantošana, kur traucējums vai slimība ir raksturīga ar anormālu aldosterona sintēzes aktivitāti.

12. Savienojuma saskaņā ar 10. pretenziju izmantošana, kur traucējums vai slimība ir izvēlēta no hipokalēmijas, hipertensijas, sastrēguma sirds mazspējas, priekškambara fibrilācijas, nieru mazspējas, sevišķi, hroniskas nieru mazspējas, restenozes, aterosklerozes, X sindroma, aptaukošanās, nefropātijas, pēc miokarda infarkta, koronārām sirds slimībām, iekaisuma, pastiprinātas kolagēna veidošanās, fibrozes, tādas kā sirds vai miokarda fibrozes, un kas pārveidojas sekojošā hipertensijā un endotēlija disfunkcijā.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski iedarbīgu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai daudzumu un vienu vai vairākus farmaceutiski pieņemamus nesējus.

14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski iedarbīgu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai daudzumu un vienu vai divus, vai vairākus terapeitiski aktīvus līdzekļus, kas izvēlēti no angiotenzīna II receptora antagonista vai tā farmaceutiski pieņemama sāls, HMG-Co-A reduktāzes inhibitora vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; angiotenzīnu pārveidojoša enzīma (ACE) inhibitora vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; kalcija kanāla blokatora (CCB) vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; divkārtša angiotenzīnu pārveidojoša enzīma/neitrālas endopeptidāzes (ACE/NEP) inhibitora vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; endotēlija antagonista vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; renīna inhibitora vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; diurētiķa vai tā farmaceutiski pieņemama sāls; ApoA-I imitētāja; anti-diabētiska līdzekļa; aptaukošanos samazinoša līdzekļa; aldosterona receptora blokētāja; endotēlija receptora blokatora; CETP inhibitora; Na-K-ATPāzes membrānas sūkņa inhibitora; beta-adrenerģiskā receptora blokatora vai alfa-adrenerģiskā receptora blokatora; neitrālās endopeptidāzes (NEP) inhibitora; un inotropiska līdzekļa.

15. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski iedarbīgu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai daudzumu un vienu vai divus, vai vairākus terapeitiski aktīvus līdzekļus, kas izvēlēti no antiestrogēna; antiandrogēna; gonadorelīna agonista; topoizomērazes I inhibitora; topoizomērazes II inhibitora; mikrotubulu aktīva līdzekļa; alkilējoša līdzekļa; antineoplastiska anti-metabolīta; platīna savienojuma; savienojuma, kas uz proteīn- vai lipīdķīnāzes aktivitāti, vai proteīn- vai lipīdfosfatāzes aktivitāti mērķē vai to samazina; antiangiogēniska savienojuma; savienojuma, kurš izraisa

šūnas diferenciācijas procesus; monoklonālām antivielām; ciklooksigenāzes inhibitora; bisfosfonāta; heparanāzes inhibitora; bioloģiskās reakcijas modifikatora; Ras onkogēno izoformu inhibitora; telomerāzes inhibitora; proteāzes inhibitora; matricas metaloproteināzes inhibitora; metionīna aminopeptidāzes inhibitora; proteasomas inhibitora; līdzekļiem, kuri uz Flt-3 aktivitāti mērķē, to samazina vai inhibē; HSP90 inhibitora; antiproliferatīvām antivielām; HDAC inhibitora; savienojuma, kurš uz serīna/treonīna mTOR kināzes aktivitāti/funkciju mērķē, to samazina vai inhibē; somatostatīna receptora antagonista; antileikēmiska savienojuma; audzēja šūnas bojāšanas pieejām; EDG saistvielas; ribonukleoīda reduktāzes inhibitora; S-adenozilmetionīna dekarboksilāzes inhibitora; VEGF vai VEGFR monoklonālās antivielas; angiostatiska steroida; implantātu saturošiem kortikosteroidiem; AT1 receptora antagonista; un ACE inhibitora.

- (51) **A61K 9/14**<sup>(200601)</sup> (11) **1926476**  
**A61K 9/16**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 9/26**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/5025**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06802215.1 (22) 24.08.2006  
(43) 04.06.2008  
(45) 10.04.2013  
(31) 712150 P (32) 29.08.2005 (33) US  
(86) PCT/US2006/033022 24.08.2006  
(87) WO2007/027494 08.03.2007  
(73) Sanofi-Aventis U.S. LLC, 55 Corporate Drive, Bridgewater, NJ 08807, US
- (72) JACOBS, Irwin C., US  
HIGGINS, John D., c/o sanofi-aventis, Département de Brevets, FR  
GUILLLOT, Micael, US  
FRANSON, Nancy M., US  
ROCCO, William L., US  
ABU-IZZA, Khawla Abdullah, US
- (74) Morel-Pécheux, Muriel, et al, Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174 avenue de France, 75013 Paris, FR  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **7-HLOR-N,N,5-TRIMETIL-4-OKSO-3-FENIL-3,5-DIHDRO-4H-PIRIDAZINO[4,5-B]INDOL-1-ACETAMĪDA AMORFAS CIETAS DISPERSIJAS AMORPHOUS SOLID DISPERSIONS OF 7-CHLORO-N,N,5-TRIMETHYL-4-OXO-3-PHENYL-3,5-DIHYDRO-4H-PYRIDAZINO[4,5-B]INDOLE-1-ACETAMIDE**

(57) 1. Cieta dispersija, kas satur būtībā amorfu 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīdu un stabilizējošu polimēru, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no hidroksipropilmetilcelulozes ftalāta, celulozes acetāta ftalāta, hidroksipropilmetilcelulozes acetāta sukcināta un polimetakrilāta, kur būtībā amorfā nozīmē, ka vismaz 80 % no dispersijā esošās zāļu substances ir amorfā formā.

2. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais stabilizējošais polimērs ir hidroksipropilmetilcelulozes ftalāts.

3. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais stabilizējošais polimērs ir celulozes acetāta ftalāts.

4. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais stabilizējošais polimērs ir polimetakrilāts.

5. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju, kur 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīds ir klātesošs daudzumā no aptuveni 0,1 līdz 30 % attiecīgās masas uz stabilizējošā polimēra masu.

6. Cietā dispersija saskaņā ar 5. pretenziju, kur 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīds ir klātesošs daudzumā no aptuveni 1 līdz 25 % attiecīgās masas uz stabilizējošā polimēra masu.

7. Cietā dispersija saskaņā ar 6. pretenziju, kur 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīds ir klātesošs daudzumā no aptuveni 5 līdz 20 % attiecīgās masas uz stabilizējošā polimēra masu.

8. Cietā dispersija saskaņā ar 7. pretenziju, kur stabilizējošais polimērs ir hidroksipropilmetilcelulozes ftalāts.

9. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju, kur vismaz 90 % no 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīda ir amorfā formā.

10. Cietā dispersija saskaņā ar 9. pretenziju, kur vismaz 95 % no 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīda ir amorfā formā.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur cietu dispersiju saskaņā ar 1. pretenziju un vienu vai vairākas farmaceitiski pieņemamas palīgvielas.

12. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur cietu dispersiju saskaņā ar 8. pretenziju un vienu vai vairākas farmaceitiski pieņemamas palīgvielas.

13. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai neirotdeģeneratīvas slimības ārstēšanā vai profilaksē.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai neirotdeģeneratīvas slimības ārstēšanā vai profilaksē.

15. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai neiropātijas ārstēšanā vai profilaksē.

16. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai neiropātijas ārstēšanā vai profilaksē.

17. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai vēža vai audzēju ārstēšanā vai profilaksē.

18. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai vēža vai audzēju ārstēšanā vai profilaksē.

19. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai ādas sasprindzinājuma ārstēšanā vai profilaksē.

20. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai ādas sasprindzinājuma ārstēšanā vai profilaksē.

21. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai reimatoīdā artrīta ārstēšanā vai profilaksē.

22. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai reimatoīdā artrīta ārstēšanā vai profilaksē.

23. Cietā dispersija saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai sirds slimību vai traucējumu ārstēšanā vai profilaksē.

24. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai sirds slimību vai traucējumu ārstēšanā vai profilaksē.

25. Paņēmiens cietas dispersijas saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver stadijas:

a) 7-hlor-N,N,5-trimetil-4-okso-3-fenil-3,5-dihidro-4H-piridazino[4,5-b]indol-1-acetamīda un stabilizējoša polimēra izšķīdināšana piemērotā šķīdinātājā, lai iegūtu padomamā materiāla šķīdumu, kur minētais stabilizējošais polimērs ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no hidroksipropilmetilcelulozes ftalāta, celulozes acetāta ftalāta, hidroksipropilmetilcelulozes acetāta sukcināta un polimetakrilāta;

b) padomamā materiāla sūkņēšana caur atomizatoru; un

c) šķīdinātāja aizvākšana, lai iegūtu cietu dispersiju.

26. Paņēmiens saskaņā ar 25. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs ir viens vai vairāki šķīdinātāji, izvēlēti no grupas, kas sastāv no dihlormetāna, hloroforma, etanola, metanola, 2-propanola, etilacetāta, acetona un ūdens.

27. Paņēmiens saskaņā ar 25. pretenziju, kur stabilizējošais polimērs ir hidroksipropilmetilcelulozes ftalāts un piemērotais šķīdinātājs ir dihlormetāna un etanola 50 : 50 tilpuma maisījums.

- (51) **A61K 36/28**<sup>(200601)</sup> (11) **1931366**  
**A61P 29/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06809434.1 (22) 28.09.2006  
(43) 18.06.2008  
(45) 29.05.2013  
(31) MU12262005 (32) 30.09.2005 (33) IN  
736443 P 14.11.2005 US  
(86) PCT/IB2006/053540 28.09.2006  
(87) WO2007/036900 05.04.2007  
(73) Piramal Enterprises Limited, Piramal Tower Ganpatrao Kadam Marg Lower Parel, Mumbai 400 013, IN
- (72) CHAUHAN, Vijay, IN  
SUTHAR, Ashish, IN  
SAPRE, Dhananjay, IN  
BAL-TEMBE, Swati, IN  
GANGOPADHYAY, Ashok Kumar, IN  
KULKARNI-ALMEIDA, Asha, IN  
PARIKH, Sapna Hasit, IN

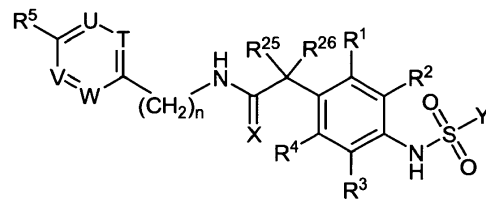


- (74) Harrison Goddard Foote, Saviour House, 9 St. Saviourgate, York YO1 8NQ, GB  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **AUGU IZCELSMES KOMPOZĪCIJA PRET IEKAISUMA SASLIMŠANĀM**  
**HERBAL COMPOSITION FOR INFLAMMATORY DISORDERS**
- (57) 1. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas, kas saistīts ar TNF- $\alpha$ , interleikīniem (IL-1, IL-6, IL-8) un starpšūnu adhēzijas molekulu 1 (ICAM-1), vaskulāro šūnu adhēzijas molekulu 1 (VCAM-1) un E-selektīnu, ārstēšanā, kur minētā kompozīcija satur ziedošu un augļus nesozu augu *Sphaeranthus indicus* galviņu ekstrakta terapeitiski efektīvu daudzumu kā aktīvu ingredientu kopā ar farmaceutiski pieņemamiem nesējiem.
2. Farmaceutiskā kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar 1. pretenziju, kur *Sphaeranthus indicus* ekstrakts satur 3a-hidroksi-5a,9-dimetil-3-metilēn-3a,4,5,5a,6,7,8,9b-oktahidro-3H-nafto[1,2-b]furan-2-onu (savienojums 1) kā bioaktīvu marķieri.
3. Farmaceutiskā kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar 2. pretenziju, kur *Sphaeranthus indicus* ekstrakts satur 2 - 9 % savienojuma 1.
4. Farmaceutiskā kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas, kas saistīts ar TNF- $\alpha$ , interleikīniem (IL-1, IL-6, IL-8) un starpšūnu adhēzijas molekulu 1 (ICAM-1), vaskulāro šūnu adhēzijas molekulu 1 (VCAM-1) un E-selektīnu, ārstēšanā, kur minētā kompozīcija satur 3a-hidroksi-5a,9-dimetil-3-metilēn-3a,4,5,5a,6,7,8,9b-oktahidro-3H-nafto[1,2-b]furan-2-ona (savienojums 1) terapeitiski efektīvu daudzumu kā aktīvo ingredientu kopā ar farmaceutiski pieņemamiem nesējiem.
5. Farmaceutiskā kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur minētā kompozīcija ir paredzēta perorālai ievadīšanai, ārgai lietošanai vai transdermālai ievadīšanai.
6. Farmaceutiskā kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur iekaisuma traucējums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no zarnu iekaisuma slimības, reimatoīdā artrīta, juvenilā reimatoīdā artrīta, psoriātiskā artrīta, osteoartrīta, grūti ārstējama reimatoīdā artrīta, hroniska nereimatoīdā artrīta, osteoporozes/kaulu rezorbcijas, sirds išēmiskās slimības, aterosklerozes, vaskulīta, čūlainā kolīta, psoriāzes un pieaugušo respiratorā distresa sindroma.
7. Farmaceutiskā kompozīcija izmantošanai iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur iekaisuma traucējums ir reimatoīdais artrīts.
8. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur iekaisuma traucējums ir zarnu iekaisuma slimība.
9. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur iekaisuma traucējums ir čūlainais kolīts.
10. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur iekaisuma traucējums ir ateroskleroze.
11. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto iekaisuma sasilšanas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur iekaisuma traucējums ir psoriāze.
12. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto iekaisuma sasilšanas ārstēšanā, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, kas papildus satur vismaz vienu pretiekaisuma līdzekli.
13. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto iekaisuma sasilšanas ārstēšanā, kā pieteikts 12. pretenzijā, kur pretiekaisuma līdzeklis ir izvēlēts no prednizolona, hidrokortizona, metotreksāta, sulfasalazīna, naproksēna, diklofenaka vai ibuprofēna.

**A61K 31/444**<sup>(200601)</sup>

**A61P 29/00**<sup>(200601)</sup>

- (21) 06806372.6 (22) 19.10.2006  
(43) 09.07.2008  
(45) 20.03.2013  
(31) 102005050408 (32) 19.10.2005 (33) DE  
727859 P 19.10.2005 US  
102005055486 18.11.2005 DE  
(86) PCT/EP2006/010057 19.10.2006  
(87) WO2007/045462 26.04.2007  
(73) Grünenthal GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, DE  
(72) LEE, Jeewoo, KR  
RYU, Hyung Chul, KR  
FRANK, Robert, DE  
BAHRENBURG, Gregor, DE  
DE VRY, Jean, BE  
CHRISTOPH, Thomas, DE  
SAUNDERS, Derek, John, DE  
SCHIENE, Klaus, DE  
SUNDERMANN, Bernd, DE  
(74) Brosch, Oliver, Kutznerberger & Wolff, Theodor-Heuss-Ring 23, 50668 Köln, DE  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **JAUNI VANILOĪDA RECEPTORU LIGANDI UN TO IZMANTOŠANA MEDIKAMENTU IEGŪŠANAI**  
**NOVEL VANILLOID RECEPTOR LIGANDS AND THEIR USE FOR PRODUCING MEDICAMENTS**  
(57) 1. Aizvietoti savienojumi ar vispārīgo formulu A



A,

kur

X ir O, S vai N-C $\equiv$ N;

Y ir -NH<sub>2</sub>; -NHR<sup>30</sup>; -NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup> vai lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

n ir 0, 1, 2, 3 vai 4;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota alifātiska C<sub>1-10</sub> grupa;

R<sup>5</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>;

ir lineāra vai sazarota, nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa; vai nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, iespējams, ir vismaz viens heteroatoms kā gredzena loceklis, kur grupa, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru skābekļa atomu cikloalifātiskas grupas gredzenā;

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir N, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir N, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

- (51) **C07D 401/12**<sup>(200601)</sup> (11) **1940821**  
**C07D 409/04**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 213/74**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 213/40**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 213/64**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 295/12**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 311/08**<sup>(200601)</sup>



T ir N, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup>

vai

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir N, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup>;

R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; vai lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

vai neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 6- vai 10-locekļu arilgrupa, kas var būt saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1,6</sub> alkilēngrupu vai C<sub>2,6</sub> heteroarilgrupu, vai C<sub>2,6</sub> alkinilēngrupu;

R<sup>8</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; -C(=NH)-NH<sub>2</sub>; -C(=NH)-NH-R<sup>27</sup>; -N=C(NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>; -N=C(NHR<sup>28</sup>)(NHR<sup>29</sup>);

ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, iespējams, ir vismaz viens heteroatoms kā gredzena loceklis, kur grupa, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar skābekļa atomu cikloalifātiskas grupas gredzenā un var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1,6</sub> alkilēngrupu vai C<sub>2,6</sub> heteroarilgrupu, C<sub>2,6</sub> alkinilēngrupu;

vai neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu 5- līdz 14-locekļu arilgrupu vai heteroarilgrupu, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1,6</sub> alkilēngrupu vai C<sub>2,6</sub> heteroarilgrupu, vai C<sub>2,6</sub> alkinilēngrupu;

R<sup>9</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup> un R<sup>29</sup> neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, iespējams, ir vismaz viens heteroatoms kā gredzena loceklis un kura var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1,6</sub> alkilēngrupu vai 2- līdz 6-locekļu heteroalkilēngrupu;

vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1,6</sub> alkilēngrupu vai 2- līdz 6-locekļu heteroalkilēngrupu;

R<sup>12</sup> un R<sup>13</sup>, attiecīgi, kopā ar slāpekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu heterocikloalifātisku grupu, kurai, iespējams, ir vismaz viens papildu heteroatoms kā gredzena loceklis, kas var būt kondensēts ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu;

un

R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup> neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir ūdeņraža atoms; ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu, un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1,6</sub> alkilēngrupu vai C<sub>2,6</sub> heteroarilgrupu, vai C<sub>2,6</sub> alkinilēngrupu;

vai ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, iespējams, ir vismaz viens heteroatoms kā gredzena loceklis; ar nosacījumu, ka R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup> katrā gadījumā nav ūdeņraža atoms; vai

R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup>, attiecīgi, kopā ar skābekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātisku grupu;

un R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup> un R<sup>32</sup> neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota C<sub>1-10</sub> alifātiska grupa;

kurā, ja nav norādīts citādi, minētā C<sub>1-10</sub> alifātiskā grupa neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 vai 9 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur: F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -SH, -O(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -S(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -NH(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -N(C<sub>1-5</sub>alkil)(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -C(=O)-O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-C(=O)-C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-fenilgrupu, fenilgrupu, -OCF<sub>3</sub> un -SCF<sub>3</sub>;

minētā 2- līdz 6-locekļu heteroalkilēngrupa, C<sub>1,6</sub> alkilēngrupa un C<sub>2,6</sub> alkenilēngrupa, un C<sub>2,6</sub> alkinilēngrupa neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 vai 9 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur: F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -SH, -O(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -S(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -NH(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -N(C<sub>1-5</sub>alkil)(C<sub>1-5</sub>alkil)grupu, -OCF<sub>3</sub> un -SCF<sub>3</sub>;

minētā (hetero)cikloalifātiskā grupa neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur: -C<sub>1,6</sub>alkilēn-OH, =CH<sub>2</sub>, -O-C<sub>1,6</sub>alkilēnoksetanilgrupu, -C<sub>1,5</sub>alkilēn-O-C<sub>1,5</sub>alkilēnoksetanilgrupu, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1,5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -N[C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkil]fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, okso (=O), tiokso (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -O-C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -N(C<sub>1,5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -NH-fenilgrupu, -N(C<sub>1,5</sub>alkil)fenilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, (1,2,5)-tiadiazolilgrupu, tiofenilgrupu, fenetilgrupu, piperidinilgrupu, pirodindilgrupu, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupu, piridinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, oksetanilgrupas, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupas, tiazolilgrupas, (1,2,5)-tiadiazolilgrupas, tiofenilgrupas, fenetilgrupas, -N[C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkil]fenilgrupas, -NH-fenilgrupas, -N(C<sub>1,5</sub>alkil)fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupas, piridinilgrupas, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur: F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu;

minēto mono- vai policiklisku gredzena sistēmu gredzeni neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietoti ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur: okso (=O), tiokso (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -N(C<sub>1,5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no šādas virknes, kura satur: F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu;

minētā arilgrupa vai heteroarilgrupa neobligāti attiecīgi var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no šādas virknes, kura satur: F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -N(C<sub>1,5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no šādas virknes, kura satur: F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -N(C<sub>1,5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -NH-C(=O)-O-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-H, -C(=O)-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>1,5</sub>alkilgrupu, -C(=O)-N(C<sub>1,5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -O-fenilgrupu,

-O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no šādās virknes, kura satur: F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu, attiecīgi vienā no to tiros stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāļu vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

2. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka

X ir O, S vai N-C≡N;

n ir 0, 1, 2, 3 vai 4;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa;

R<sup>5</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai ir lineāra vai sazarota, nepiesātināta vai piesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa;

vai ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, iespējams, ir vismaz viens heteroatoms kā gredzena loceklis, kur grupa, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar skābekļa atomu cikloalifātiskas grupas gredzenā;

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir N, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir N, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir N, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup>

R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; vai ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta alifātiska C<sub>1-10</sub>grupa;

vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 6- vai 10-locekļu arilgrupa, kas var būt saistīta ar lineāru vai sazarotu, aizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>heteroarilgrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu;

R<sup>8</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; -C(=NH)-NH<sub>2</sub>; -C(=NH)-NH-R<sup>27</sup>; -N=C(NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>; -N=C(NHR<sup>28</sup>)(NHR<sup>29</sup>);

ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa;

ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar skābekļa atomu cikloalifātiskas grupas gredzenā un var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu;

vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono-

vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu;

R<sup>9</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa;

R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup> un R<sup>29</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi,

ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa;

ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu, un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai 2- līdz 6-locekļu heteroalkilēngrupu;

vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu, un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai 2- līdz 6-locekļu heteroalkilēngrupu;

vai R<sup>12</sup> un R<sup>13</sup>, attiecīgi, kopā ar slāpekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu heterocikloalifātisku grupu, kurai, kā gredzena loceklis, iespējams, ir vismaz viens papildu heteroatoms, kas var būt kondensēts ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu;

un

R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup>, neatkarīgi cits no cita attiecīgi ir ūdeņraža atoms; ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa;

ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu;

vai ir nepiesātināta vai piesātināta 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa;

ar nosacījumu, ka R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup> katrā gadījumā nav ūdeņraža atoms; vai

R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup>, attiecīgi, kopā ar skābekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido piesātinātu vai nepiesātinātu 3-, 4-, 5- vai 6-locekļu cikloalifātisku grupu;

minētā heteroalkilēngrupa, attiecīgi, satur 1, 2 vai 3 heteroatomus, kas, attiecīgi, neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur skābekļa, sēra un slāpekļa (NH) atomu kā ķēdes locekli(-ļus);

minētā (hetero)cikloalifātiskā grupa, attiecīgi, satur 1, 2 vai 3 (papildu) heteroatomus, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur skābekļa, slāpekļa un sēra atomu;

minētajai mono- vai policikliskajai gredzena sistēmai ir 5, 6 vai 7 locekļi un tā katrā gadījumā satur 1, 2, 3, 4 vai 5 heteroatomus kā gredzena locekļus, kas, attiecīgi, neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur skābekļa, slāpekļa un sēra atomu;

un

minētā heteroarilgrupa, attiecīgi, satur 1, 2, 3, 4 vai 5 heteroatomu(-us), kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur skābekļa, slāpekļa un sēra atomu kā gredzena locekli(-ļus);

attiecīgi vienā no to tiros stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāļu vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

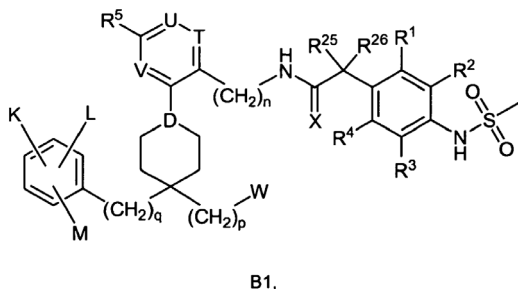
3. Savienojumi saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka

n, X, Y, T, U, V, W, R<sup>1</sup> līdz R<sup>7</sup>, R<sup>9</sup> un R<sup>11</sup> līdz R<sup>32</sup> ir tāda nozīme, kā noteikts 1. pretenzijā,

un

R<sup>8</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; -C(=NH)-NH<sub>2</sub>; -C(=NH)-NH-R<sup>27</sup>; -N=C(NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>; -N=C(NHR<sup>28</sup>)(NHR<sup>29</sup>); ir piesātināta vai nepiesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota ķēde ar 1 līdz 7 oglekļa atomiem kā ķēdes locekļiem, kur 1, 2 vai 3 oglekļa atomi var būt aizvietoti ar heteroatomu, kas izvēlēts no virknes, kura satur skābekļa, sēra un slāpekļa (NH) atomu; ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kurai, iespējams, ir vismaz viens heteroatoms kā gredzena loceklis, kur grupa, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar skābekļa atomu cikloalifātiskas grupas gredzenā un var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzenu sistēmu, un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu; vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu, un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu.

4. Savienojumi ar vispārīgo formulu (B1) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai



B1,

kur

U, T, V, X, n, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup> ir tāda nozīme, kā noteikts 2. pretenzijā;

D ir CH vai N;

p ir 0, 1, 2 vai 3;

q ir 0, 1, 2 vai 3;

K, L un M, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -NH-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -N(C<sub>1-5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -NH-C(=O)-O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -C(=O)-H, -C(=O)-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>1-5</sub>alkilgrupa, -C(=O)-N(C<sub>1-5</sub>alkil)<sub>2</sub>, -O-fenilgrupa, -O-benzilgrupa, fenilgrupa un benzilgrupa, kur, attiecīgi, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas, attiecīgi, neatkarīgi ir izvēlēti no šādas virknes, kura satur: F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu;

W ir -CN, -NR<sup>34</sup>R<sup>35</sup>, -C(=O)-R<sup>36</sup> vai -C(=O)-OR<sup>37</sup>;

un R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup> un R<sup>37</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir ūdeņraža atoms vai ir lineāra vai sazarota, piesātināta vai nepiesātināta C<sub>1-10</sub>alifātiska grupa; ir nepiesātināta vai piesātināta, neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- vai 9-locekļu cikloalifātiska grupa, kas, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar skābekļa atomu cikloalifātiskas grupas gredzenā un var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzenu sistēmu, un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu; vai ir neaizvietota vai vismaz vienreiz aizvietota 5- līdz 14-locekļu arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas var būt kondensēta ar piesātinātu vai nepiesātinātu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu mono- vai policiklisku gredzena sistēmu un/vai ir saistīta ar lineāru vai sazarotu, neaizvietotu vai vismaz vienreiz aizvietotu C<sub>1-6</sub>alkilēngrupu vai C<sub>2-6</sub>alkenilēngrupu, vai C<sub>2-6</sub>alkinilēngrupu.

5. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgi ar to, ka

X ir O, S vai N-C≡N;

n ir 0, 1, 2, 3 vai 4;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; NO<sub>2</sub>; -CN; -F<sub>3</sub>; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu;

R<sup>5</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>;

ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu un n-heptilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheptilgrupu, ciklooktānilgrupu, cikloheksenilgrupu, cikloheptenilgrupu, imidazolidinilgrupu, tetrahidrofuranilgrupu, tetrahidrotiofenilgrupu, piperidinilgrupu, piperidinilgrupu, morfolinilgrupu, piperazinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu, azokanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar minētās grupas gredzena skābekļa atomu un, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, okso (=O), tiokso (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-pentilgrupu, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupu, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupu, piridinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, -NH-fenilgrupas, -N(CH<sub>3</sub>)fenilgrupas, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupas, piridinilgrupas, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no grupas, kura satur F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu;

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir N, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir N, un V ir C-R<sup>9</sup>, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir N, un U ir C-R<sup>7</sup>, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup> vai

T ir C-R<sup>6</sup>, un U ir N, un V ir N, un W ir C-R<sup>8</sup>

R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu un n-heptilgrupu, vai ir fenilgrupa, kas var būt saistīta ar -(CH=CH)-, -C≡C-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>grupu un/vai neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes,



kura satur F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu un n-pentilgrupu;

R<sup>8</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup>; -C(=NH)-NH<sub>2</sub>; -C(=NH)-NH-R<sup>27</sup>; -N=C(NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>; -N=C(NHR<sup>28</sup>)(NHR<sup>29</sup>);

ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, 3-metil-but-1-ilgrupu, 4-metil-pent-1-ilgrupu, (3,3)dimetil-but-1-ilgrupu, n-heksilgrupu un n-heptilgrupu;

ir alkenilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur 2-metilpropen-1-ilgrupu, 3-metil-but-2-en-1-ilgrupu, (3,3)dimetil-but-1-enilgrupu, etenilgrupu, propenilgrupu, butenilgrupu, 1-oktenilgrupu, 1-heptenilgrupu, 1-heksenilgrupu un 1-pentenilgrupu;

ir alkinilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur etinilgrupu, propinilgrupu, butinilgrupu, (3,3)dimetil-but-1-inilgrupu, 4-metil-pent-1-inilgrupu, 1-heksinilgrupu un pentinilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheptilgrupu, cikloksenilgrupu, cikloheksenilgrupu, cikloheptenilgrupu, imidazolidinilgrupu, tetrahidrofuranilgrupu, tetrahidrotiofenilgrupu, piroolidinilgrupu, piperidinilgrupu, morfolinilgrupu, piperazinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu, azokanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar minēto grupu gredzenu skābekļa atomu vai ar -(CH=CH)-, -C≡C- vai -C≡C-CH<sub>2</sub> grupu un neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur -CN, -CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N-[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]-fenilgrupu, -N-[C(=O)-CH<sub>3</sub>]-fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, okso (=O), tiokso (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-pentilgrupu, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupu, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupu, piridinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, -NH-fenilgrupas, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupas, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupas, piridinilgrupas, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un O-benzilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur tetrazolilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, (1,3)benzodioksolilgrupu, (1,4)benzodioksanilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu, pirolilgrupu, pirazolilgrupu, pirazinilgrupu, piranilgrupu, triazolilgrupu, piridinilgrupu, imidazolilgrupu, indolilgrupu, izoindolilgrupu, benzo[b]furanilgrupu, (2,3)dihidrotieno[3,4-b][1,4]dioksinilgrupu, benzo[b]tiofenilgrupu, benzoksazolilgrupu, benzizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, oksazolilgrupu, izoksazolilgrupu, piridazinilgrupu, pirazinilgrupu, pirimidinilgrupu, indazolilgrupu, hinoksalinilgrupu, hinolinilgrupu un izohinolinilgrupu, kura, attiecīgi, var būt saistīta ar -(CH=CH)-, -C≡C-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>grupu un/vai, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-pentilgrupu, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>),

-NH-C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-H, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur attiecīgi -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu;

R<sup>9</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -CF<sub>2</sub>Cl; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-OH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -S(=O)<sub>2</sub>-OH; -NHR<sup>11</sup>; -NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; -OR<sup>14</sup>; -SR<sup>15</sup>; -C(=O)-NHR<sup>16</sup>; -C(=O)-NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NHR<sup>19</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>; -C(=O)-OR<sup>22</sup>; -C(=O)-R<sup>23</sup>; -S(=O)-R<sup>24</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>24</sup> vai ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu un n-heptilgrupu;

R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup> un R<sup>29</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi,

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu, n-heptilgrupu, 3-pentilgrupu, 4-heptilgrupu, n-oktilgrupu, n-nonilgrupu, 5-nonilgrupu, (2,6)dimetil-hept-4-ilgrupu, 3-metilbutilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)dimetilbutilgrupu, etenilgrupu, propenilgrupu, 2-butenilgrupu, 3-butenilgrupu, 2-pentenilgrupu un 3-pentenilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur 2,3-dihidro-1H-indenilgrupu, ciklopropilgrupu, oksetanilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheptilgrupu, cikloksenilgrupu, cikloheptenilgrupu, imidazolidinilgrupu, tetrahidrofuranilgrupu, tetrahidrotiofenilgrupu, piroolidinilgrupu, piperidinilgrupu, morfolinilgrupu, piperazinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu, azokanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kura attiecīgi var būt saistīta ar -CH<sub>2</sub>-O-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-O-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>grupu un/vai neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, okso (=O), tiokso (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-pentilgrupu, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupu, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupu, piridinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, -NH-fenilgrupas, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupas, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>piridinilgrupas, piridinilgrupas, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, -butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un O-benzilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur fenilgrupu, naftilgrupu, (1,3)benzodioksolilgrupu, (1,4)benzodioksanilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu, pirolilgrupu, pirazolilgrupu, pirazinilgrupu, piranilgrupu, triazolilgrupu, piridinilgrupu, imidazolilgrupu, indolilgrupu, izoindolilgrupu, benzo[b]furanilgrupu, benzo[b]tiofenilgrupu, benzoksazolilgrupu, benzizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, oksazolilgrupu, izoksazolilgrupu, piridazinilgrupu, pirazinilgrupu, pirimidinilgrupu, indazolilgrupu, hinoksalinilgrupu, hinolinilgrupu un izohinolinilgrupu, kura attiecīgi var būt saistīta ar -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>grupu un/vai attiecīgi neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-pentilgrupu, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>),



-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), -NH-C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-H, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur attiecīgi -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-C<sub>1-5</sub>alkilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un O-benzilgrupu;

vai

R<sup>12</sup> un R<sup>13</sup> attiecīgi kopā ar slāpekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido grupu, kas izvēlēta no virknes, kura satur 3-aza-biciklo[3.1.1]heptilgrupu, 6-aza-spiro[2.5]oktilgrupu, 3-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 6-aza-biciklo[3.3.1]heptilgrupu, 8-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 1-oksa-2,8-diaza-spiro[4.5]dec-2-enilgrupu, azokanilgrupu, izoindolilgrupu, indolilgrupu, (1,2,3,6)tetrahidropiridinilgrupu, (4,5,6,7)tetrahidroizoksazolo[5,4-c]piridinilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, (1,3,4,5)-tetrahidropirido[4,3-b]indolilgrupu, (3,4)dihidro-1H-izohinolinilgrupu, (1,3,4,9)tetrahydro-[b]-karbolinilgrupu, imidazolidinilgrupu, (1,3)tiazolidinilgrupu, piperazinilgrupu, morfolinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kura neobligāti attiecīgi var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-oksetanilgrupu, -CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, =CH<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-oksetanilgrupu, (4,5)dihidroizoksazoloilgrupu, tiazolilgrupu, (1,2,5)tiadiazolilgrupu, tiofenilgrupu, fenetilgrupu, -CN, -CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N-[C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]fenilgrupu, -N-[C(=O)-CH<sub>3</sub>]fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, okso (=O), tiokso (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-pentilgrupu, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupu, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>piridinilgrupu, piridinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-benzilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, oksetanilgrupas, (4,5)-dihidroizoksazoloilgrupas, tiazolilgrupas, (1,2,5)tiadiazolilgrupas, tiofenilgrupas, fenetilgrupas, -N-[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]fenilgrupas, -N-[C(=O)-CH<sub>3</sub>]fenilgrupas, -NH-fenilgrupas, -N(CH<sub>3</sub>)fenilgrupas, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>piridinilgrupas, piridinilgrupas, -O-fenilgrupas, -O-benzilgrupas, fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, -OH, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -CN, -NO<sub>2</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, fenilgrupu un -O-benzilgrupu;

un

R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir ūdeņraža atoms; ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu un n-heptilgrupu; ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur fenilgrupu, naftilgrupu, (1,3)-benzodioksolilgrupu, (1,4)-benzodioksanilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu, pirolilgrupu, pirazolilgrupu, pirazinilgrupu, piranilgrupu, triazolilgrupu, piridinilgrupu, imidazolilgrupu, indolilgrupu, izoindolilgrupu, benzo[b]furanilgrupu, benzo[b]tiofenilgrupu, benzoksazolilgrupu, benzizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, oksazolilgrupu, izoksazolilgrupu, piridazinilgrupu, pirazinilgrupu, pirimidinilgrupu, indazolilgrupu, hinoksalinilgrupu, hinolinilgrupu un izohinolinilgrupu, kur grupa, attiecīgi, var būt saistīta ar -(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>grupu un/vai, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu un n-pentilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu un cikloheksenilgrupu;

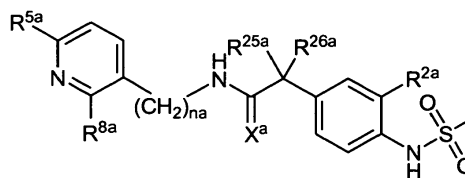
ar nosacījumu, ka R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup> katrā gadījumā nav ūdeņraža atoms; vai

R<sup>25</sup> un R<sup>26</sup>, attiecīgi, kopā ar skābekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido grupu, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu un cikloheksenilgrupu;

kur,

ja nav norādīts citādi, minētā alkilgrupa, alkenilgrupa un alkinilgrupa, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 vai 9 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-fenilgrupu, fenilgrupu, F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), -OCF<sub>3</sub> un -SCF<sub>3</sub>; attiecīgi, neobligāti vienā no to tīro stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāļu vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

6. Savienojumi ar vispārīgo formulu (Ia1) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pentenzijai



Ia1,

kur

X<sup>a</sup> ir O vai S;

na ir 0, 1 vai 2;

R<sup>2a</sup> ir F; Cl; Br; I vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CBr<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CH<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CCl<sub>3</sub>, -O-CBr<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -S-CH<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CCl<sub>3</sub>, -S-CBr<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S-CF<sub>2</sub>Cl un -S-CCl<sub>2</sub>F;

R<sup>5a</sup> ir F; Cl; Br; I; -SF<sub>5</sub>;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CBr<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>Cl, -CCl<sub>2</sub>F, -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>OH), *tert*-butilgrupu, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CCl<sub>3</sub>, -O-CBr<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>2</sub>Cl, -O-CCl<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CCl<sub>3</sub>, -S-CBr<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S-CF<sub>2</sub>Cl, -S-CCl<sub>2</sub>F, -S-CF<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(O)-CF<sub>3</sub>, -S(O)-CCl<sub>3</sub>, -S(O)-CBr<sub>3</sub>, -S(O)-CHF<sub>2</sub>, -S(O)-CH<sub>2</sub>F un -S(O)-CF<sub>2</sub>Cl;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu un cikloheksenilgrupu;

R<sup>8a</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -CN; -OH; -NH<sub>2</sub>; -NO<sub>2</sub>; -NHR<sup>11a</sup>; -NR<sup>12a</sup>R<sup>13a</sup>; -OR<sup>14a</sup>; -SR<sup>15a</sup>; -C(=O)-OR<sup>22a</sup>;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CBr<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>Cl, -CCl<sub>2</sub>F, etilgrupu, -CF<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CBr<sub>3</sub>, -CHF-CF<sub>2</sub>Cl, -CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>Cl, -CFCl-CF<sub>2</sub>Cl, n-propilgrupu, -CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CF(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, izopropilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-butilgrupu, 3-metil-but-1-ilgrupu, 4-metil-pent-1-ilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetil-but-1-ilgrupu, (3,3)-dimetil-but-1-inilgrupu, 4-metil-pent-1-inilgrupu, 1-heksinilgrupu, propinilgrupu, etinilgrupu, butinilgrupu, pentinilgrupu, 2-metilpropen-1-ilgrupu, 3-metil-but-2-en-1-ilgrupu, 1-pentenilgrupu, 1-oktenilgrupu, 1-heptenilgrupu, 1-heksenilgrupu un (3,3)-dimetil-but-1-enilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheksenilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, morfolinilgrupu, piperazinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu, azokanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar minēto grupu gredzenu skābekļa atomu vai ar -(CH=CH)-, -C=C- vai -C≡C-CH<sub>2</sub>

grupu un neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi ir izvēlēti no virknes, kura satur  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ ,  $-CN$ ,  $-CH_2-N(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-N(C_2H_5)_2$ ,  $-CH_2-NH-CH_3$ ,  $-CH_2-NH-C_2H_5$ ,  $-N-[C(=O)-C_2H_5]$ fenilgrupu,  $-N-[C(=O)-CH_3]$ fenilgrupu; okso (=O), tiokso (=S), metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu un n-pentilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur tetrazolilgrupu, (1,3)-benzodioksolilgrupu, (1,4)-benzodioksanilgrupu, indolilgrupu, (2,3)-dihidrotieno[3,4-b][1,4]dioksinilgrupu, benzo[b]furanilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, oksazolilgrupu, tiazolilgrupu, imidazolilgrupu, pirimidinilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu un piridinilgrupu, kas, attiecīgi, var būt saistīta ar  $-(CH=CH)-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-(CH_2)-$ ,  $-(CH_2)_2-$  vai  $-(CH_2)_3$ grupu un/vai attiecīgi neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-SF_5$ ,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-NH-S(=O)_2-C_2H_5$ ,  $-NH-S(=O)_2-CH(CH_3)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ , metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu un *tert*-butilgrupu;

$R^{11a}$ ,  $R^{12a}$ ,  $R^{13a}$ ,  $R^{14a}$ ,  $R^{15a}$  un  $R^{22a}$ , neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-pentilgrupu, 3-pentilgrupu, n-heptilgrupu, 4-heptilgrupu, n-oktilgrupu, n-nonilgrupu, 5-nonilgrupu, (2,6)-dimetilhept-4-ilgrupu, 3-metilbutilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetilbutilgrupu,  $-CH_2-CH_2-O-CH_3$ ,  $-CH_2-CH_2-O-C_2H_5$ ,  $-CH_2-CH_2-O$ -fenilgrupu,  $-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_3$ , etenilgrupu, propenilgrupu, 2-butenilgrupu, 3-butenilgrupu, 2-pentenilgrupu un 3-pentenilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur 2,3-dihidro-1H-indenilgrupu, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu un cikloheksilgrupu, kas, attiecīgi, var būt saistīta ar  $-(CH_2)-$ ,  $-(CH_2)_2-$  vai  $-(CH_2)_3$ grupu un/vai, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur  $-(CH_2)$ piridinilgrupu,  $-(CH_2)_2$ piridinilgrupu, benzilgrupu, fenetilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu, pirolilgrupu un piridinilgrupu, kura neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur  $-CF_3$ , F, Cl, Br,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ , metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu un *tert*-butilgrupu; vai

$R^{12a}$  un  $R^{13a}$ , attiecīgi, kopā ar slāpekļa atomu, kas tos saista, kā gredzena loceklis, veido grupu, kas izvēlēta no virknes, kura satur 3-aza-biciklo[3.1.1]heptilgrupu, 6-aza-spiro[2.5]oktilgrupu, 3-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 6-aza-biciklo[3.3.1]heptilgrupu, 8-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 1-oksa-2,8-diaza-spiro[4.5]dec-2-enilgrupu, azokanilgrupu, izoindolilgrupu, indolilgrupu, (1,2,3,6)-tetrahidropiridinilgrupu, (4,5,6,7)-tetrahidroizoksazol[5,4-c]piridinilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, (1,2,3,6)-tetrahidropiridinilgrupu, piperazinilgrupu, morfolinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kura neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur  $-CH_2-O-CH_2$ -oksetanilgrupu,  $-O-CH_2$ -oksetanilgrupu,  $-CH_2-OH$ ,  $-CH_2-CH_2-OH$ ,  $=CH_2$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ ,  $-CN$ ,  $-CH_2-N(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-N(C_2H_5)_2$ ,  $-CH_2-NH-CH_3$ ,  $-CH_2-NH-C_2H_5$ ,  $-N-[C(=O)-C_2H_5]$ fenilgrupu,  $-N-[C(=O)-CH_3]$ fenilgrupu,  $-CH_2-O-CH_3$ ,  $-CH_2-O-CH_2-CH_3$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH$ -fenilgrupu,  $-N(CH_3)$ fenilgrupu,  $-N(C_2H_5)$ fenilgrupu, okso (=O), tiokso (=S),  $-OH$ , F, Cl, Br,  $-CF_3$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ , metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu un n-pentilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, (1,2,5)-tiadiazolilgrupu, tiofenilgrupu, fenetilgrupu, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu,  $-O$ -fenilgrupu,  $-O-C(=O)-CH_3$ ,  $-O-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-O-C(=O)-C(CH_3)_3$ ,  $-(CH_2)$ piridinilgrupu, piridinilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, oksetanilgrupas, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupas, tiazolilgrupas, (1,2,5)-tiadiazolilgrupas, tiofenilgrupas, fenetilgrupas,  $-N-[C(=O)-C_2H_5]$ fenilgrupas,

$-N-[C(=O)-CH_3]$ fenilgrupas,  $-NH$ -fenilgrupas,  $-N(CH_3)$ fenilgrupas,  $-N(C_2H_5)$ fenilgrupas,  $-(CH_2)$ piridinilgrupas, piridinilgrupas, fenilgrupas,  $-O$ -fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur  $-CF_3$ ,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ , F, Cl, Br, metilgrupu, etilgrupu, izopropilgrupu, n-propilgrupu, n-butilgrupu, *tert*-butilgrupu un sec-butilgrupu;

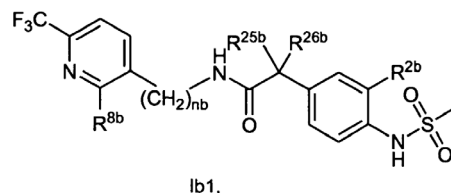
$R^{25a}$  un  $R^{26a}$  neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir ūdeņraža atoms; ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur  $-CH_2-OH$ ,  $-CH_2-CH_2-OH$ ,  $-CH_2-CH_2-CH_2-OH$ ,  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-OH$ , izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, metilgrupu, etilgrupu un n-propilgrupu;

ar nosacījumu, ka  $R^{25a}$  un  $R^{26a}$  katrā gadījumā nav ūdeņraža atoms; vai

$R^{25a}$  un  $R^{26a}$ , attiecīgi, kopā ar skābekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido grupu, kas ir izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu un cikloheptilgrupu;

attiecīgi, neobligāti vienā no divi stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāļu vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

7. Savienojumi ar vispārīgo formulu (Ib1) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai



Ib1,

kur

nb ir 0, 1 vai 2;

$R^{25b}$  ir metilgrupa;  $-O-CH_3$ ; F; Cl; Br vai I;

$R^{8b}$  ir H; F; Cl; Br; I;  $-CN$ ;  $-OH$ ;  $-NH_2$ ;  $-NO_2$ ;  $-NHR^{11b}$ ;  $-NR^{12b}R^{13b}$ ;  $-OR^{14b}$ ;  $-SR^{15b}$ ;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu,  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CBr_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CH_2F$ ,  $-CF_2Cl$ ,  $-CCl_2F$ , etilgrupu,  $-CF_2-CH_3$ ,  $-CH_2-CF_3$ ,  $-C_2F_5$ ,  $-CH_2-CCl_3$ ,  $-CH_2-CBr_3$ ,  $-CHF-CF_2Cl$ ,  $-CF_2-CF_2Cl$ ,  $-CFCl-CF_2Cl$ , n-propilgrupu,  $-CF_2-CF_2-CF_3$ ,  $-CF(CF_3)_2$ , izopropilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu,  $-CH_2-CH_2-CH_2-CF_3$ ,  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CF_3$ ,  $-CH_2-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-CH_2-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-CH_2-C(=O)-C(CH_3)_3$ ,  $-CH_2-O-C(=O)-CH_3$ ,  $-CH_2-O-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-CH_2-O-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-O-C(=O)-C(CH_3)_3$ , n-butilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetil-but-1-ilgrupu, 3-metil-but-1-ilgrupu, 4-metil-pent-1-ilgrupu, (3,3)-dimetil-but-1-inilgrupu, 4-metil-pent-1-inilgrupu, 1-heksinilgrupu, propinilgrupu, etinilgrupu, butinilgrupu, pentinilgrupu, 2-metilpropen-1-ilgrupu, 3-metil-but-2-en-1-ilgrupu, 1-pentenilgrupu, 1-oktenilgrupu, 1-heptenilgrupu, 1-heksenilgrupu un (3,3)-dimetil-but-1-enilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheksenilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, morfolinilgrupu, piperazinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu, azokanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar minēto grupu gredzena skābekļa atomu vai ar  $-(CH=CH)-$ ,  $-C\equiv C-$  vai  $-C\equiv C-CH_2$  grupu un neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietoti ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita izvēlēti no virknes, kura satur  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ ,  $-CN$ ,  $-CH_2-N(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-N(C_2H_5)_2$ ,  $-CH_2-NH-CH_3$ ,  $-CH_2-NH-C_2H_5$ ,  $-N-[C(=O)-C_2H_5]$ fenilgrupu,  $-N-[C(=O)-CH_3]$ fenilgrupu, okso (=O), tiokso (=S), metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu un n-pentilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur tetrazolilgrupu, (1,3)-benzodioksolilgrupu, (1,4)-benzodioksanilgrupu, indolilgrupu, (2,3)-dihidrotieno[3,4-b][1,4]dioksinilgrupu, benzo[b]furanilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, oksazolilgrupu, tiazolilgrupu, imidazolilgrupu, pirimidinilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu un piridinilgrupu, kas, attiecīgi, var būt saistīta ar  $-(CH=CH)-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-(CH_2)-$ ,  $-(CH_2)_2-$  vai  $-(CH_2)_3$ grupu un/vai, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no

virtnes, kura satur F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu un *terc*-butilgrupu;

R<sup>11b</sup>, R<sup>12b</sup>, R<sup>13b</sup>, R<sup>14b</sup> un R<sup>15b</sup> neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-pentilgrupu, 3-pentilgrupu, n-heptilgrupu, 4-heptilgrupu, n-oktilgrupu, n-nonilgrupu, 5-nonilgrupu, (2,6)-dimetilhept-4-ilgrupu, 3-metil-butilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetilbutilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, etenilgrupu, propenilgrupu, 2-butenilgrupu, 3-butenilgrupu, 2-pentenilgrupu un 3-pentenilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur oksetanilgrupu, 2,3-dihidro-1H-indenilgrupu, piperidinilgrupu, piroldinilgrupu, ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu un cikloheksilgrupu, kas, attiecīgi, var būt saistīta ar -CH<sub>2</sub>-O-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-O-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> grupu un/vai, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virtnes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> un -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupu, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupu, benzilgrupu, fenetilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu, pirolilgrupu un piridinilgrupu, kas neobligāti var būt aizvietota, attiecīgi, ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virtnes, kura satur -CF<sub>3</sub>, F, Cl, Br, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu un *terc*-butilgrupu;

un

R<sup>12b</sup> un R<sup>13b</sup>, attiecīgi, kopā ar slāpekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido grupu, kas izvēlēta no virtnes, kura satur 3-aza-biciklo[3.1.1]heptilgrupu, 6-aza-spiro[2.5]oktilgrupu, 3-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 6-aza-biciklo[3.3.1]heptilgrupu, 8-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 1-oksa-2,8-diaza-spiro[4.5]dec-2-enilgrupu, azokanilgrupu, izoindolilgrupu, indolilgrupu, (1,2,3,6)-tetrahidropiridinilgrupu, (4,5,6,7)-tetrahidroizoksazol[5,4-c]piridinilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, (1,2,3,6)-tetrahidropiridinilgrupu, piperazinilgrupu, morfolinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas neobligāti, attiecīgi, var būt aizvietota ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virtnes, kura satur -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-oksetanilgrupu, -O-CH<sub>2</sub>-oksetanilgrupu, -CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, =CH<sub>2</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CN, -CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]-fenilgrupu, -N[C(=O)-CH<sub>3</sub>]-fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)-fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-fenilgrupu, okso (=O), tiokso (=S), -OH, F, Cl, Br, -CF<sub>3</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, izopropilgrupu, n-propilgrupu, n-butilgrupu, *terc*-butilgrupu, sec-butilgrupu, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, (1,2,5)-tiadiazolilgrupu, tiofenilgrupu, fenetilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupu, piridinilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, oksetanilgrupas, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupas, tiazolilgrupas, (1,2,5)-tiadiazolilgrupas, tiofenilgrupas, fenetilgrupas, -N-[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]-fenilgrupas, -N-[C(=O)-CH<sub>3</sub>]-fenilgrupas, -NH-fenilgrupas, -N(CH<sub>3</sub>)-fenilgrupas, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupas, piridinilgrupas, fenilgrupas, -O-fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa var neobligāti būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virtnes, kura satur -CF<sub>3</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, metilgrupu, etilgrupu, izopropilgrupu, n-propilgrupu, n-butilgrupu, *terc*-butilgrupu un sec-butilgrupu;

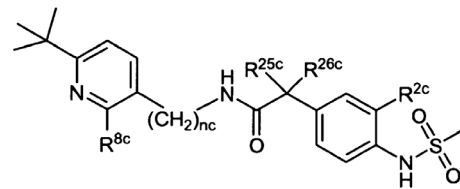
R<sup>25b</sup> un R<sup>26b</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi, ir ūdeņraža atoms; ir alkilgrupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur -CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, metilgrupu, etilgrupu un n-propilgrupu;

ar nosacījumu, ka R<sup>25b</sup> un R<sup>26b</sup> katrā gadījumā nav ūdeņraža atoms; vai

R<sup>25b</sup> un R<sup>26b</sup>, attiecīgi, kopā ar skābekļa atomu, kas tos saista kā gredzena loceklis, veido grupu, kas izvēlēta no virtnes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu un cikloheptilgrupu;

attiecīgi, neobligāti vienā no to tīro stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāļu vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

8. Savienojumi ar vispārīgo formulu (Ic1) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai



Ic1,

kur

nc ir 0, 1 vai 2;

R<sup>2c</sup> ir metilgrupa; -O-CH<sub>3</sub>; F; Cl; Br vai I;

R<sup>8c</sup> ir H; F; Cl; Br; I; -CN; -OH; -NH<sub>2</sub>; -NO<sub>2</sub>; -NHR<sup>11c</sup>; -NR<sup>12c</sup>R<sup>13c</sup>; -OR<sup>14c</sup>; -SR<sup>15c</sup>;

ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur metilgrupu, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CBr<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>Cl, -CCl<sub>2</sub>F, etilgrupu, -CF<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CBr<sub>3</sub>, -CHF-CF<sub>2</sub>Cl, -CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>Cl, -CFCl-CF<sub>2</sub>Cl, n-propilgrupu, -CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CF(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, izopropilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-butilgrupu, n-pentilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetil-but-1-ilgrupu, 3-metil-but-1-ilgrupu, 4-metil-pent-1-ilgrupu, (3,3)-dimetil-but-1-ilgrupu, 4-metil-pent-1-ilgrupu, 1-heksinilgrupu, propinilgrupu, etinilgrupu, butinilgrupu, pentinilgrupu, 2-metilpropen-1-ilgrupu, 3-metil-but-2-en-1-ilgrupu, 1-pentenilgrupu, 1-oktenilgrupu, 1-heptenilgrupu, 1-heksenilgrupu un (3,3)-dimetil-but-1-enilgrupu;

ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheksenilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, morfolinilgrupu, piperazinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu, azokanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas, attiecīgi, ir saistīta ar pamatstruktūru ar minēto grupu gredzena skābekļa atomu vai ar -(CH=CH)-, -C≡C- vai -C≡C-CH<sub>2</sub> grupu un, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no grupas, kura satur -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CN, -CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]-fenilgrupu, -N[C(=O)-CH<sub>3</sub>]-fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)-fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-fenilgrupu, okso (=O), tiokso (=S), -OH, F, Cl, Br, -CF<sub>3</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, izopropilgrupu, n-propilgrupu, n-butilgrupu, *terc*-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu un n-pentilgrupu;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur tetrazolilgrupu, (1,3)-benzodioxolilgrupu, (1,4)-benzodioxanilgrupu, indolilgrupu, (2,3)-dihidro-tieno[3,4-b][1,4]dioksinilgrupu, benzo[b]furanilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, oksazolilgrupu, tiazolilgrupu, imidazolilgrupu, pirimidinilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu un piridinilgrupu, kas, attiecīgi, var būt saistīta ar -(CH=CH)-, -C≡C-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CHO)<sub>2</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> grupu un/vai, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas izvēlēti no virtnes, kura satur F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -SF<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu un *terc*-butilgrupu;

R<sup>11c</sup>, R<sup>12c</sup>, R<sup>13c</sup>, R<sup>14c</sup> un R<sup>15c</sup>, neatkarīgi cits no cita, attiecīgi,

ir grupa, kas izvēlēta no virtnes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu, *terc*-butilgrupu, n-pentilgrupu, 3-pentilgrupu, n-heptilgrupu, 4-heptilgrupu, n-oktilgrupu, n-nonilgrupu, 5-nonilgrupu, (2,6)-dimetilhept-4-ilgrupu, 3-metil-butilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetilbutilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-fenilgrupu,



-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, etenilgrupu, propenilgrupu, 2-butenilgrupu, 3-butenilgrupu, 2-pentenilgrupu un 3-pentenilgrupu; ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur 2,3-dihidro-1H-indenilgrupu, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, oksetanilgrupu, ciklopentilgrupu un cikloheksilgrupu, kas, attiecīgi, var būt saistīta ar -CH<sub>2</sub>-O-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-O-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- vai -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-grupu un/vai, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> un -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>;

vai ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupu, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupu, benzilgrupu, fenetilgrupu, fenilgrupu, naftilgrupu, tiofenilgrupu, furanilgrupu, pirolilgrupu un piridinilgrupu, kas, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur -CF<sub>3</sub>, F, Cl, Br, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, sec-butilgrupu, izobutilgrupu un *tert*-butilgrupu;

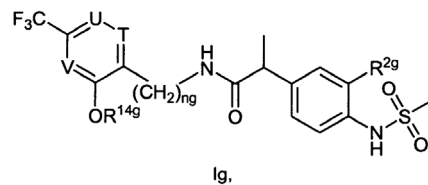
vai R<sup>12c</sup> un R<sup>13c</sup>, attiecīgi, kopā ar slāpekļa atomu, kas tos saista kā gredzena locekli, veido grupu, kas ir izvēlēta no virknes, kura satur 3-aza-biciklo[3.1.1]heptilgrupu, 6-aza-aza-spiro[2.5]oktilgrupu, 3-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 6-aza-biciklo[3.3.1]heptilgrupu, 8-aza-biciklo[3.2.1]oktilgrupu, 1-oksa-2,8-diaza-spiro[4.5]dec-2-enilgrupu, azokanilgrupu, izoindolilgrupu, indolilgrupu, (1,2,3,6)-tetrahidropiridinilgrupu, (4,5,6,7)-tetrahidroizoksazolo[5,4-c]piridinilgrupu, pirolidinilgrupu, piperidinilgrupu, (1,2,3,6)-tetrahidropiridinilgrupu, piperazinilgrupu, morfolinilgrupu, azepanilgrupu, diazepanilgrupu un tiomorfolinilgrupu, kas, attiecīgi, neobligāti var būt aizvietota ar 1 vai 2 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-oksetanilgrupu, -O-CH<sub>2</sub>-oksetanilgrupu, -CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, =CH<sub>2</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CN, -CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N-[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]-fenilgrupu, -N-[C(=O)-CH<sub>3</sub>]-fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-fenilgrupu, -N(CH<sub>3</sub>)-fenilgrupu, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-fenilgrupu, okso (=O), tiokso (=S), -OH, F, Cl, Br, -CF<sub>3</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, metilgrupu, etilgrupu, izopropilgrupu, n-propilgrupu, n-butilgrupu, *tert*-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, cikloheksilgrupu, ciklopentilgrupu, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupu, tiazolilgrupu, (1,2,5)-tiadiazolilgrupu, tiofenilgrupu, fenetilgrupu, piperidinilgrupu, pirolidinilgrupu, -O-fenilgrupu, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)F, -O-C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupu, piridinilgrupu, fenilgrupu un benzilgrupu, kur, attiecīgi, oksetanilgrupas, -N-[C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>]-fenilgrupas, -N-[C(=O)-CH<sub>3</sub>]-fenilgrupas, (4,5)-dihidroizoksazolilgrupas, tiazolilgrupas, (1,2,5)-tiadiazolilgrupas, tiofenilgrupas, fenetilgrupas, -NH-fenilgrupas, -N(CH<sub>3</sub>)-fenilgrupas, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-fenilgrupas, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-piridinilgrupas, piridinilgrupas, fenilgrupas, -O-fenilgrupas un benzilgrupas cikliskā daļa neobligāti var būt aizvietota ar 1, 2, 3, 4 vai 5 aizvietotājiem, kas neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes, kura satur -CF<sub>3</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, metilgrupu, etilgrupu, izopropilgrupu, n-propilgrupu, n-butilgrupu, *tert*-butilgrupu un *sec*-butilgrupu;

R<sup>25c</sup> un R<sup>26c</sup> neatkarīgi viens no otra, attiecīgi, ir ūdeņraža atoms; vai ir alkilgrupa, kas ir izvēlēta no virknes, kura satur -CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH, izopropilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, metilgrupu, etilgrupu un n-propilgrupu;

ar nosacījumu, ka R<sup>25c</sup> un R<sup>26c</sup> katrā gadījumā nav ūdeņraža atoms; vai R<sup>25c</sup> un R<sup>26c</sup>, attiecīgi, kopā ar skābekļa atomu, kas tos saista kā gredzena locekli, veido grupu, kas izvēlēta no virknes, kura satur ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu un cikloheptilgrupu;

attiecīgi, neobligāti vienā no to tīro stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāju vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

9. Savienojumi ar vispārīgo formulu (Ig) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai



kur

ng ir 0, 1 vai 2;

R<sup>29</sup> ir metilgrupa; -O-CH<sub>3</sub>; F; Cl; Br vai I;

R<sup>149</sup> ir grupa, kas izvēlēta no virknes, kura satur metilgrupu, etilgrupu, n-propilgrupu, izopropilgrupu, n-butilgrupu, *sec*-butilgrupu, izobutilgrupu, *tert*-butilgrupu, n-pentilgrupu, 3-pentilgrupu, n-heptilgrupu, 4-heptilgrupu, n-oktilgrupu, n-nonilgrupu, 5-nonilgrupu, (2,6)-dimetilhept-4-ilgrupu, 3-metil-butilgrupu, n-heksilgrupu, (3,3)-dimetilbutilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-fenilgrupu, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, etenilgrupu, propenilgrupu, 2-butenilgrupu, 3-butenilgrupu, 2-pentenilgrupu un 3-pentenilgrupu;

T ir CH, un U ir N, un V ir CH

vai

T ir N, un U ir CH, un V ir CH

vai

T ir N, un U ir N, un V ir CH

vai

T ir N, un U ir CH, un V ir N

vai

T ir CH, un U ir N, un V ir N;

attiecīgi, neobligāti vienā no to tīro stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāju vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.

10. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas izvēlēti no virknes:

1. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-metil-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
2. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
4. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-fluor-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
5. N-((2-hlor-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
6. N-((brom-2-bromo-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
7. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-jodo-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
8. N-((2-*tert*-butil-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
9. N-((2-ciān-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
10. (S)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
11. (R)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
12. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-morfolino-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
13. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(pirolidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
14. N-((2-(dimetilamino)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
15. N-((2-(dietilamino)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
16. N-((2-(dipropilamino)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
17. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-hidroksi-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
18. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-metoksi-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
19. N-((2-butoksi-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
20. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-izopropoksi-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
21. N-((2-ciklopentiloksi-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,



22. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-fenil-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
23. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(4-fluorfenil)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
24. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((6-(trifluormetil)-2,2'-bipiridin-3-il)metil)propānamīds,
25. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((6-(trifluormetil)-2,3'-bipiridin-3-il)metil)propānamīds,
26. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(pirimidin-2-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
27. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(tiazol-2-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
28. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(oksazol-2-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
29. N-((2-(1H-imidazol-2-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
51. N-((6-*terc*-butil-2-(piperidin-1-il)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
52. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((4-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
53. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((3-(piperidin-1-il)-5-(trifluormetil)piridin-2-il)metil)propānamīds,
54. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((4-(piperidin-1-il)-2-(trifluormetil)pirimidin-5-il)metil)propānamīds,
55. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((3-(piperidin-1-il)-5-(trifluormetil)pirazin-2-il)metil)propānamīds,
56. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((4-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridazin-3-il)metil)propānamīds,
57. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)propānamīds,
58. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-piperidin-1-il)-4-(trifluormetil)fenil)propānamīds,
59. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)etil)propānamīds,
64. 2-(3-hlor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
65. 2-(3-hlor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(pirolidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
67. 2-(3-brom-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(piperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
71. N-((6-(hlordifluormetil)-2-(piperidin-1-il)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
72. (S)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-morfolīn-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
73. N-((2-(4-benzilpiperazin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
74. 2-((3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-piperazin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
76. N-((2-(cikloheksiloksi)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
77. N-(3-hlor-5-(trifluormetil)piridin-2-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
78. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((3-(pirolidin-1-il)-5-(trifluormetil)piridin-2-il)metil)propānamīds,
79. N-((2-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
80. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
81. N-((2-(azepan-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
85. N-(2-dimetilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
87. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-imidazol-1-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
88. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-tiofen-2-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
89. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(4-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
90. N-(2-cikloheksilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
91. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-heksiloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
93. (S)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-heksiloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
94. (R)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-heksiloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
95. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-izobutoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
96. (S)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-izobutoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
97. (R)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-izobutoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
100. N-(2-ciklopropilmetoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
101. N-(2-ciklobutilmetoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
102. 2-(3-hlor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-pirolidin-1-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
103. 2-(3-bromo-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-pirolidin-1-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
104. N-(4-benzil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
106. N-(2-benziloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
107. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(3-metoksibenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
109. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(4-fenilpiperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
110. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-fenilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
111. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-propoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
112. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(4-fluorfenilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
113. N-[2-(4-hlorfenilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
115. N-(2-benzilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
116. N-(2-butilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
117. N-[2-(4-*terc*-butilgrupu-fenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
118. N-[2-(3-hlor-4-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
120. (S)-N-[2-(3-hlor-4-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
121. (R)-N-[2-(3-hlor-4-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
122. N-(2-butilsulfanil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
123. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(3-metilbutoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
124. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(2-metilciklopropilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
125. N-[2-(3,3-dimetilbutoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
126. N-(2-cikloheksilsulfanil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
127. 2-(4-(metilsulfonamīd-3-metilfenil)-N-(6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,
128. N-(2-azokan-1-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
130. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(4-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-tiopropionamīds,
131. N-[6'-(hlordifluormetil)-4-metil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
132. N-[2-azepan-1-il-6-(hlordifluormetil)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
134. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(4-metilpiperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
135. N-[2-(3,4-dimetilfenilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
136. N-[2-(5-hlor-2-metilfenilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
137. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,
138. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-(4-fluor-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,

139. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(6'-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
140. N-[2-butoksi-6-(hlordifluormetil)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
142. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pentil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
144. (S)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pentil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
145. (R)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pentil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
147. N-[2-(4-hlorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
148. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(3-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
149. N-[2-(3-hlorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
150. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(2-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
151. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-metoksifenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
156. N-(2-ciklobutoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
157. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-metilcikloheksiloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
158. etiķskābes-3'-[[2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-propionilamino]-metil]-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il esteris,  
159. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-metoksi-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
160. N-(4-butoksi-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
161. N-(2-ciklopentilmetoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
162. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-izopropoksi-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
163. N-(2-etoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
164. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(6"-trifluormetil-3,4,5,6,3',4',5',6'-oktahidro-2H,2'H-[1,4';1',2"]terpiridin-3"-ilmetil)propionamīds,  
165. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-pirolidin-1-il-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
166. N-[6-(hlordifluormetil)-2-ciklopentiloksi-3-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
167. N-[2-(butilmetilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
168. N-[6-(hlordifluormetil)-2-cikloheksiloksi-3-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
169. N-[2-benziloksi-6-(hlordifluormetil)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
170. N-[2-(4-*terc*-butilcikloheksiloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
171. N-[2-(4-etilcikloheksiloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
172. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-metilbenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
173. N-[2-(4-hlorbenzilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
175. N-[2-(4-fluorbenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
176. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-piridin-4-il-piperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
177. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(piridin-4-ilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
178. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-feniloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
179. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-[4-(4-fluorfenil)-piperazin-1-il]-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
180. N-[6-(hlordifluormetil)-2-heksiloksi-3-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
181. N-[6-(hlordifluormetil)-2-(piridin-3-ilmetoksi)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
182. N-[6-(hlordifluormetil)-2-(piridin-2-ilmetoksi)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
183. N-(2-dibutilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
184. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[6'-(4-fluorfenil)-4-metil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil]propionamīds,  
185. N-[2-azepan-1-il-6-(4-fluorfenil)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
186. N-[6-(hlordifluormetil)-2-dipropilaminopiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
187. N-[6'-(hlordifluormetil)-3,5-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
188. N-[2-(1,3-dihidroizoindol-2-il)-6-tetrahidrometilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
189. 3'-{[2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-propionilamino]-metil}-4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-ogļskābes etilesteris,  
190. N-(4,6'-bis-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
191. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-stiril-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propionamīds,  
192. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-fenil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
193. N-[2-[4-(3-hlorpiridin-2-il)-piperazin-1-il]-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
194. N-[2-[4-(3-hlorpiridin-2-il)-2-metilpiperazin-1-il]-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
195. N-(4,6'-bis-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)propionamīds,  
196. 2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
197. N-(4-etil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
198. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-fenoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
199. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-metoksimetil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
200. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[4-(4-fluorfenil)-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil]propionamīds,  
201. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-[4-(2-fluorfenil)-piperazin-1-il]-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
202. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(piridin-2-ilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
203. 2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)-N-[2-(4-fenilpiperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
204. N-(2-benziloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)propionamīds,  
205. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(metilfenilamino)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
207. N-[6-(hlordifluormetil)-2-(4-fenilpiperazin-1-il)-piridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
208. N-[6-(hlordifluormetil)-2-izobutoksipiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
210. N-(4,4-dimetil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
211. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(piridin-3-ilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
212. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[6-trifluormetil-2-[4-(3-trifluormetilpiridin-2-il)-piperazin-1-il]-piridin-3-ilmetil]propionamīds,  
213. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[6-trifluormetil-2-[4-(3-trifluormetilpiridin-2-il)-piperazin-1-il]-piridin-3-ilmetil]propionamīds,  
214. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
215. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
219. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-p-tolilpiperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
220. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-m-tolilpiperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
221. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-[4-(4-metoksifenil)-piperazin-1-il]-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
222. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[6-trifluormetil-2-[4-(4-trifluormetilfenil)-piperazin-1-il]-piridin-3-ilmetil]propionamīds,  
223. N-(2-benziloksi-4-hidroksimetil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,

225. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pentiloksi-6-trifluor-metilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
226. 2,2-dimetil-propionskābes-3'-[2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-propionilamino]-metil]-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-4-il-esteris,  
227. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-okso-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
228. N-(4-etoksi-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
233. N-(6-*terc*-butil-2-cikloheksiloksipiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
234. N-(6-*terc*-butil-2-ciklopentiloksipiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
235. N-(2-butoksi-6-*terc*-butilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
236. N-(6-*terc*-butil-2-heksiloksipiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
237. N-(2-benziloksi-6-*terc*-butilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
240. N-(6-*terc*-butil-2-pirolidin-1-il-piridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
241. N-(6'-*terc*-butil-4-metil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
242. N-[2-(4-etilbenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
243. N-[2-(4-butilbenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
244. N-[2-(4-*terc*-butilbenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
245. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(indan-2-iloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
250. N-[2-(3,4-dihlorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
251. N-[2-(3-*terc*-butil-1-oksa-2,8-diazaspiro[4,5]dek-2-en-8-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
252. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(3-fenil-1-oksa-2,8-diaza-spiro[4,5]dek-2-en-8-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
254. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(3-fluor-4-metoksifenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
256. N-(2-butoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)propionamīds,  
257. N-(2-heksiloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)propionamīds,  
258. N-[2-(4-hlorbenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
259. N-(4-dimetilaminometil-4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
260. N-[2-(4-cikloheksilpiperazin-1-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
261. N-(6-*terc*-butil-2-ciklopentiloksi-4-hidroksimetil-piridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
262. 2-(4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
263. N-[2-(3,3-dimetilbutil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
264. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(2-p-toliletil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
265. N-[2-(2,3-dihidrobenzo[1,4]dioksin-6-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
266. N-(2-benzo[1,3]dioksol-5-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
267. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-heksil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
268. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-metilpentil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
269. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-hidroksi-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
270. N-(2-cikloheksilmetoksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
271. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-metilcikloheksilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
272. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(3-metilsulfonamīdfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
273. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(2-metilpropenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
274. N-[2-(3,3-dimetilbut-1-enil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
275. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(1H-indol-6-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
276. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(1H-indol-5-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
277. N-[2-(4-hlor-3-fluorfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
278. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-fluor-3-metilfenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
279. N-[2-(2,2-dimetilciklopropilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
282. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(3-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
283. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
284. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-il)-etil]propionamīds,  
285. N-(4-ciān-4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
287. 2-(4-etānsulfonilamino-3-fluorfenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
288. 2-(4-(N,N-dimetilsulfamoilamino)-3-fluorfenil)-N-((2-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,  
289. 2-(4-metilsulfonamīd-3-metoksifenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
290. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-fenilamino-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
291. N-(2-cikloheksil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
292. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-fenil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
293. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)-tiopropionamīds,  
294. N-(2-cikloheksilsulfanil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
295. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
296. N-(2-azepan-1-il-6-*terc*-butilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
297. N-(6-*terc*-butil-2-dipropilaminopiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
298. N-(2-but-2-eniloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
299. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pent-2-eniloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
300. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pent-1-enil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
301. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-pent-1-enil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
302. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-(2-heksiloksi-4-metil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,  
303. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[2-(2-(4-fluorfenil)-etil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,  
304. N-(4-acetil-4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
307. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)-N-[4-(fenilpropionilamino)-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil]propionamīds,  
308. N-[2-(4-dimetilaminofenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
309. 2-(3-fluor-4-(propan-2-sulfonilamino)-fenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
310. 2-(3-fluor-4-(2,2,2-trifluoretānsulfonilamino)-fenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,  
311. N-[2-(2,6-dimetilmorfolin-4-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīdfenil)propionamīds,  
312. 2-(3-fluor-4-trifluormetilsulfonamīdfenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2]bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,

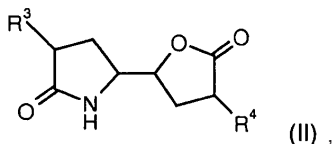


313. 2-(3-fluor-4-(sulfamiloamino)fenil)-N-((2-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propionamīds,
314. N-[2-(1,1-dioksio-1[6-tiomorfolin-4-il]-6-trifluormetilpiridin-3-il)metil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
315. N-(6'-difluormetil-4-metil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
316. N-(4,6'-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
317. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-(4-fenil-6'-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,
318. N-(4,4'-dimetil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
326. N-[2-(3,4-dimetoksifenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
327. 4-(3-[[2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil]-propionilamino]-metil]-6-trifluormetilpiridin-2-iloksietil)piperidin-1-oglskābes *terc*-butil-esteris,
328. N-(6-*terc*-butil-2-pentiloksipiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
329. N-(6-*terc*-butil-2-(3-metilbutoksi)-piridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
330. N-(4-dimetilamino-4-fenil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
331. N-(2-dipropilamino-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)propionamīds,
332. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[4-(4-fluorfenil)-6'-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil]propionamīds,
334. N-(2-cikloheks-1-enil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
335. N-[2-(1-etilpropoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
336. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(1-propilbutoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
337. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(1-izobutil-3-metilbutoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
338. N-[2-(4,4-dimetilcikloheksiloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
339. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[6-trifluormetil-2-(4-trifluormetilcikloheksiloksi)-piridin-3-ilmetil]propionamīds,
340. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[6-trifluormetil-2-(4-trifluormetilcikloheksiloksi)-piridin-3-ilmetil]propionamīds,
341. 4-(3-[[2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil]-propionilamino]-metil]-6-trifluormetilpiridin-2-iloksi)-piperidin-1-oglskābes *terc*-butil-esteris,
342. 4-[[3-[[2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil]-propionilamino]-metil]-6-trifluormetilpiridin-2-ilamino]metil]piperidin-1-oglskābes *terc*-butil-esteris,
343. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(piperidin-4-ilmetoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
344. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(piperidin-4-iloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
345. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-(2-p-toliloksi-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
346. N-[2-(2-cikloheksilvinil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
347. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-(4-metil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)butiramīds,
348. N-[2-(3,5-dimetoksifenil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
349. N-(2-ciklopentiloksi-4-metil-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
351. etil 5-((2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propanamīd)metil)-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(trifluormetil)nikotināts,
352. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(nonan-5-iloksi)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
353. N-(6-*terc*-butil-2-izobutoksipiridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
354. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(feniletinil)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
355. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(3-metoksipropoksi)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
356. N-((2-(4-benzilpiperidin-1-il)-4-metil-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
357. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-(4-metilen-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,
358. N-[2-(6-azaspiro[2.5]oct-6-il)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
359. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(3-metilbut-2-eniloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
360. N-[2-(3-cikloheksilpropil)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
361. N-[2-(3-etoksipropoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
362. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-[2-(2-fenoksietoksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]propionamīds,
363. N-[2-(3,5-dimetoksibenziloksi)-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil]-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
364. 2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)-N-(4-hidroksimetil-6'-trifluormetil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)propionamīds,
365. N-(6'-*terc*-butil-4-fenil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-3'-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
366. N-(6-*terc*-butil-2-[4-(4-fluorfenil)-piperazin-1-il]-piridin-3-ilmetil)-2-(3-fluor-4-metilsulfonamīd)fenil)propionamīds,
367. 2-(4-metilsulfonamīd-3-metilfenil)-N-(2-pirolidin-1-il-6-trifluormetilpiridin-3-ilmetil)propionamīds,
368. N-((2-(1H-indol-4-il)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
369. N-((6-*terc*-butil-2-propoksipiridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
370. N-((6-*terc*-butil-2-(3-metoksipropoksi)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
371. N-((6-*terc*-butil-2-(4-(dimetilamino)-4-fenilpiperidin-1-il)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
372. N-((6-*terc*-butilgrupu-2-metoksipiridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
373. N-((6-*terc*-butil-2-etoksipiridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
374. N-((6-*terc*-butil-2-izopropoksipiridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
375. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(pentiloksi)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
376. 2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)-N-((2-(heksiloksi)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)propānamīds,
377. N-((2-(3,5-dimetilcikloheksiloksi)-6-(trifluormetil)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
378. N-((6-*terc*-butil-2-(2-etoksietoksi)piridin-3-il)metil)-2-(3-fluor-4-(metilsulfonamīd)fenil)propānamīds,
- attiecīgi, neobligāti vienā no to tīro stereoizomēru formām, it īpaši enantiomēru vai diastereomēru, to racemātu vai stereoizomēru maisījuma formā, it īpaši enantiomēru un/vai diastereomēru, jebkurā vēlamajā maisījuma attiecībā, vai, attiecīgi, atbilstošu sāļu vai, attiecīgi, atbilstošu solvātu formā.
11. Savienojumi saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgi ar to, ka, FLIPR analizē ar CHO-K21 šūnām, kas ir transficētas ar cilvēka gēnu VR1, koncentrācijā, kas ir mazāka par 2000 nM, vēlams mazāka par 1000 nM, it īpaši vēlams mazāka par 300 nM, vēl labāk vēlams mazāka par 100 nM, vēl labāk vēlams mazāka par 75 nM, vēl labāk vēlams mazāka par 50 nM, bet vislabāk vēlams mazāka par 10 nM, izraisa 50 % kapsaicīna, kura koncentrācija ir 100 nM, aizstāšanu.
12. Medikaments, kas satur vismaz vienu savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai un neobligāti vienu vai vairākas fizioloģiski pieņemamas palīgvielas.
13. Vismaz viena savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanā vienas vai vairāku slimību, kas izvēlētas no šādas virknes: sāpes, vēlams sāpes, kas izvēlētas no akūtām sāpēm, hroniskām sāpēm, neiropatiskām sāpēm un iekšējo orgānu sāpēm; locītavu sāpes; hiperalgēzija; alodīnija; kaulzāģija un migrēna, ārstēšanai un/vai profilaksei.
14. Vismaz viena savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts vienas vai vairāku slimību, kas izvēlētas no šādas virknes: depresija; neiropatija; nervu bojājumi; neirodeģeneratīvās slimības, vēlams, kas izvēlētas no šādas virknes: multiplā skleroze, Alcheimera slimība, Pārkinsona slimība un Hantingtona horeja; kognitīvā disfunkcija, vēlams kognitīvā nepietiekamība, it īpaši, vēlams atmiņas traucējumi; un epilepsija, ārstēšanai un/vai profilaksei.



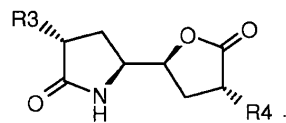
15. Vismaz viena savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts vienas vai vairāku slimību, kas izvēlētas no šādas virknes: elpvadu slimības, vēlams, kas izvēlētas no šādas virknes: astma, bronhīts un plaušu iekaisums; klepus; urīna nesaturēšana; pārmērīga žultspūšļa aktivitāte (OAB); kuņģa un zarnu trakta slimības un/vai bojājumi; divpadsmitpirkstu zarnas čūla; kuņģa čūla; kairinātas zarnas sindroms; insults; acu iekaisumi; ādas iekaisumi; neirotikas ādas slimības; alerģiskas ādas slimības; psoriāze; ādas plankumainība; herpes simplex; iekaisumi, vēlams zarnu, acu, urīnpūšļa, deguna ādas vai glotādas iekaisumi; diareja; nieze; osteoporozē; artrīts; osteoartrīts; reimatisma slimības; pārtikas uzņemšanas traucējumi, vēlams, kas izvēlēti no šādas virknes: bulīmija, kaheksija, anoreksija un aptaukošanās; medikamentu atkarība; medikamentu pārmērīga lietošana; ar medikamentu atkarību saistīti autisma simptomi; pieraduma pie zālēm attīstība, vēlams pie dabīgajiem vai sintētiskajiem opioīdiem; narkotiku atkarība; narkotiku pārmērīga lietošana; ar narkotiku atkarību saistīti autisma simptomi; alkohola atkarība; alkohola pārmērīga lietošana un ar alkohola atkarību saistīti autisma simptomi, ārstēšanai un/vai profilaksei; diurēzei; nātrija sāļu pārmērīgas izvadīšanas novēršanai; sirds un asinsvadu sistēmas darbības regulēšanai; modrības paaugstināšanai; brūču un/vai apdegumu ārstēšanai; atdalītu nervu ārstēšanai; libido paaugstināšanai; kustību aparāta darbību modulēšanai; fobiju ārstēšanai; vietējai anestēzijas un/vai zāļu nevēlamu blakusparādību novēršanai, vēlams, kas izvēlētas no šādas virknes: hipertermija, augsts asinsspiediens un bronhu sašaurināšanās, ko izraisisjusi vaniloīdu receptoru 1 (VR1/TRPV1 receptors) agonistu ievadīšana, vēlams, kas izvēlēti no šādas virknes: kapsaicīns, reziniferatoksīns, olvanils, arvanils, SDZ-249665, SDZ-249482, nuvanils un kapsavanils, ārstēšanai un/vai profilaksei.

- (51) **C07D 405/04**<sup>(200601)</sup> (11) **1948643**  
**C07D 207/26**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 307/32**<sup>(200601)</sup>  
**C07F 1/02**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06828821.6 (22) 16.10.2006  
(43) 30.07.2008  
(45) 05.06.2013  
(31) 0521083 (32) 17.10.2005 (33) GB  
(86) PCT/EP2006/009970 16.10.2006  
(87) WO2007/045420 26.04.2007  
(73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH  
(72) SEDELMEIER, Gottfried, DE  
GRIMLER, Dominique, FR  
ACEMOGLU, Murat, CH  
(74) Dietel-Manske, Anja, Novartis Pharma AG, Patent Department, 4002 Basel, CH  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
(54) **3-ALKIL-5-(4-ALKIL-5-OKSO-TETRAHIDROFURAN-2-IL)PIROLIDIN-2-ONA ATVASINĀJUMI KĀ STARPNIKI RENĪNA INHIBITORU SINTĒZĒ**  
**3-ALKYL-5-(4-ALKYL-5-OXO-TETRAHYDROFURAN-2-YL)PYRROLIDIN-2-ONE DERIVATIVES AS INTERMEDIATES IN THE SYNTHESIS OF RENIN INHIBITORS**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (II)

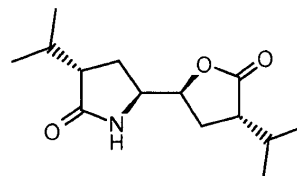


kur  
R<sup>3</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa; un  
R<sup>4</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa, C<sub>2-7</sub>alkenilgrupa, C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, fenil-C<sub>1,4</sub>alkilgrupa vai naftil-C<sub>1,4</sub>alkilgrupa, katra neaizvietota vai vienaizvietota, divaizvietota vai trīsaizvietota ar C<sub>1,4</sub>alkilgrupu, O-C<sub>1,4</sub>alkilgrupu, OH, C<sub>1,4</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1,4</sub>alkilaminogrupu, halogēna atomu un/vai trifluometilgrupu;  
vai tā sāls.

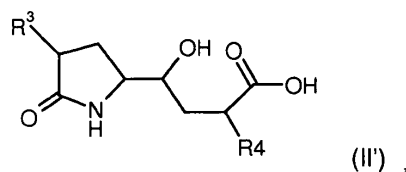
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> neatkarīgi ir sazarota C<sub>3-6</sub>alkilgrupa.  
3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju ar šādu stereoķīmiju:



4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām ar formulu:

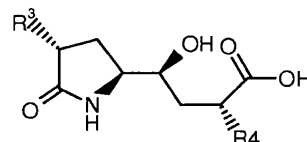


5. Savienojums ar formulu (II')

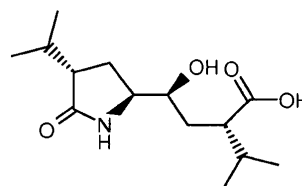


kur  
R<sup>3</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa; un  
R<sup>4</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa, C<sub>2-7</sub>alkenilgrupa, C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, fenil-C<sub>1,4</sub>alkilgrupa, naftil-C<sub>1,4</sub>alkilgrupa, katra neaizvietota vai vienaizvietota, divaizvietota vai trīsaizvietota ar C<sub>1,4</sub>alkilgrupu, O-C<sub>1,4</sub>alkilgrupu, OH, C<sub>1,4</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1,4</sub>alkilaminogrupu, halogēna atomu un/vai trifluometilgrupu;  
vai tā sāls.

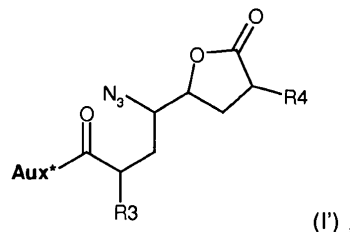
6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> neatkarīgi ir sazarota C<sub>3-6</sub>alkilgrupa.  
7. Savienojums saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju ar šādu stereoķīmiju:



8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 7. pretenzijai ar formulu



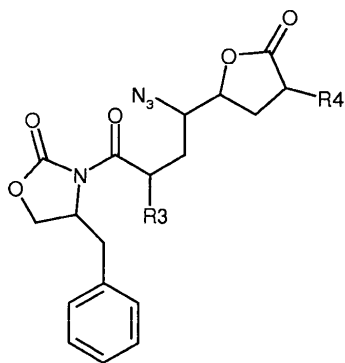
9. Metode savienojuma ar formulu (II) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai iegūšanai, kur minētā metode ietver savienojuma ar formulu (I')



kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), un Aux\* ir palīgviela, kas spēj veidot esterī vai amīdu ar karbonilgrupas

funkcionalitāti, vai tā sāls hidrogenizāciju, lai pārveidotu azīdgrupu amīnā un panāktu laktāmgredzēna aizvēršanos.

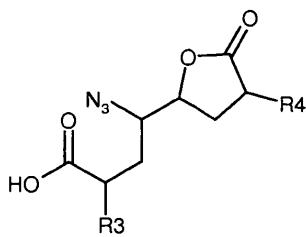
10. Metode savienojuma ar formulu (II) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai iegūšanai, kur minētā metode ietver savienojuma ar formulu (I)



(I)

kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), vai tā sāls hidrogenizāciju, lai pārveidotu azīdgrupu amīnā un panāktu laktāmgredzēna aizvēršanos.

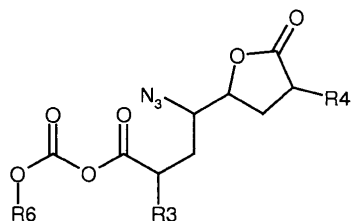
11. Metode savienojuma ar formulu (II) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai iegūšanai, kur minētā metode ietver savienojuma ar formulu (III)



(III)

kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), vai tā sāls konversiju

(a) anhidrīdā ar formulu (IV)

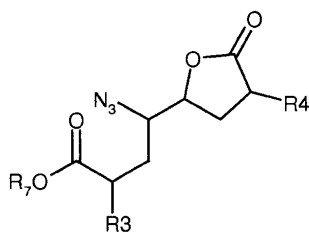


(IV)

kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), un R<sup>6</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, vai tā sāls; lai aktivētu skābes fragmentu, kam seko hidrogenizācija, lai pārveidotu azīdgrupu amīnā un panāktu laktāmgredzēna aizvēršanos;

vai

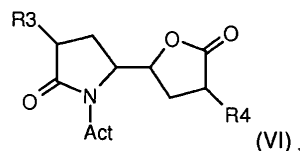
(b) esterī ar formulu (V)



(V)

kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), un R<sup>7</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, vai tā sāls; kam seko hidrogenizācija, lai pārveidotu azīdgrupu amīnā un panāktu laktāmgredzēna aizvēršanos.

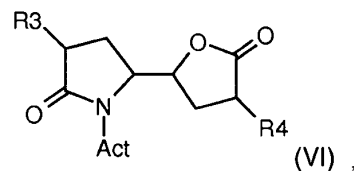
12. Metode savienojuma ar formulu (VI)



(VI)

kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), un Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši karbamāta, vai tā sāls, iegūšanai; kas ietver aktivējošās grupas ievadīšanu savienojuma ar formulu (II), kā minēts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai, vai tā sāls, slāpekļi.

13. Savienojums ar formulu (VI)



(VI)

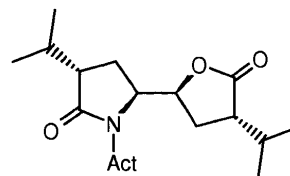
kur

R<sup>3</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa;

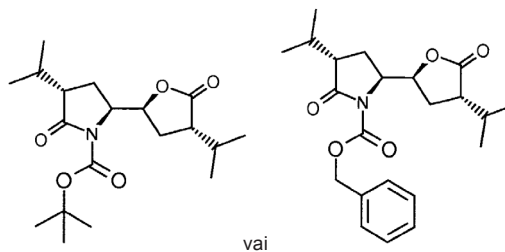
R<sup>4</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa, C<sub>2-7</sub>alkenilgrupa, C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, fenil-C<sub>1,4</sub>alkilgrupa vai naftil-C<sub>1,4</sub>alkilgrupa, katra neaizvietota vai vienaizvietota, divaizvietota vai trīsaizvietota ar C<sub>1,4</sub>alkilgrupu, O-C<sub>1,4</sub>alkilgrupu, OH, C<sub>1,4</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1,4</sub>alkilaminogrupu, halogēna atomu un/vai trifluormetilgrupu; un

Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši karbamāta; vai tā sāls.

14. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju ar formulu

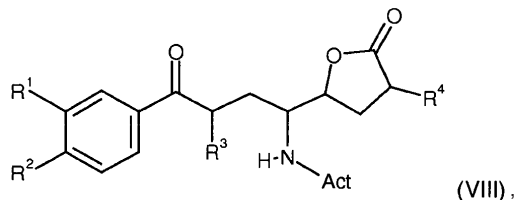


15. Savienojums saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju ar formulu



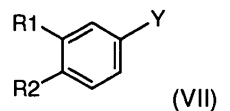
vai

16. Metode savienojuma ar formulu (VIII)



(VIII)

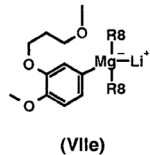
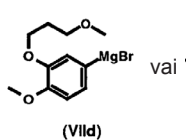
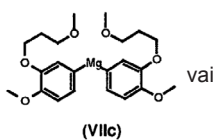
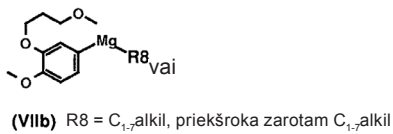
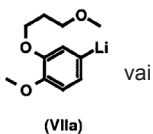
kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II); Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta; R<sup>1</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupa vai C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; un R<sup>2</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai C<sub>1,4</sub>alkoksigrupa, vai tā sāls iegūšanai, kas ietver posmu, kurā atveras laktāmgredzēns N-aktivētā laktāmlaktonā ar formulu (VI) vai tā sāli, kā definēts jebkurā no 13. līdz 15. pretenzijai, ar savienojumu ar formulu (VII)



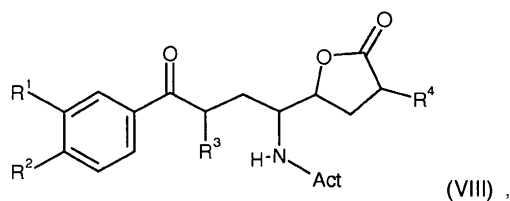
(VII)

kur Y ir metālu saturoša grupa, tāda kā -Li, -MgX, -magnezāts, arilmagnija grupējums, alkilmagnija grupējums, -MnX, (alkil)<sub>3</sub>MnLi vai -CeX<sub>2</sub>, kur X ir halogēna atoms, tāds kā Cl, I vai Br, labāk Br; un R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII).

17. Metode saskaņā ar 16. pretenziju, kur N-aktivētais laktāmlaktons ar formulu (VI) reaģē ar savienojumu ar šādu formulu:



18. Savienojums ar formulu (VIII)

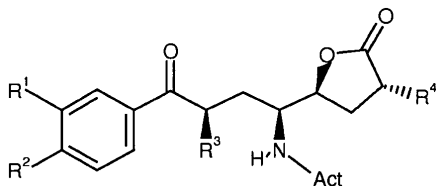


kur

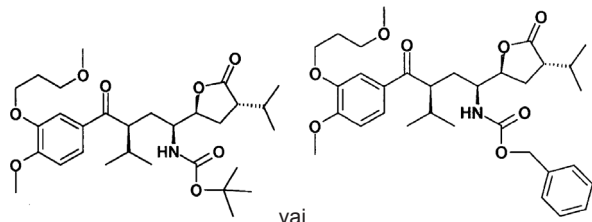
R<sup>3</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa;  
R<sup>4</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa, C<sub>2-7</sub>alkenilgrupa, C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, fenil-C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai naftil-C<sub>1-4</sub>alkilgrupa, katra neaizvietota vai vienaizvietota, divaizvietota vai trīsaizvietota ar C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, O-C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, OH, C<sub>4</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1-4</sub>alkilaminogrupu, halogēna atomu un/vai trifluormetilgrupu;

R<sup>1</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupa vai C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; R<sup>2</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-4</sub>alkoksigrupa; un Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta; vai tā sāls.

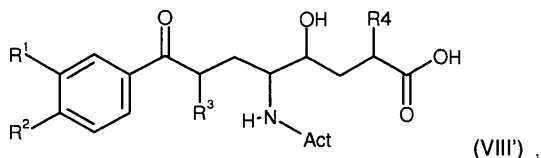
19. Savienojums saskaņā ar 18. pretenziju ar formulu



20. Savienojums saskaņā ar 18. vai 19. pretenziju ar formulu



21. Savienojums ar formulu (VIII')



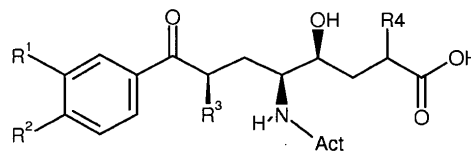
kur

R<sup>3</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa;  
R<sup>4</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa, C<sub>2-7</sub>alkenilgrupa, C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, fenil-C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai naftil-C<sub>1-4</sub>alkilgrupa, katra neaizvietota vai vienaizvietota, divaizvietota vai trīsaizvietota ar C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, O-C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, OH, C<sub>1-4</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1-4</sub>alkilaminogrupu, halogēna atomu un/vai ar trifluormetilgrupu;  
R<sup>1</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupa vai C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; R<sup>2</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-4</sub>alkoksigrupa; un Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta; vai tā sāls.

22. Savienojums saskaņā ar 21. pretenziju sāls veidā.

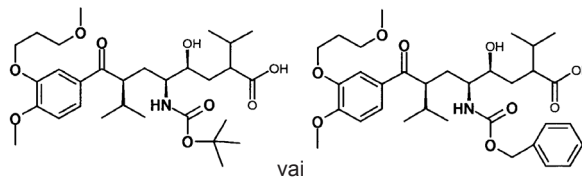
23. Savienojums saskaņā ar 21. vai 22. pretenziju Li, Na, K, Mg, Ca, primāra, sekundāra vai terciāra amīna sāls veidā.

24. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 21. līdz 23. pretenzijai ar formulu



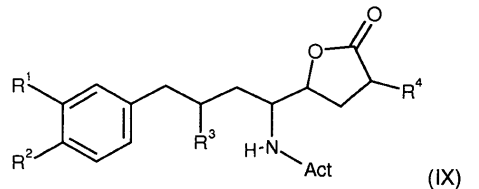
vai, labāk, tā sāls.

25. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 21. līdz 24. pretenzijai ar formulu:



vai, labāk, tā sāls.

26. Metode savienojuma ar formulu (IX)

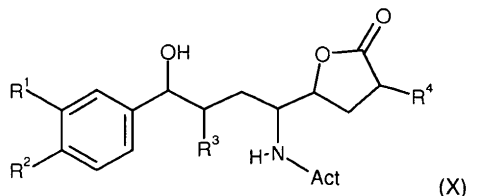


kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls iegūšanai,

(a) kas ietver savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar jebkuru no 18. līdz 20. pretenzijai vai savienojuma ar formulu (VIII') saskaņā ar jebkuru no 21. līdz 25. pretenzijai benzilkarbonilgrupas reducēšanu līdz metilēngrupai;

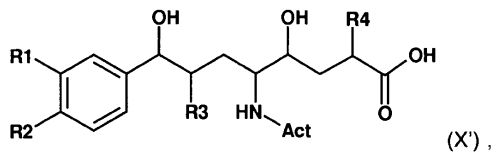
vai

(b) kas ietver metodi savienojuma ar formulu (X)



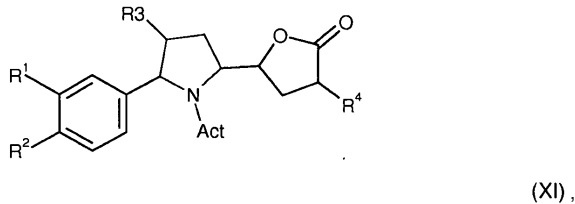
kas definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktivējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls iegūšanai, kur minētā metode ietver savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar jebkuru no 18. līdz 20. pretenzijai benzilkarbonilgrupas reducēšanu līdz hidroksilgrupai, un pēc tam savienojuma ar formulu (X) hidrogenizāciju, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IX); vai

(c) kas ietver metodi savienojuma ar formulu (X')

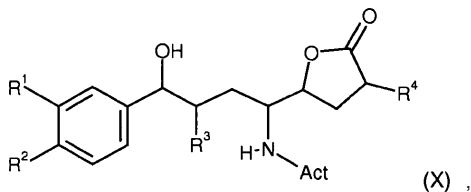


kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls iegūšanai, kur minētā metode ietver savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar jebkuru no 21. līdz 25. pretenzijai benzilkarbonilgrupas reducēšanu līdz hidroksilgrupai, un pēc tam savienojuma ar formulu (X') hidroģenizāciju, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IX); vai

(d) kas ietver metodi savienojuma ar formulu (XI)

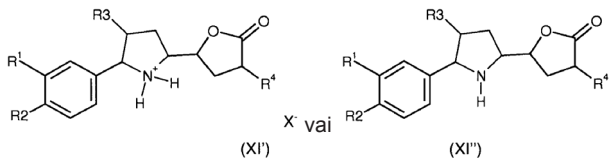


kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls iegūšanai, kur minētā metode ietver savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar jebkuru no 18. līdz 20. pretenzijai benzilkarbonilgrupas reducēšanu līdz hidroksilgrupai, pēc tam benzilalkohola un savienojuma ar formulu (X) aminogrupu ciklizāciju



kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls, lai iegūtu pīrolidīngrupu, un pēc tam savienojuma ar formulu (XI) pīrolidīngrupas hidroģenizāciju vai reducēšanu, atverot gredzenu un iegūstot metilēngrupu 8. pozīcijā, lai veidotu savienojumu ar formulu (IX),

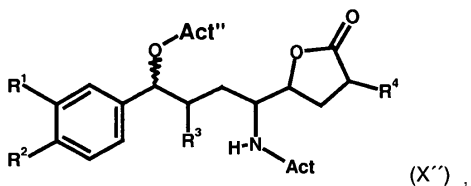
kur (d) metodē savienojumu ar formulu (XI) neobligāti pārveido pīrolidīna sāļi ar formulu (XI') vai pīrolidīna brīvā bāzē ar formulu (XI'')



kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un X- ir anjons, tāds kā halogēnīda, trifluoracetāta, sulfāta, nitrāta, oksalāta, sulfonāta, triflāta, fosfonāta vai fosfāta anjons;

vai

(e) kas ietver savienojuma ar formulu (X'')



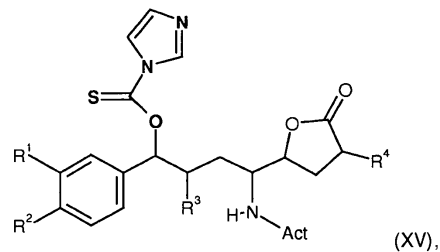
kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), Act ir aktīvējoša

grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, un Act'' ir elektronu atņemoša grupa, vai tā sāls iegūšanu, savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar jebkuru no 18. līdz 20. pretenzijai benzilkarbonilgrupu reducējot līdz hidroksilgrupai, tad savienojuma ar formulu (IX), kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, benzilalkoholu pārvēršot aktivētā alkohola fragmentā,

pēc tam savienojuma ar formulu (X''), kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, un Act'' ir elektronu atņemoša grupa, vai tā sāls, aktivēto alkohola fragmentu hidroģenizē vai reducē, lai iegūtu metilēngrupu 8. pozīcijā, kur (e) metodē Act'' neobligāti ir -(C=O)-R<sup>9</sup>, kur R<sup>9</sup> var būt aizvietota alkilgrupa, alkil-oksi-R<sup>10</sup> grupa, aizvietota aralkilgrupa, aizvietota arilgrupa, aizvietota vai neaizvietota O-alkilgrupa, aizvietota O-arilgrupa, NH-R<sup>10</sup>, kur R<sup>10</sup> var būt aizvietota alkilgrupa, aizvietota arilgrupa, aizvietota aralkilgrupa, tāda kā aizvietota benzilgrupa, benzoilgrupa, aizvietota sulfonilgrupa, kur aizvietotājs katrā gadījumā ir viena vai vairākas elektronu atņemošas grupas, tādas kā F vai CF<sub>3</sub>; vai

(f) kas ietver savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar jebkuru no 18. līdz 20. pretenzijai benzilkarbonilgrupas reducēšanu līdz hidroksilgrupai, tad savienojumu ar formulu (X), kur R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, pārvērš tiokarbonilatvasinājumā, kuru pēc tam pakļauj uz radikāļiem bāzētai reducēšanai, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IX),

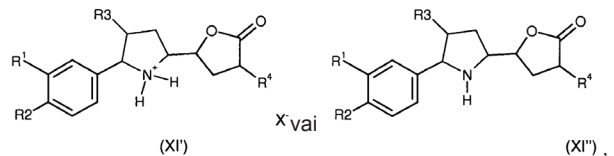
kur tiokarbonilatvasinājumu izvēlas no rindas, kas sastāv no tionokarbamātiem, tādiem kā imidazolilatvasinājumiem, tiokarbonilatvasinājumiem, tādiem kā ksantāti, un tionokarbonātiem, vai kur tiokarbonilatvasinājums neobligāti ir tionokarbamāts ar formulu (XV)



kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar (II); Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, R<sup>1</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupa vai C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; R<sup>2</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-4</sub>alkoksigrupa, vai tā sāls; vai

kur tiokarbonilatvasinājums neobligāti reaģē ar Bu<sub>3</sub>SnH vai tris(trimetilsilil)-silānu.

27. Savienojums ar formulu (XI') vai savienojums ar formulu (XI''):



kur

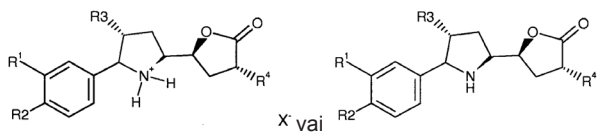
R<sup>3</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa;

R<sup>4</sup> ir C<sub>1-7</sub>alkilgrupa, C<sub>2-7</sub>alkenilgrupa, C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa, fenil-C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai naftil-C<sub>1-4</sub>alkilgrupa, katra neaizvietota vai vienaizvietota, divaizvietota vai trīsaizvietota ar C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, O-C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, OH, C<sub>1-4</sub>alkilaminogrupu, di-C<sub>1-4</sub>alkilaminogrupu, halogēna atomu un/vai trifluormetilgrupu;

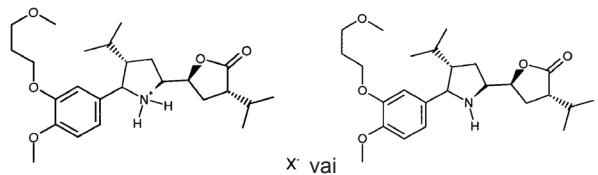
R<sup>1</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupa vai C<sub>1-6</sub>alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; R<sup>2</sup> ir halogēna atoms, hidroksilgrupa, C<sub>1-4</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-4</sub>alkoksigrupa; un X- ir anjons, tāds kā halogēnīda, trifluoracetāta, sulfāta, nitrāta, oksalāta, sulfonāta, triflāta, fosfonāta vai fosfāta anjons.

28. Savienojums saskaņā ar 27. pretenziju ar formulu

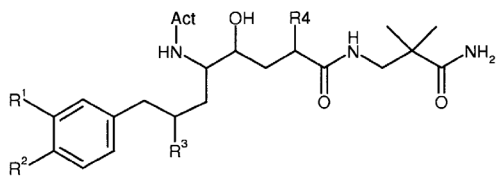




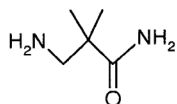
29. Savienojums saskaņā ar 27. vai 28. pretenziju ar formulu



30. Metode savienojuma ar formulu (XII)

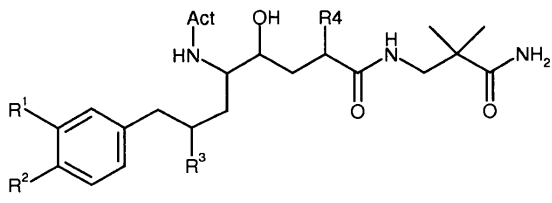


kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (IX) iegūšanu ar metodi saskaņā ar 26. pretenziju; pēc tam savienojums ar formulu (IX) reaģē ar amīnu ar formulu (XIII),

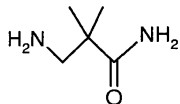


(kur amīdgrupas slāpekli arī var aizsargāt, ja vēlas, un aizsarg-grupa tad tiek izņemta no attiecīgā aizsargātā savienojuma ar formulu (XII)), vai tā sāli.

31. Metode savienojuma ar formulu (XII)

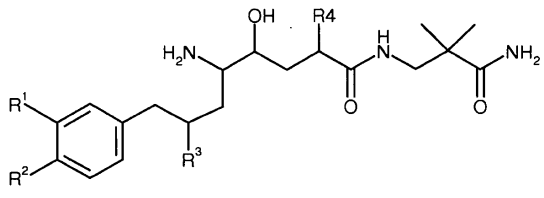


kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), un Act ir aktīvējoša grupa, ko izvēlas no aminogrupas aizsarggrupas, jo īpaši no karbamāta, vai tā sāls iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (IX) iegūšanu ar metodi saskaņā ar 26. pretenziju; savienojuma (IX) pārvēršanu savienojumā ar formulu (IX'), un tad savienojuma ar formulu (IX') reakciju ar amīnu ar formulu (XIII),



(kur amīdgrupas slāpekli arī var aizsargāt, ja vēlas, un aizsarg-grupa tad tiek izņemta no attiecīgā aizsargātā savienojuma ar formulu (XII)), vai tā sāli.

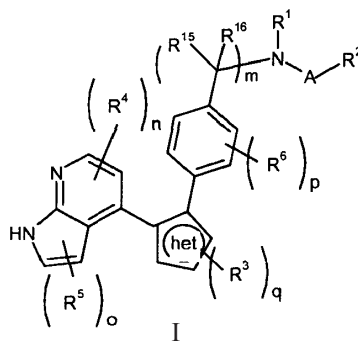
32. Metode savienojuma ar formulu (XIV)



kur R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (II), R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> ir, kā definēts savienojumam ar formulu (VIII), vai tā sāls iegūšanai, kas ietver vienu vai vairākus šādus posmus, vai nu atsevišķi, vai jebkurā to kombinācijā:

- savienojuma ar formulu (II) saskaņā ar vienu no 9., 10., 11. pretenzijas vai tā sāls iegūšanu,
  - savienojuma ar formulu (VI) saskaņā ar 12. pretenziju vai tā sāls iegūšanu,
  - savienojuma ar formulu (VIII) saskaņā ar 16. pretenziju vai tā sāls iegūšanu, un
  - savienojuma ar formulu (IX) saskaņā ar 26. pretenziju vai tā sāls iegūšanu.
33. Metode saskaņā ar 32. pretenziju, kur savienojums ar formulu (XIV) ir aliskirēns.

- (51) **A61K 31/437**<sup>(200601)</sup> (11) **1962830**  
**A61K 31/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/335**<sup>(200601)</sup>
- (21) 06846678.8 (22) 19.12.2006  
(43) 03.09.2008  
(45) 27.03.2013  
(31) 753383 P (32) 23.12.2005 (33) US  
(86) PCT/US2006/062289 19.12.2006  
(87) WO2007/076348 05.07.2007  
(73) GlaxoSmithKline LLC, One Franklin Plaza, 200 North 16th Street, Philadelphia, PA 19102, US  
(72) ADAMS, Jerry, Leroy, US  
ADAMS, Nicholas, D., US  
AXTEN, Jeffrey, Michael, US  
CHAUDHARI, Amita, M., US  
DHANAK, Dashyant, US  
HAMAJIMA, Toshihiro, JP  
NEWLANDER, Kenneth, Allen, US  
PARRISH, Cynthia, A., US  
SARPONG, Martha, A., US  
SILVA, Domingos, J., US  
TANG, Jun, US  
(74) Gladwin, Amanda Rachel, GlaxoSmithKline, Corporate Intellectual Property, CN925.1, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **AURORA KINĀZES AZAINDOLA INHIBITORI**  
**AZAINDOLE INHIBITORS OF AURORA KINASES**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kur:



ir 5 locekļu heteroaromātisks gredzena fragments;  
A ir >C=Y vai >S(O)<sub>x</sub>, kur Y ir O, S vai N-R<sup>1</sup>; kur x ir 1 vai 2;  
R<sup>1</sup> neatkarīgi ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa vai ciklopropilgrupa;  
R<sup>2</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, amino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksimetilgrupa, hidroksigrupa,

$-(CH_2)_y-Ar-(R^7)_z$  vai  $NR^8R^9$ , ar nosacījumu, ka, ja A ir S(O)<sub>x</sub>, R<sup>2</sup> nav H; kur y ir 0, 1 vai 2; un z ir vesels skaitlis, kas nav negatīvs un nav lielāks par pozīciju skaitu pieejams Ar aizstāšanai;

Ar ir fenilgrupa vai heteroarilgrupa;

R<sup>3</sup> neatkarīgi ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, amino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  $-(CH_2)_w-R^{10}$ ; kur w ir 1 vai 2;

R<sup>4</sup> neatkarīgi ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēna atoms, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa vai Ar-(R<sup>7</sup>)<sub>z</sub>;

R<sup>5</sup> neatkarīgi ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēna atoms, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, Ar-(R<sup>7</sup>)<sub>z</sub>,  $-(CH_2)_aNR^{13}R^{14}$ ,  $-Ar-(CH_2)_bNR^{13}R^{14}$ ,  $-A'-NR^{11}-(CH_2)_c-A''$ ,  $-CH_2CH_2C(O)-A'''$  vai  $-Ar^1-C(O)(CH_2)_aNR^{13}R^{14}$ ; kur A' ir C(O) vai CH<sub>2</sub>; A'' ir H, NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)tioalkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa,  $-SO_2CH_3$  vai -OH; A''' ir -OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa vai  $-NR^{13}R^{14}$ ; un Ar<sup>1</sup> ir 5 vai 6 locekļu heterocikloalkilgredzens; kur a neatkarīgi ir 0, 1 vai 2; b ir 1, 2 vai 3, ar nosacījumu, ka, ja b ir 1, A'' ir H; un c ir 0 vai 1;

R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> katrs neatkarīgi ir halogēna atoms, ciāngrupa, nitrogrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, COOH, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilkarbonilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilkarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, aminogrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilaminogrupa, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilaminogrupa, amino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, OH, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, heteroarilgrupa vai fenilgrupa;

R<sup>8</sup> ir H vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa;

R<sup>9</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa,  $-(CH_2)_y-Ar-(R^7)_z$ ; vai R<sup>8</sup> un R<sup>9</sup> kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido 5- vai 6-locekļu heterocikloalkilgredzenu, kas neobligāti ir aizvietots ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu vai OH;

R<sup>10</sup> ir heterocikloalkilgrupa, Ar-(R<sup>7</sup>)<sub>z</sub>, COOH vai C(O)-NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>;

R<sup>11</sup> ir H vai (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa;

R<sup>12</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa vai hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa; vai R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido 5- vai 6-locekļu heterocikloalkilgredzenu, kas neobligāti ir aizvietots ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu vai hidroksigrupu;

R<sup>13</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa vai hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa;

R<sup>14</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilaminogrupa vai SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; vai R<sup>13</sup> un R<sup>14</sup> kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido 5- vai 6-locekļu heterocikloalkilgredzenu, kas neobligāti ir aizvietots ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu vai OH; un R<sup>15</sup> un R<sup>16</sup> katrs neatkarīgi ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa vai halogēna atoms, vai R<sup>15</sup> un R<sup>16</sup> kopā ar oglekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido ciklopropilgrupu, C=O, C=S vai C=NR<sup>1</sup>;

m ir 0 vai 1;

n, o un q katrs neatkarīgi ir 0, 1 vai 2; un

p ir 0, 1, 2, 3 vai 4.

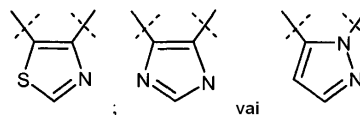
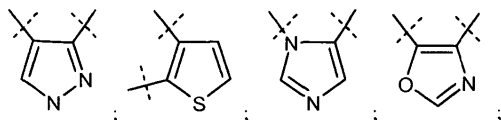
2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur m ir 0.

3. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur n ir 0; p ir 0, 1 vai 2, un katrs R<sup>6</sup> neatkarīgi ir halogēna atoms, ciāngrupa, nitrogrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilkarbonilgrupa, aminogrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilaminogrupa, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilaminogrupa, amino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, OH, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa.

4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 3. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur p ir 0 un



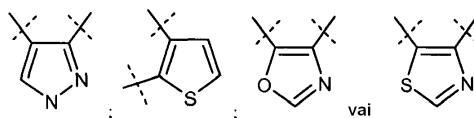
ir



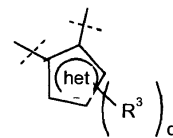
5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 4. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur q ir 0 vai 1, un R<sup>3</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, amino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  $-(CH_2)_w-R^{10}$ , kur w ir 1 vai 2, R<sup>10</sup> ir heterocikloalkilgrupa, Ar-(R<sup>7</sup>)<sub>z</sub>, COOH vai C(O)-NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, kur R<sup>11</sup> ir H vai (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa; R<sup>12</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa vai hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa; vai R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido 5- vai 6-locekļu heterocikloalkilgredzenu, kas neobligāti ir aizvietots ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu vai hidroksigrupu; un



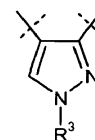
ir



6. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 5. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur:



ir



7. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 6. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R<sup>3</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, amino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  $-(CH_2)_w-R^{10}$ , kur w ir 1 vai 2, R<sup>10</sup> ir heterocikloalkilgrupa, Ar-(R<sup>7</sup>)<sub>z</sub>, COOH vai C(O)-NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, kur R<sup>11</sup> ir H vai (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa; R<sup>12</sup> ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēn-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa vai hidroksi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupa; vai R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido 5- vai 6-locekļu heterocikloalkilgredzenu, kas neobligāti ir aizvietots ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu vai hidroksigrupu.

8. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 7. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R<sup>1</sup> ir H, R<sup>2</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, fluor-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, fenilgrupa, tienilmetilgrupa, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupa, halogēnfenilgrupa, ciānfenilgrupa, trifluormetilfenilgrupa, benzilgrupa, metoksigrupa, etoksigrupa, metoksimetilgrupa, N-metilpirolilgrupa vai NR<sup>9</sup>R<sup>9</sup>, kur R<sup>9</sup> ir H vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa un R<sup>9</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupa, fenilgrupa, halogēnfenilgrupa, ciānfenilgrupa, toliilgrupa, metoksifenilgrupa, trifluormetilfenilgrupa, bifenilgrupa, benzilgrupa, pirolilgrupa, pīridinilgrupa, tiazolilgrupa vai tienilgrupa, vai R<sup>8</sup> un R<sup>9</sup> kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido morfolinogrupu, tiomorfolinogrupu, tiomorfolinil-1,1-dioksīdgrupu, pirolidinilgrupu, hidroksipirolidinilgrupu vai piperidinilgrupu;

R<sup>3</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, trifluormetilgrupa, 2,2,2-trifluoretilgrupa, 1,1,1,3,3,3-heksafluorizopropilgrupa, metoksibenzilgrupa, hidroksietilgrupa, hidroksipropilgrupa, etiķskābe,

acetamīds, morfoliniloksoetilgrupa, metoksifenilacetamīds, hidroksi-  
etilacetamīds vai dihidroksipropilgrupa;

R<sup>4</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēna atoms vai dimetilaminometilfenil-  
grupa; n ir 0 vai 1; un

R<sup>5</sup> ir acetanilīds, dimetilaminometilfenilgrupa, metilaminometil-  
fenilgrupa, morfolinometilfenilgrupa, pirolidinilmetilfenilgrupa, etil(2-  
hidroksietil)aminometilfenilgrupa, 2-hidroksietil-1-piperazinilmetil-  
fenilgrupa, hidroksilmetilfenilgrupa, 4-metil-1-piperazinilpirimidin-  
ilgrupa, morfolinoetilaminometilgrupa, hidroksietilaminometilgrupa,  
dimetilaminometilgrupa, dimetilaminoetilaminometilgrupa, dimetil-  
aminometilkarboniltetrahidropiridinilgrupa, tetrahidropiridinilgrupa,  
morfolinopiridinilgrupa, morfolinokarboniltetrahidropiridinilgrupa,  
metilsulfoniletilaminometilgrupa, 4-metilpiperazinilpropilaminometil-  
grupa, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-A<sup>m</sup>, kur A<sup>m</sup> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupa, OH vai  
4-metilpiperazinilgrupa; vai -C(O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, kur R<sup>13</sup> un R<sup>14</sup>  
kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir piesaistīti, veido N-morfolino-  
grupu, N-tiomorfolinogrupu, piperazinilgrupu, 4-metilpiperazinilgrupu  
vai -SCH<sub>3</sub>; kur r ir 2 vai 3.

9. Savienojums, kas izvēlēts no šādas virknes:

N'-{4-[4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N'-fenilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N'-etilurīnviela;

N'-{4-(1-etil-4-{2-[3-(4-morfolinilmetil)fenil]-1H-pirololo[2,3-b]piridin-  
4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N'-etilurīnviela;

N'-{4-(1-etil-4-{2-[4-(1-pirolidinilmetil)fenil]-1H-pirololo[2,3-b]piridin-  
4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-(1-etil-4-{2-[1,2,3,6-tetrahidro-4-piridinil]-1H-pirololo[2,3-b]piridin-  
4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-(4-{2-[3-(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-metil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-(1-metiletil)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N,N-dimetil-N'-{4-(1-metil-4-{2-[4-(1-pirolidinilmetil)fenil]-1H-  
pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}urīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[[etil(2-hidroksietil)amino]metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]pi-  
ridin-4-il)-1-metil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dietilurīnviela;

N,N-dietil-N'-{4-(1-etil-4-{2-[4-(1-pirolidinilmetil)fenil]-1H-pirololo[2,3-  
b]piridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}urīnviela;

N'-{4-(1-etil-4-{2-[4-[[etil(2-hidroksietil)amino]metil]fenil]-1H-  
pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[[etil(2-hidroksietil)amino]metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-  
b]piridin-4-il)-1-(1-metiletil)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N,N-dietil-N'-{4-[4-(2-{4-[[4-(2-hidroksietil)-1-piperazinil]metil]fenil]-  
1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1-metil-1H-pirazol-3-il]fenil}urīnviela;

N'-{4-[1-etil-4-(2-{3-[(metilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-  
4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-(1-metiletil)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dietilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-metil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dietilurīnviela;

N'-{4-(4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-[2-(metilamino)etil]-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{3-(hidroksimetil)fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1-[2-  
(metilamino)etil]-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[1-[2-(dimetilamino)etil]-4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-  
pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela; un

N,N-dimetil-N'-{4-(1-metil-4-{2-[2-(4-metil-1-piperazinil)-5-pirimidinil]-  
1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}urīnviela;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

10. Savienojums saskaņā ar 9. pretenziju, kas ir N'-{4-[4-(2-  
{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1-etil-1H-pir-  
azol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela vai tā farmaceutiski pieņemams  
sāls.

11. Savienojums saskaņā ar 9. pretenziju, kas ir N'-{4-[4-(2-  
{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1-etil-1H-  
pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela.

12. Savienojums, kas izvēlēts no šādas virknes:

N'-{4-(4-[2-(4-[[etil(2-hidroksietil)amino]metil]fenil)-1H-pirololo[2,3-b]pi-  
ridin-4-il]-1-metil-1H-pirazol-3-il]fenil)-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[1-[2-(dimetilamino)etil]-4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-  
pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela;

N'-{4-[4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N'-etilurīnviela; un

N'-{4-[4-(2-{4-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-  
1-metil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dietilurīnviela; vai tā farmaceutiski  
pieņemams sāls.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur a) savienojumu ar  
formulu (I), kā noteikts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, vai tā  
farmaceutiski pieņemamu sāli un b) vienu vai vairākas farmaceutiski  
pieņemamas palīgvielas.

14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur a) N'-{4-[4-(2-{3-  
{[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]piridin-4-il)-1-etil-1H-pir-  
azol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnvielu vai tās farmaceutiski pieņemamu  
sāli un b) vienu vai vairākas farmaceutiski pieņemamas palīgvielas.

15. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts jebkurā no 1. līdz  
12. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai  
terapijā.

16. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts jebkurā no 1. līdz  
12. pretenzijai, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls izmantošanai  
vēža ārstēšanā.

17. N'-{4-[4-(2-{3-[(dimetilamino)metil]fenil}-1H-pirololo[2,3-b]pi-  
ridin-4-il)-1-etil-1H-pirazol-3-il]fenil}-N,N-dimetilurīnviela vai tās far-  
maceutiski pieņemams sāls izmantošanai vēža ārstēšanā.

18. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 16. vai 17. pretenziju,  
kur vēzis ir viendabīga audzēja vēzis vai asins vēzis.

19. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 18. pretenziju, kur  
viendabīgā audzēja vēzis ir plaušu vēzis, krūts vēzis, taisnās zarnas  
vēzis, olnīcu vēzis, melanoma un aizkuņģa dziedzera vēzis.

20. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 18. pretenziju, kur  
asins vēzis ir leukēmija, B-šūnu limfoma, akūta mielogēna leukēmija  
(AML) vai hroniska mielogēna leukēmija (CML).

21. Savienojuma ar formulu (I), kā noteikts jebkurā no 1. līdz  
12. pretenzijai, vai farmaceutiski pieņemama tā sāls izmantošana  
medikamenta ražošanā, kas paredzēts vēža ārstēšanai.

22. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts jebkurā no 1. līdz  
12. pretenzijai, vai farmaceutiski pieņemams tā sāls izmantošanai  
proliferatīvo slimību ārstēšanā, kur savienojums vai tā farmaceutiski  
pieņemams sāls ir paredzēts ievadīšanai atsevišķi vai kombinācijā  
ar citām zālēm vai citām terapeitiskām vielām.

- |  |                     |
|--|---------------------|
| (51) <b>A01N 63/00</b> <sup>(200601)</sup>   | (11) <b>1962873</b> |
| <b>A61K 35/74</b> <sup>(200601)</sup>  |                     |
| <b>A61K 9/16</b> <sup>(200601)</sup>   |                     |
| <b>A61K 9/19</b> <sup>(200601)</sup>   |                     |
| <b>A23L 1/30</b> <sup>(200601)</sup>   |                     |
| <b>A61K 9/48</b> <sup>(200601)</sup>   |                     |
| (21) 05854220.0  | (22) 14.12.2005     |
| (43) 03.09.2008  |                     |
| (45) 29.05.2013  |                     |
| (86) PCT/US2005/045457   | 14.12.2005          |
| (87) WO2007/070052   | 21.06.2007          |
| (73) OxThera Intellectual Property AB, Sturegatan 56, 114 36<br>Stockholm, SE  |                     |
| (72) KAUL, Poonam, US<br>SIDHU, Harmeet, US  |                     |
| (74) Rystedt, Per Hampus, BRANN AB, P.O. Box 12246, 102 26<br>Stockholm, SE  |                     |
| Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga<br>LV-1084, LV   |                     |
| (54) <b>FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS, KAS SATUR<br/>OKSALĀTUS REDUCĒJOŠAS BAKTĒRIJAS<br/>PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING<br/>OXALATE-REDUCING BACTERIA</b> |                     |

(57) 1. Kompozīcija oksalātu koncentrācijas pazemināšanai cilvēka vai dzīvnieka organismā, kas sastāv no pulvera, kurā ir oksalātus reducējoša kompozīcija, kas ietver:

- a) no 0,5 līdz 95 % oksalātus reducējošu baktēriju;
- b) no 0,1 % līdz 50 % disaharīdu;
- c) no 3 līdz 85 % maltodekstrīna;
- d) no 0,5 līdz 25 % algināta, un
- e) no 1,05 līdz 60 % oligofruktozes,

un kur oksalātus reducējošā baktērija ir *Oxalobacter formigenes*.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur oksalātus reducējošā baktērija ir *Oxalobacter formigenes* štamms HC1.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur oksalātus reducējošā kompozīcija uzrāda KVV (koloniju veidojošās vienības)/g vērtību no vismaz apmēram  $1 \times 10^3$  līdz apmēram  $1 \times 10^{13}$  oksalātus reducējošo baktēriju.

4. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur oksalātus reducējošās kompozīcijas vienai devai piemīt oksalātus reducējošo enzīmu aktivitāte no apmēram 5 vienībām līdz apmēram 5000 vienībām.

5. Kompozīcija oksalātu samazināšanai, kas satur efektīvu daudzumu oksalātus reducējošas aktivitātes, kas reducē klātesošā oksalāta porciju, kas satur:

0,5 līdz 95 % dzīvotspējīgu, liofilizētu, oksalātus reducējošu baktēriju un

95 līdz 0,5 % farmaceitiski pieņemamas palīgvielas, kur kompozīcija ir pulveris.

6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur oksalātus reducējošā baktērija ir *Oxalobacter formigenes*.

7. Kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kur oksalātus reducējošā baktērija ir *Oxalobacter formigenes* štamms HC1.

8. Oksalātus reducējošas farmaceitiskas pulverveida kompozīcijas pagatavošanas paņēmieni, kas ietver: oksalātus reducējošas baktērijas *Oxalobacter formigenes* ņemšanu koncentrācijā vismaz  $1 \times 10^3$  līdz  $1 \times 10^{13}$ ;

neobligātu vienas vai vairāku farmaceitiski pieņemamu palīgvielu piejaukšanu oksalātus reducējošai baktērijai; un baktēriju ievadīšanu farmaceitiskā devā, kas sastāv no pulvera.

9. Paņēmieni saskaņā ar 8. pretenziju, kur palīgviela satur vienu vai vairākas vielas no disaharīdiem, maltodekstrīna, algināta vai oligofruktozes.

10. Paņēmieni saskaņā ar 8. pretenziju, kur oksalātus reducējošā baktērija ir *Oxalobacter formigenes* štamms HC1.

- (51) **A61K 31/155<sup>(200601)</sup>** (11) **1965783**  
**A61K 31/426<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/4439<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 3/10<sup>(200601)</sup>**
- (21) 06820700.0 (22) 22.12.2006
- (43) 10.09.2008
- (45) 19.06.2013
- (31) 0526291 (32) 23.12.2005 (33) GB
- (86) PCT/GB2006/050475 22.12.2006
- (87) WO2007/072083 28.06.2007
- (73) Royalty Pharma Collection Trust, Rodney Square North, 1100 North Market Street, Wilmington DE 19890, US
- (72) RACHMAN, Jonathan, GB
- (74) Mintz Levin Cohn Ferris Glovsky and Popeo LLP, Alder Castle, 10 Noble Street, London EC2V 7JX, GB  
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **2. TIPA DIABĒTA ĀRSTĒŠANA AR DPIV INHIBITORA UN METFORMĪNA VAI TIAZOLIDĪNDIONA KOMBINĀCIJU TREATMENT OF TYPE 2 DIABETES WITH A COMBINATION OF DPIV INHIBITOR AND METFORMIN OR THIAZOLIDINEDIONE**

(57) 1. Dipeptidilpeptidāzes (DPIV) inhibitoru kombinācijā ar metformīnu vai tiazolidīndionu izmantošanai pirmās līnijas terapijā 2. tipa diabēta ārstēšanā cilvēkam, turklāt cilvēks iepriekš nav ticis ārstēts ar pret diabēta līdzekli.

2. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt cilvēks netika panācis adekvātu glikēmijas kontroli tikai diētas, svara samazināšanas un/vai vingrošanas ceļā.

3. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt DPIV inhibitors un metformīns vai tiazolidīndions tiek ievadīti vienlaicīgi, secīgi vai atsevišķi.

4. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt DPIV inhibitors un metformīns vai tiazolidīndions tiek ievadīti kā preparāts, kas satur abus – DPIV inhibitoru un metformīnu vai tiazolidīndionu.

5. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt DPIV inhibitors un metformīns vai tiazolidīndions tiek ievadīti perorāli.

6. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt DPIV inhibitors ir glutamīniltiazolidīns vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

7. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt DPIV inhibitors ir izvēlēts no sitagliptīna, vildagliptīna, saksagliptīna, denagliptīna un alogliptīna, un to farmaceitiski pieņemamiem sāļiem.

8. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt DPIV inhibitors un metformīns vai tiazolidīndions tiek ievadīti vienreiz, divreiz vai trīsreiz dienā.

9. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt DPIV inhibitors tiek ievadīts kombinācijā ar metformīnu.

10. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt tiazolidīndions ir troglitazons, ciglitazons, pioglitazons, englitazons vai rosiglitazons.

11. Kombinācija izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt tiazolidīndions ir rosiglitazons.

- (51) **A23C 9/142<sup>(200601)</sup>** (11) **1973412**  
**A23C 9/15<sup>(200601)</sup>**
- (21) 07700146.9 (22) 05.01.2007
- (43) 01.10.2008
- (45) 17.04.2013
- (31) 756213 P (32) 05.01.2006 (33) US
- (86) PCT/DK2007/000005 05.01.2007
- (87) WO2007/076873 12.07.2007
- (73) Arla Foods Amba, Sønderhøj 14, 8260 Viby J, DK
- (72) LAURITZEN, Karsten, DK  
HOLST, Hans, Henrik, DK
- (74) Zacco Denmark A/S, Hans Bekkevolds Allé 7, 2900 Hellerup, DK  
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013, LV
- (54) **PIENS AR ZEMU OGĻHIDRĀTU SATURU UN DABĪGU KALCIJU**  
**LOW-CARBOHYDRATE MILK WITH ORIGINAL CALCIUM**

(57) 1. Process stabilizatorus nesaturošu garšīgu piena produktu ar zemu ogļhidrātu saturu no 90 līdz 250 kJ/100 g ražošanai, kurā ir saglabāta būtībā visa dabīgā pienā esošā kalcija koncentrācija un visi dabīgā piena proteīni, kuram nav pievienots kalcījs, un piena produktam ir piena garša un sajūta mutē ir, kā dzerot pienu, bet tas ir mazāk salds, un līdz ar to neprasa nevēlamas ūdens garšas vai citu svešu piegaršu maskēšanu 2. posma filtrācijas procesā, kur piena pH regulē līdz 7,0 - 9,5, pēc tam veic ultrafiltrāciju; ultrafiltrācijas filtrātam veic nanofiltrāciju, un nanofiltrācijas filtrātu samaisa ar ultrafiltrācijas koncentrātu un ūdeni, un pH regulē līdz dabīgajam piena pH.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kur pH regulē līdz 7,5 - 9,0 pirms ultrafiltrācijas.

3. Process saskaņā ar 2. pretenziju, kur pH regulē līdz 8,0 - 8,5 pirms ultrafiltrācijas.

4. Process saskaņā ar 3. pretenziju, kur pH regulē līdz 8,5 pirms ultrafiltrācijas, un pH regulē līdz 6,7 gala produktā.

5. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kur gala maisījumu hidrolizē ar laktāzes enzīmu.

- (51) **A61K 9/14<sup>(200601)</sup>** (11) **1976522**  
**A61K 9/00<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 9/20<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/47<sup>(200601)</sup>**



- (21) 06830764.4 (22) 20.12.2006  
 (43) 08.10.2008  
 (45) 05.06.2013  
 (31) 05113112 (32) 30.12.2005 (33) EP  
 06116654 05.07.2006 EP  
 (86) PCT/EP2006/070045 20.12.2006  
 (87) WO2007/077135 12.07.2007  
 (73) Krka Tovarna Zdravil, D.D., Novo Mesto, Smarjeska cesta 6, 8501 Novo Mesto, SI  
 (72) KROSELJ, Vesna, SI  
 OSOLNIK, Renata, SI  
 URSKA, Turk, SI  
 FRANCI, Bevec, SI  
 (74) UEXKÜLL & STOLBERG, Patentanwälte, Beselerstrasse 4, 22607 Hamburg, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA, KAS SATUR MONTE-  
 LUKASTU  
 PHARMACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING MONTE-  
 TELUKAST**

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija tabletes veidā, kas satur montelukasta farmaceutiski pieņemamu sāli amorfā formā kā aktīvo ingredientu, raksturīga ar to, ka tā ietver ārējo slāni un ka aktīvais ingredients ir daļiņu veidā, kam  $d_{90}$  vērtība ir mazāka par 250  $\mu\text{m}$  un un vidējais daļiņu izmērs ir diapazonā no 20 līdz 150  $\mu\text{m}$ , un ka tableti iegūst ar tiešo presēšanu.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu pildvielu, kur vienas vai vairāku pildvielu daļiņu izmērs ir no 1 līdz 500  $\mu\text{m}$ , vislabāk no 10 līdz 250  $\mu\text{m}$ .

3. Farmaceutiskās kompozīcijas saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu pildvielu, kas ir izvēlēta no atšķaidītājiem, virsmaktīvām vielām, antioksidantiem, helātus veidojošiem līdzekļiem, sairšanu veicinošiem līdzekļiem, saistvielām, smērvielām, slīdvielām.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kas satur ar izsmidzināšanu izžāvētu laktozes un mikrokristāliskās celulozes maisījumu.

5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur aktīvā ingredienta daļiņām ūdens saturs ir mazāks par 5 masas %.

6. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur montelukasts ir sārmetālu sāls veidā, vislabāk tā nātrija sāls veidā.

7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur 2 līdz 20 mg aktīvā ingredienta.

8. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur:

atšķaidītāju, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no bezūdens laktozes, laktozes monohidrāta, modificētas laktozes, divbāziskā kalcija fosfāta, tribāziskā kalcija fosfāta, mikrokristāliskās celulozes, silicizētas mikrokristāliskās celulozes, pulverveida celulozes, kukurūzas cietes, preželatinizētas cietes, kalcija karbonāta, saharozes, glikozes, dekstrātiem, dekstrīniem, dekstrozes, fruktozes, laktīta, mannīta, sorbīta, cietes un to maisījumiem; un/vai sairšanu veicinošu līdzekli, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no kroskarmelozes nātrija, krosповidona, nātrija cietes glikolāta, graudu cietes, kartupeļu cietes, kukurūzas cietes, modificētas cietes, kalcija silikātiem, zemas aizvietošanas hidroksipropilcelulozes un to maisījumiem; un/vai

slīdvielu, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no silīcija dioksīda, koloidālā silīcija dioksīda, izgulsnētā silīcija dioksīda, pirogēnā silīcija dioksīda, alumīnija silikāta un to maisījumiem; un/vai smērvielu, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no magnija stearāta, magnija laurilsulfāta, nātrija stearilfumarāta, saharozes esteriem, taukskābēm, polietilēnglikola, stearīnskābes un to maisījumiem; un/vai virsmaktīvu vielu, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no nātrija laurilsulfāta, glicerilesteriem, polioksietilēnglikola esteriem, polioksietilēnglikola ēteriem, polioksietilēna sorbitāna taukskābju esteriem, sulfātu saturošām virsmaktīvām vielām, polioksietilēna/polioksipropilēna kopolimēriem un to maisījumiem; un/vai

antioksidantu, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no vitamīna E acetāta,  $\alpha$ -tokoferola, askorbilpalmitāta, butilēta hidroksianizo-

la (BHA), butilēta hidroksitoluola (BHT), propilgalāta, ditiotreitola, tokoferola polietilēnglikola sukcināta (TPGS), EDTA, ciklodekstrīniem un to maisījumiem; un/vai

saistvielu, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no polivinilpirolidona, cietes (preželatinizētas vai parastās), celulozes atvasinājumiem, hidroksipropilmetilcelulozes (HPMC), hidroksipropilcelulozes (HPC), karboksimetilcelulozes (CMC) un to sāļiem, želatīna un to maisījumiem.

9. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur tablete ietver ārējo slāni, kas sastāv no cukura, hidroksipropilmetilcelulozes, hidroksipropilcelulozes, metilcelulozes, etilcelulozes, polivinilspirta, karboksimetilcelulozes nātrija, metakrilskābes un/vai metakrilskābes esteriem.

10. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru 8. vai 9. pretenziju, kam saspišanas stiprība ir diapazonā no 25 līdz 170 N, vislabāk diapazonā no 30 līdz 140 N.

11. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas satur:

- (i) 1 līdz 10 masas % aktīvā ingredienta;
- (ii) 20 līdz 95 masas % atšķaidītāja;
- (iii) 0,5 līdz 15 masas % sairšanu veicinoša līdzekļa;
- (iv) 0,1 līdz 1,5 masas % smērvielas.

12. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai iegūšanas paņēmieni, kurā ietilpst stadijas:

- (1) aktīvā ingredienta un vienas vai vairāku pildvielu maisījuma žāvēšana,
- (2) sausā maisījuma presēšana tabletēs,
- (3) stadijas (2) tablešu apvalkošana,
- (4) iespējams, tablešu pakošana iepakojumā, kas ietver gāzu maisījumu, kas satur mazāk par 10 tilp. % skābekļa.

13. Paņēmieni saskaņā ar 13. pretenziju, kur sajaukšanu, presēšanu un/vai apvalkošanu veic kontrolējamā atmosfērā, ieskaitot zemu mitrumu, zemu skābekļa saturu, zemu temperatūru un gaismnecaurlaidības apstākļus.

- (51) **B61F 7/00**<sup>200601</sup> (11) **1993895**  
 (21) 06830404.7 (22) 06.12.2006  
 (43) 26.11.2008  
 (45) 24.04.2013  
 (31) 4142006 (32) 14.03.2006 (33) AT  
 (86) PCT/EP2006/069358 06.12.2006  
 (87) WO2007/104369 20.09.2007  
 (73) Siemens AG Österreich, Siemensstraße 90, 1210 Wien, AT  
 (72) KIENDLER, Harald, AT  
 HIRTENLECHNER, Johannes, AT

(74) Peham, Alois, Siemens AG, Postfach 22 16 34, 80506 München, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **SLIEŽU TRANSPORTLĪDZEKLIM PAREDZĒTS RITEŅU  
 KOMPLEKTA GULTŅU KORPUSS  
 WHEEL-SET BEARING HOUSING FOR A RAIL VEHICLE**

(57) 1. Šasija (FAR) vai ratiņi sliežu transportlīdzeklī, pie kam šasijai (FAR) vai ratiņiem ir vismaz viens riteņu komplekts (RAS, RAS') ar riteņu komplekta gultņiem (RLA, RLA') un riteņu komplekta gultņu korpusiem (RLG) galveno atspere (PFE) atbalstīšanai, pie tam riteņu komplekta gultņi (RLA, RLA') var tikt pozicionēti vismaz divās atšķirīgās pozīcijās riteņu komplekta gultņu korpusos,

kas raksturīgi ar to, ka, šķērsnobīdi, kas rodas starp galvenās atsperes (PFE) vidusasi (a) un galvenajai atsperei (PFE) piesaistītā riteņu komplekta gultņu (RLA, RLA') viduspunktu, lietojot pirmajam vai otrajam sliežu ceļa platumam paredzētu riteņu komplektu (RAS, RAS'), uzņem riteņu komplekta piederīgā gultņa korpusā (RLG) centrēts un aksiāli fiksēts adaptera gredzens (ADR, ADR').

2. Riteņu komplekta gultņu korpus (RLG'') sliežu transportlīdzeklī, pie kam riteņu komplekta gultņu korpus (RLG''') ir paredzēts riteņu komplektam (RAS) ar pirmo ceļa platumu (SPW1), kas raksturīgs ar to, ka pēc nomaiņas ar riteņu komplekta gultņu korpusu (RLG'''), kas paredzēts riteņu komplektam (RAS') ar otro ceļa platumu, un uzmontēšanas uz šasijas (FAR) vai ratiņiem tas satur saskarnes ar šasiju (FAR) vai ratiņiem būtībā tajās pašās vietās, kā satur riteņu komplekts (RAS') ar otrajam

ceļa platumam (SPW2) paredzēto riteņu komplekta gultņu korpusu (RLG''').

3. Šasija (FAR) vai ratiņi sliežu transportlīdzeklim, pie kam šasija (FAR) vai ratiņi satur vismaz vienu riteņu komplektu (RAS, RAS') ar riteņu komplekta gultņiem (RLA, RLA') un riteņu komplekta gultņa korpusiem (RLG) galveno atsperu (PFE) atbalstīšanai, kas raksturīga ar to, ka tā satur riteņu komplekta gultņu korpusus (RLG, RLG', RLG'', RLG''', RLG''''), kas atbilst 1. vai 2. pretenzijai.

4. Šasija atbilstoši 3. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka galvenās atsperes (PFE) slodzes pārnese uz piederīgā riteņu komplekta gultņu korpusu (RLG, RLG', RLG'', RLG''', RLG''''), notiek vismaz riteņu komplekta gultņu korpusa (RLG) apgabalā, kuru nosaka attāluma (N) starp pirmā sliežu ceļa platumā riteņu komplekta (RAS) gultņu (RLA) viduspunktiem (MI1) un attāluma (B) starp otrā sliežu ceļa platumā riteņu komplekta (RAS) gultņu (RAS') viduspunktiem (MI1') starpība.

5. Šasija vai ratiņi atbilstoši 3. vai 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka galvenās atsperes (PFE) slodzes pārnese uz piederīgā riteņu komplekta gultņu korpusu (RLG, RLG', RLG'', RLG''', RLG''''), notiek vismaz vienā attiecīgā riteņu komplekta gultņu korpusa (RLG, RLG', RLG'', RLG''', RLG''''), apgabalā, kurš atrodas starp pozīciju, kas paredzēta pirmajam sliežu ceļa platumam piesaistītā riteņu komplekta (RAS) gultņim (RLA), un pozīciju, kas paredzēta otrajam sliežu ceļa platumam piesaistītā riteņu komplekta (RAS') gultņim (RLA').

6. Šasija vai ratiņi atbilstoši jebkurai no 3. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka normālais attālums (P) starp pretējo viena un tā paša riteņu komplekta (RAS, RAS') galveno atsperu (PFE) vidusasi (a) ir lielāks par vai vienāds ar attālumu (N) starp pirmajam ceļa platumam atbilstošā riteņu komplekta (RAS) gultņu (RLA) viduspunktiem (MI1) un ir mazāks par vai vienāds ar attālumu (B) starp otrajam ceļa platumam atbilstošā riteņu komplekta (RAS') gultņu (RLA') viduspunktiem (MI1').

7. Šasija vai ratiņi atbilstoši vienai no 3. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka šķērsnobīdi, kas rodas starp galvenās atsperes (PFE) vidusasi (a) un galvenajai atsperai (PFE) paredzētā riteņu komplekta gultņa (RLA, RLA') viduspunktu, lietojot pirmajam vai otrajam sliežu ceļa platumam paredzētu riteņu komplektu (RAS, RAS'), uzņem piederīgajā riteņu komplekta gultņa korpusā (RLG) centrēts un aksiāli fiksēts adaptera gredzens (ADR, ADR').

8. Šasija vai ratiņi atbilstoši jebkurai no 3. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka šķērsnobīdi, kas rodas starp galvenās atsperes (PFE) vidusasi (a) un galvenajai atsperai (PFE) paredzētā riteņu komplekta gultņa (RLA, RLA') viduspunktu, lietojot pirmajam vai otrajam sliežu ceļa platumam paredzētu riteņu komplektu (RAS, RAS'), uzņem vismaz viens distancējošs gredzens (DIR).

9. Šasija vai ratiņi atbilstoši vienai no 3. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka riteņu komplekta gultņu korpusa (RLG'') viduspunkts (MI2) un riteņu komplekta gultņa (RLA, RLA') viduspunkts (MI1, MI1') viens pret otru ir nobīdīti sāniski tā, ka šķērsnobīde, kas rodas starp galvenās atsperes (PFE) vidusasi (a) un galvenajai atsperai (PFE) paredzētā riteņu komplekta gultņa (RLA, RLA') viduspunktu (MI1, MI1'), tiek uzņemta, apgriežot gultņa korpusu (RLG) par 180° ap tā vertikālo asi.

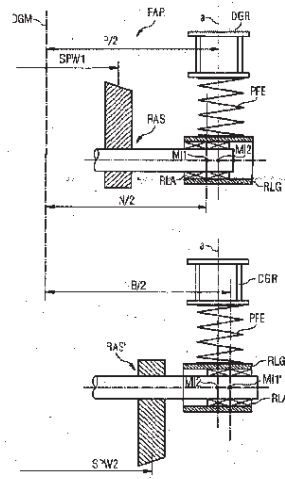
10. Šasija vai ratiņi atbilstoši vienai no 3. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka dažādu ceļa platumu riteņu komplekti (RAS, RAS') ir aprīkoti ar dažādiem gultņu korpusiem (RLG''', RLG''''), lai uzņemtu šķērsnobīdi, kas rodas starp galvenās atsperes (PFE) vidusasi (a) un galvenajai atsperai (PFE) paredzētā riteņu komplekta gultņa (RLA, RLA') viduspunktu, lietojot pirmajam vai otrajam sliežu ceļa platumam paredzētu riteņu komplektu (RAS, RAS').

11. Šasija vai ratiņi atbilstoši jebkurai no 3. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka galvenās atsperes (PFE) ir spirālveida tērauda atsperes vai saspiežamas gumijas atsperes.

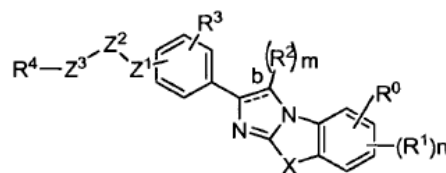
12. Šasija vai ratiņi atbilstoši jebkurai no 3. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka riteņu komplekta gultņu korpusa (RLG, RLG', RLG'', RLG''', RLG''''), viduspunkts (MI2) būtībā atrodas uz piederīgās galvenās atsperes (PFE) vidusass (a).

13. Sliežu transportlīdzeklis ar jebkurai no 3. līdz 12. pretenzijai atbilstošu šasiju vai ratiņiem.

FIG 1



- (51) **C07D 513/04**(200601) (11) **2001892**  
 (21) 07753256.2 (22) 16.03.2007  
 (43) 17.12.2008  
 (45) 24.04.2013  
 (31) 743543 P (32) 17.03.2006 (33) US  
 (86) PCT/US2007/006613 16.03.2007  
 (87) WO2007/109120 27.09.2007  
 (73) Ambit Biosciences Corporation, 11080 Roselle Street, San Diego, CA 92121, US  
 (72) BHAGWAT, Shripad, US  
 CHAO, Qi, US  
 GROTZFELD, Robert, M., CH  
 PATEL, Hitesh, K, US  
 SPRANKLE, Kelly, G., US  
 (74) Ritter, Thomas Kurt, Jones Day, Prinzregentenstraße 11, 80538 München, DE  
 Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV  
 (54) **IMIDAZOLTIAZOLA SAVIENOJUMI PROLIFERATĪVU SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**  
**IMIDAZOLOTHIAZOLE COMPOUNDS FOR THE TREATMENT OF PROLIFERATIVE DISEASES**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu (I),



kur  
 saite b ir parastā vai dubultsaite;  
 X ir -S-, -N(R<sup>5</sup>)- vai -O-;  
 Z<sup>1</sup> un Z<sup>3</sup> katrs neatkarīgi viens no otra ir -N(R<sup>5</sup>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -O-, -S- vai tieša saite;  
 Z<sup>2</sup> ir -C(O)- vai -C(S)-;  
 m ir vesels skaitlis no 1 līdz 2;  
 n ir vesels skaitlis no 1 līdz 3;  
 katrs q neatkarīgi viens no otra ir vesels skaitlis no 1 līdz 4;  
 R<sup>0</sup> ir ūdeņradis, halogēns, hidroksigrupa, pēc izvēles aizvietota alkilgrupa vai pēc izvēles aizvietota alkoksigrupa;  
 katrs no R<sup>1</sup> tiek neatkarīgi viens no otra atlasīts no grupas, kas sastāv no halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroaralkenilgrupas, -R<sup>6</sup>OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>SR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>S(O)R<sup>8</sup>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>R<sup>9</sup>OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>CN, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(S)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(NR<sup>7</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(S)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(NR<sup>7</sup>)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(S)N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>,

$-R^6C(NR^7)N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)N(R^7)R^9N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)SR^8$ ,  $-R^6C(S)SR^8$ ,  $-R^6C(NR^7)SR^8$ ,  $-R^6S(O)OR^7$ ,  $-R^6S(O)N(R^7)_2$ ,  $-R^6S(O)N(R^7)N(R^7)_2$ ,  $-R^6S(O)N(R^7)N=C(R^7)_2$ ,  $-R^6S(O)N(R^7)C(O)R^8$ ,  $-R^6S(O)N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ ,  $-R^6S(O)N(R^7)C(NR^7)N(R^7)_2$ ,  $-R^6N(R^7)C(O)R^8$ ,  $-R^6N(R^7)C(O)OR^8$ ,  $-R^6N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ ,  $-R^6N(R^7)C(NR^7)SR^8$ ,  $-R^6N(R^7)C(S)SR^8$ ,  $-R^6N(R^7)C(O)N(R^7)_2$ ,  $-R^6N(R^7)C(NR^7)N(R^7)_2$ ,  $-R^6N(R^7)C(S)N(R^7)_2$ ,  $-R^6N(R^7)S(O)R^8$ ,  $-R^6OC(O)R^8$ ,  $-R^6OC(NR^7)R^8$ ,  $-R^6OC(S)R^8$ ,  $-R^6OC(O)OR^8$ ,  $-R^6OC(NR^7)OR^8$ ,  $-R^6OC(S)OR^8$ ,  $-R^6OC(O)SR^8$ ,  $-R^6OC(O)N(R^7)_2$ ,  $-R^6OC(NR^7)N(R^7)_2$ ,  $-R^6OC(S)N(R^7)_2$ ,  $-R^6OR^9N(R^7)_2$ ,  $-R^6SR^9N(R^7)_2$ ,  $-R^6N(R^7)R^9N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)R^9C(O)R^7$ ,  $-R^6C(O)R^9C(S)R^7$ ,  $-R^6C(O)R^9C(NR^7)R^7$ ,  $-R^6C(O)R^9C(O)OR^7$ ,  $-R^6C(O)R^9C(S)OR^7$ ,  $-R^6C(O)R^9C(NR^7)OR^7$ ,  $-R^6C(O)R^9C(O)N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)R^9C(S)N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)R^9C(NR^7)N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)R^9C(O)SR^8$ ,  $-R^6C(O)R^9C(S)SR^8$ ,  $-R^6C(O)R^9C(NR^7)SR^8$ ,  $-R^6OR^9OR^7$ ,  $-R^6C(O)R^9N(R^7)R^9N(R^7)_2$ ,  $-R^6C(O)R^9N(R^7)R^9OR^7$  un  $-R^6C(O)N(R^7)R^9OR^7$ ;

t ir 1 vai 2;

katrs no  $R^2$  tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, halogēna, nitrogrupas, ciāngrupas, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)R^{13}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-C(O)SR^{12}$  un  $-N(R^{12})S(O)R^{13}$ ;

$R^3$  ir ūdeņradis, halogēns, nitrogrupa, ciāngrupa, pēc izvēles aizvietota alkilgrupa,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)R^{13}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-C(O)SR^{12}$  vai  $-N(R^{12})S(O)R^{13}$ ;

$R^4$  tiek atlasīts no pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas arilgrupas;

katrs no  $R^5$  neatkarīgi viens no otra ir ūdeņradis vai pēc izvēles aizvietota alkilgrupa;

katrs no  $R^6$  neatkarīgi viens no otra ir tieša saite, pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkilēna ķēde vai pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkenilēna ķēde;

katrs no  $R^7$  tiek neatkarīgi atlasīts no zemāk esošajiem (i) vai (ii) (i)  $R^7$  tiek atlasīts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas, vai

(ii) divas  $R^7$  grupas kopā ar atomu, kam tās ir pievienotas, veido pēc izvēles aizvietotu heterociklilgrupu vai pēc izvēles aizvietotu heteroarilgrupu;

$R^8$  tiek neatkarīgi viens no otra atlasīts no grupas, kas sastāv no pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas;

katrs no  $R^9$  neatkarīgi viens no otra ir pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkilēna ķēde vai pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkenilēna ķēde;

katrs no  $R^{12}$  tiek neatkarīgi viens no otra atlasīts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas;

un  $R^{13}$  tiek neatkarīgi atlasīts no grupas, kas sastāv no pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas;

kur

„pēc izvēles aizvietotā alkilgrupa”, „pēc izvēles aizvietotā alkenilgrupa” un „pēc izvēles aizvietotā alkinilgrupa” attiecas attiecīgi uz

alkilgrupām, alkenilgrupām un alkinilgrupām, kas var pēc izvēles tikt aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, neatkarīgi atlasītiem no grupas, kas sastāv no nitrogrupas, halogēna, azīdgrupas, ciāngrupas, cikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, heterociklilgrupas,  $-OR^x$ ,  $-N(R^y)(R^z)$ ,  $-SR^x$ ,  $-C(J)R^x$ ,  $-C(J)OR^x$ ,  $-C(J)N(R^y)(R^z)$ ,  $-C(J)SR^x$ ,  $-S(O)R^w$  (kur t ir 1 vai 2),  $-OC(J)R^x$ ,  $-OC(J)OR^x$ ,  $-OC(J)N(R^y)(R^z)$ ,  $-OC(J)SR^x$ ,  $-N(R^x)C(J)R^x$ ,  $-N(R^x)C(J)OR^x$ ,  $-N(R^x)C(J)N(R^y)(R^z)$ ,  $-N(R^x)C(J)SR^x$ ,  $-Si(R^w)_3$ ,  $-N(R^x)S(O)_2R^w$ ,  $-N(R^x)S(O)_2N(R^y)(R^z)$ ,  $-S(O)_2N(R^y)(R^z)$ ,  $-P(O)(k^v)_2$ ,  $-OP(O)(R^v)_2$ ,  $-C(J)N(R^x)S(O)_2R^w$ ,  $-C(J)N(R^x)N(R^x)S(O)_2R^w$ ,  $-C(R^x)=N(OR^x)$  un  $-C(R^x)=NN(R^y)(R^z)$ , kur:

$R^x$  ir ūdeņradis, alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroaralkilgrupa;

$R^y$  un  $R^z$  neatkarīgi viens no otra ir ūdeņradis, alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroaralkilgrupa;

$R^v$  un  $R^z$  kopā ar slāpekļa atomu, kam tās ir pievienotas, veido heterociklilgrupu vai heteroarilgrupu;

$R^w$  ir alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroaralkilgrupa;

$R^v$  ir alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa, heteroaralkilgrupa, hidroksigrupa,  $-OR^x$  vai  $-N(R^y)(R^z)$ ; un

J ir O,  $NR^x$  vai S;

„pēc izvēles aizvietotā arilgrupa”, „pēc izvēles aizvietotā cikloalkilgrupa”, „pēc izvēles aizvietotā heteroarilgrupa” un „pēc izvēles aizvietotā heterociklilgrupa” attiecas attiecīgi uz aril-, cikloalkil-, heterociklil- un heteroarilgrupām, kas tiek pēc izvēles aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, atlasītiem no grupas, kas sastāv no nitrogrupas, halogēna, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, azīdgrupas, ciāngrupas, oksogrupas, tioksogrupas, imīngrupas, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkilalkilgrupas, heterociklilgrupas, heterociklilalkilgrupas, heteroarilgrupas, heteroaralkilgrupas,  $-R^uOR^x$ ,  $-R^u(R^v)(R^z)$ ,  $-R^uSR^x$ ,  $-R^uC(J)R^x$ ,  $-R^uC(J)OR^x$ ,  $-R^uC(J)N(R^y)(R^z)$ ,  $-R^uC(J)SR^x$ ,  $-R^uS(O)R^w$  (kur t ir 1 vai 2),  $-R^uOC(J)R^x$ ,  $-R^uOC(J)OR^x$ ,  $-R^uOC(J)N(R^y)(R^z)$ ,  $-R^uOC(J)SR^x$ ,  $-R^uN(R^x)C(J)R^x$ ,  $-R^uN(R^x)C(J)OR^x$ ,  $-R^uN(R^x)C(J)N(R^y)(R^z)$ ,  $-R^uN(R^x)C(J)SR^x$ ,  $-R^uSi(R^w)_3$ ,  $-R^u(R^x)S(O)_2R^w$ ,  $-R^uN(R^x)S(O)_2N(R^y)(R^z)$ ,  $-R^uS(O)_2N(R^y)(R^z)$ ,  $-R^uP(O)(R^v)_2$ ,  $-R^uOP(O)(R^v)_2$ ,  $-R^uC(J)N(R^x)S(O)_2R^w$ ,  $-R^uC(J)N(R^x)N(R^x)S(O)_2R^w$ ,  $-R^uC(R^x)=N(OR^x)$  un  $-R^uC(R^x)=NN(R^y)(R^z)$ , kur:

katrs  $R^u$  neatkarīgi viens no otra ir alkilēns vai tieša saite;

katrs no  $R^v$  neatkarīgi viens no otra ir alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa, heteroaralkilgrupa, hidroksigrupa,  $-OR^x$  vai  $-N(R^y)(R^z)$ ;

$R^w$  ir alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroaralkilgrupa;

katrs no  $R^x$  neatkarīgi viens no otra ir ūdeņradis, alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroaralkilgrupa;

$R^y$  un  $R^z$  katrs neatkarīgi viens no otra ir ūdeņradis, alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroaralkilgrupa;

$R^v$  un  $R^z$  kopā ar slāpekļa atomu, kam tās ir pievienotas, veido heterociklilgrupu vai heteroarilgrupu; un

J ir O,  $NR^x$  vai S;

„pēc izvēles aizvietotā alkoksigrupa” attiecas uz grupu ar formulu  $-OR$ , kur R ir pēc izvēles aizvietota alkilgrupa;

„pēc izvēles aizvietotā aralkilgrupa” attiecas uz grupu ar formulu  $-R_aR_b$ , kur  $R_a$  ir pēc izvēles aizvietota alkilgrupa un  $R_b$  ir pēc izvēles aizvietota arilgrupa;

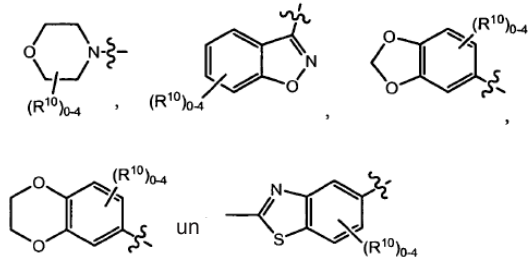
„pēc izvēles aizvietotā heteroaralkilgrupa” attiecas uz grupu ar formulu  $-R_aR_p$ , kur  $R_a$  ir pēc izvēles aizvietota alkilgrupa un  $R_p$  ir pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa;

„pēc izvēles aizvietotā cikloalkilalkilgrupa” attiecas uz grupu ar formulu  $-R_aR_d$ , kur  $R_a$  ir pēc izvēles aizvietota alkilgrupa un  $R_d$  ir pēc izvēles aizvietota cikloalkilgrupa;

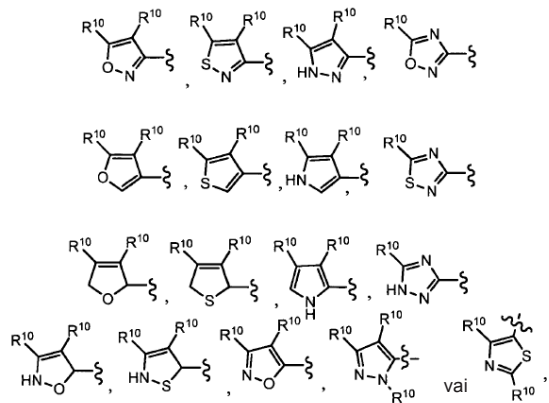


„pēc izvēles aizvietotā heterociklilalkilgrupa” attiecas uz grupu ar formulu  $-R_aR_e$ , kur  $R_a$  ir pēc izvēles aizvietota alkilgrupa un  $R_e$  ir pēc izvēles aizvietota heterociklilgrupa; vai viens tā stereoisomērs, stereoisomēru maisījums, stereoisomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

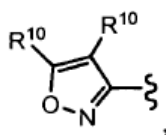
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R^4$  ir pēc izvēles aizvietota heterociklilgrupa vai ir pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa; vai kur  $R^4$  tiek atlasīta no



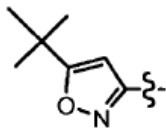
kur katrs no  $R^{10}$  tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas; vai kur  $R^4$  ir



kur katrs no  $R^{10}$  tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas; vai kur  $R^4$  ir



kur  $R^{10}$  ir ūdeņradis, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa vai halogēnarilgrupa, vai kur  $R^{10}$  ir ūdeņradis, metilgrupa, *tert*-butilgrupa, trifluormetilgrupa vai *p*-hlorfenilgrupa; vai kur  $R^4$  ir



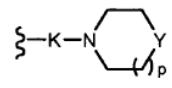
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $-Z^1Z^2Z^3-$  ir  $-N(R^5)C(O)N(R^5)-$ ,  $-N(R^5)C(O)-$ ,  $-C(O)N(R^5)-$ ,  $-OC(O)-$ ,  $-C(O)O-$ ,  $-N(R^5)C(S)N(R^5)-$ ,  $-C(S)N(R^5)-$ ,  $-N(R^5)C(S)-$ ,  $-C(S)O-$  vai  $-OC(S)-$  un katrs no  $R^5$  neatkarīgi viens no otra ir ūdeņradis vai pēc izvēles aizvietota alkilgrupa; vai kur  $R^4Z^3Z^2Z^1-$  ir  $R^4N(R^5)C(O)-$  vai  $R^4N(R^5)C(S)-$ , un  $R^5$  ir ūdeņradis vai pēc izvēles aizvietota alkilgrupa.

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kur saite b ir dubultsaite un X ir  $-S-$ .

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kur  $R^4$  ir piecu vai sešu locekļu heteroarilgrupa, atlasīta no grupas, kas sastāv no piridinilgrupas, pīridazinilgrupas, pīrimidinilgrupas, pīrazinilgrupas,

pīrolilgrupas, oksazolilgrupas, tiazolilgrupas, imidazolilgrupas, pīrazolilgrupas, izoksazolilgrupas un izotiazolilgrupas.

6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kur  $R^1$  ir



kur K ir  $-C(O)-$ ,  $-(CH_2)_q-$ ,  $-(CH_2)_qO-$ ,  $-(CH_2)_qO(CH_2)_q-$ ,  $-(CH_2)_qC(O)-$ ,  $-C(O)NH(CH_2)_q-$ ,  $-C(O)NH(CH_2)_qNH(CH_2)_q-$ ,  $-(CH_2)_qC(O)NH(CH_2)_q-$ ,  $-O(CH_2)_q-$ ,  $-OC(O)-$ ,  $-OC(O)(CH_2)_q-$  vai tieša saite; Y ir  $-O-$ ;

p ir vesels skaitlis 1; un

katrs no q neatkarīgi viens no otra ir 2 vai 3.

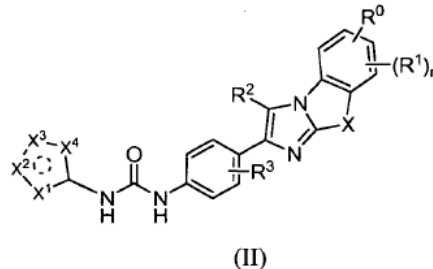
7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur savienojums tiek atlasīts no grupas, kas sastāv no:

2-benzo[d]izoksazol-3-il-N-{4-[7-(2-morfolin-4-il-etoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil}-acetamīda; 2-metil-4-trifluormetil-tiazol-5-karbonskābes {4-[7-(2-morfolin-4-il-etoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil}-amīda; 2-(4-hlorfenil)-4-metil-tiazol-5-karbonskābes {4-[7-(2-morfolin-4-il-etoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil}-amīda; un tā farmaceutiski pieņemama sāls.

8. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, kur savienojums ir morfolin-4-karbonskābes{4-[7-(3-morfolin-4-il-3-oksopropil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil}-amīds vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

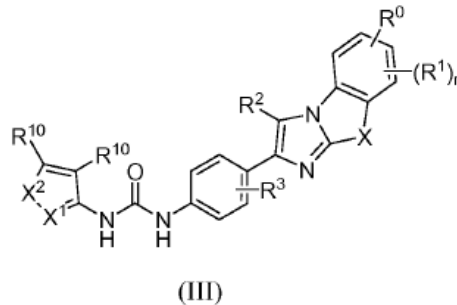
9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R^4Z^3Z^2Z^1-$  ir  $R^4N(R^5)C(O)N(R^5)-$  vai  $R^4N(R^5)C(S)N(R^5)-$ ; un katrs no  $R^5$  neatkarīgi viens no otra ir ūdeņradis vai pēc izvēles aizvietota alkilgrupa.

10. Savienojums saskaņā ar 9. pretenziju, kas atbilst formulai (II):



kur:  
X ir  $-S-$ ,  $-N(R^5)-$  vai  $-O-$ ;  
 $X^1, X^2, X^3, X^4$  neatkarīgi viens no otra tiek atlasīti no  $-C(R^{10})-$ ,  $-C(R^{10})_2-$ ,  $-N-$ ,  $-N(R^{16})-$ ,  $-O-$  un  $-S-$ , nodrošinot, lai ne vairāk kā divi no  $X^1, X^2, X^3$  un  $X^4$  būtu heteroatomi, un kur divi blakus esošie  $X^1, X^2, X^3$  un  $X^4$  nav abi  $-O-$  vai abi  $-S-$ ;  
katrs no  $R^{10}$  tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas; katrs no  $R^{16}$  tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas; un n,  $R^0, R^1, R^2, R^3$  un  $R^5$  ir tādi, kā definēts 1. pretenzijā; vai viens tā stereoisomērs, stereoisomēru maisījums, stereoisomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

11. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, kas atbilst formulai (III):





kur:

X ir -S-, -N(R<sup>5</sup>)- vai -O-;

X<sup>1</sup> ir -C(R<sup>10</sup>)- vai -N-;

X<sup>2</sup> ir -O- vai -S-;

kur katrs no R<sup>10</sup> tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas;

un

n, R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> un R<sup>5</sup> ir tādi, kā definēts 1. pretenzijā;

vai viens tā stereoizomērs, stereoizomēru maisījums, stereoizomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

12. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, kur R<sup>1</sup> tiek neatkarīgi atlasīts no grupas, kas sastāv no halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas, -R<sup>6</sup>OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>SR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>S(O)R<sup>8</sup>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(S)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(NR<sup>7</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>OC(O)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(NR<sup>7</sup>)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)C(O)R<sup>8</sup>, -R<sup>6</sup>OR<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>SR<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>-OR<sup>9</sup>OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>-OR<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>OR<sup>7</sup> un -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>OR<sup>7</sup>, kur:

t ir 1 vai 2;

katrs no R<sup>6</sup> neatkarīgi viens no otra ir tieša saite, pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkilēna ķēde vai pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkenilēna ķēde;

katrs no R<sup>7</sup> tiek neatkarīgi atlasīts no zemāk esošajiem (i) vai (ii)

(i) R<sup>7</sup> tiek atlasīts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas, vai

(ii) divi R<sup>7</sup> kopā ar atomu, kam tie ir pievienoti, veido pēc izvēles aizvietotu heterociklilgrupu vai pēc izvēles aizvietotu heteroarilgrupu; R<sup>8</sup> tiek neatkarīgi atlasīts no grupas, kas sastāv no pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas; un katrs R<sup>9</sup> neatkarīgi viens no otra ir pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkilēna ķēde vai pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkenilēna ķēde.

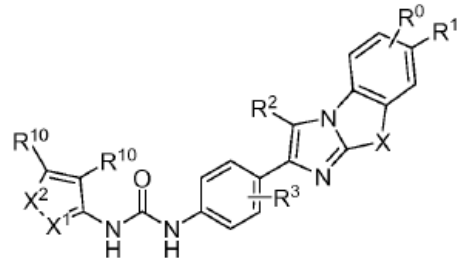
13. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kur R<sup>1</sup> ir -R<sup>6</sup>OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>SR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>S(O)R<sup>8</sup>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(S)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(NR<sup>7</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>OC(O)R<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(NR<sup>7</sup>)OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)C(O)R<sup>8</sup>, -R<sup>6</sup>OR<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>SR<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>OR<sup>9</sup>OR<sup>7</sup>, -R<sup>6</sup>OR<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>6</sup>C(O)R<sup>9</sup>N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>OR<sup>7</sup> vai -R<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>7</sup>)R<sup>9</sup>OR<sup>7</sup>;

katrs no R<sup>6</sup> neatkarīgi viens no otra ir tieša saite, pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkilēna ķēde vai pēc izvēles aizvietota taisna vai sazarota alkenilēna ķēde; un

R<sup>7</sup>, kad viens pats pievienots atomam, katrs neatkarīgi viens no otra tiek atlasīts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkenilgrupas, pēc izvēles aizvietotas alkinilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas arilgrupas, pēc izvēles aizvietotas aralkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heterociklilalkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas heteroarilgrupas un pēc izvēles aizvietotas heteroaralkilgrupas,

un kad divi ir pievienoti vienam un tam pašam atomam, kopā veido pēc izvēles aizvietotu heterociklilgrupu vai pēc izvēles aizvietotu heteroarilgrupu.

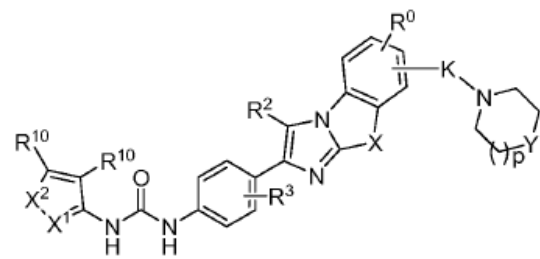
14. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, atbilstošs formulai (IIIa):



(IIIa)

vai viens tā stereoizomērs, stereoizomēru maisījums, stereoizomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

15. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, kas atbilst formulai (IV)



(IV)

kur:

K ir -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -C(O)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>C(O)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>C(O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -C(O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -OC(O)-, -OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>- vai tieša saite;

X ir -S-, -N(R<sup>5</sup>)- vai -O-;

X<sup>1</sup> ir -C(R<sup>10</sup>)- vai -N-;

X<sup>2</sup> ir -O- vai -S-;

Y ir -O-, -S-, -S(O)-, -S(O)<sub>2</sub>-, -N(R<sup>14</sup>)-, -C(H)R<sup>15</sup>- vai -C(O)-;

q ir vesels skaitlis no 1 līdz 4;

p ir vesels skaitlis no 0 līdz 2;

R<sup>10</sup> tiek neatkarīgi atlasīts no ūdeņraža, halogēna, pēc izvēles aizvietotas alkilgrupas, pēc izvēles aizvietotas cikloalkilgrupas vai pēc izvēles aizvietotas arilgrupas;

R<sup>14</sup> neatkarīgi ir ūdeņradis, pēc izvēles aizvietota alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota cikloalkilgrupa, pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa, pēc izvēles aizvietota arilgrupa, S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -C(O)OR<sup>12</sup>, -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub> vai -C(O)SR<sup>12</sup>;

R<sup>15</sup> neatkarīgi ir ūdeņradis, halogēns, nitrogrupa, ciāngrupa, pēc izvēles aizvietota alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota cikloalkilgrupa, pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa, pēc izvēles aizvietota arilgrupa, -OR<sup>12</sup>, -SR<sup>12</sup>, -N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -C(O)OR<sup>12</sup>, -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -C(O)SR<sup>12</sup> vai -N(R<sup>12</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>;

t ir 1 vai 2; un

R<sup>0</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup> un X ir tādi, kā definēts 1. pretenzijā;

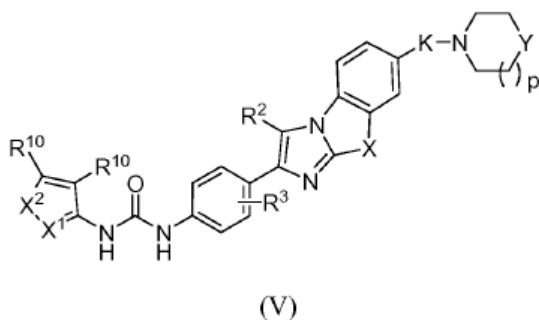
vai viens tā stereoizomērs, stereoizomēru maisījums, stereoizomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

16. Savienojums saskaņā ar 15. pretenziju, kur X<sup>1</sup> ir -N- un X<sup>2</sup> ir -O-.

17. Savienojums saskaņā ar 15. pretenziju, kur Y ir -N(R<sup>14</sup>); R<sup>14</sup> ir alkilgrupa vai -S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>; t ir 1 vai 2 un R<sup>13</sup> ir alkilgrupa.

18. Savienojums saskaņā ar 17. pretenziju, kur R<sup>14</sup> ir metilgrupa, etilgrupa vai -S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>; t ir 2 un R<sup>13</sup> ir metilgrupa.

19. Savienojums saskaņā ar 15. pretenziju, kur savienojumam ir formula (V):



(V)

kur K ir  $-\text{O}(\text{CH}_2)_q-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_q-$ ,  $-(\text{CH}_2)_q\text{O}-$  vai  $-(\text{CH}_2)_q\text{O}(\text{CH}_2)_q-$ ;

p ir vesels skaitlis no 0 līdz 2;

katrs no q neatkarīgi viens no otra ir vesels skaitlis no 1 līdz 4;

$X^1$  ir  $-\text{N}-$ ;

$X^2$  ir  $-\text{O}-$ ;

Y ir  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{14})-$  vai  $-\text{C}(\text{H})\text{R}^{15}-$ ;

m ir 0, 1 vai 2;

$\text{R}^{14}$  ir ūdeņradis, pēc izvēles aizvietota alkilgrupa,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{SR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}$  vai  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ;

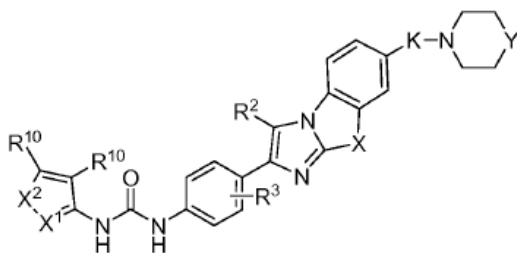
$\text{R}^{15}$  ir ūdeņradis vai pēc izvēles aizvietota alkilgrupa;

$\text{R}^{13}$  ir pēc izvēles aizvietota alkilgrupa; un

t ir 1 vai 2;

vai viens tā stereoizomērs, stereoizomēru maisījums, stereoizomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

20. Savienojums saskaņā ar 19. pretenziju, kur savienojumam ir formula (Va):



kur K ir  $-\text{O}(\text{CH}_2)_q-$ ,  $-(\text{CH}_2)_q\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_q-$  vai  $-(\text{CH}_2)_q\text{O}(\text{CH}_2)_q-$ ;

katrs no q neatkarīgi viens no otra ir no 1 līdz 4;

Y ir  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$  vai  $-\text{N}(\text{R}^{14})-$ ;

$\text{R}^{14}$  ir ūdeņradis, pēc izvēles aizvietota zemāka alkilgrupa vai  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ;

$\text{R}^{13}$  ir zemāka alkilgrupa; un

t ir 1 vai 2;

vai viens tā stereoizomērs, stereoizomēru maisījums, stereoizomēru racēmiskais maisījums, solvāts, hidrāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

21. Savienojums saskaņā ar 14. pretenziju, kur  $\text{R}^1$  ir halogēns, alkilgrupa,  $-\text{R}^6\text{OR}^7$ ,  $-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^7)_2$ ,  $-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^7$ ,  $-\text{R}^6\text{OR}^9\text{OR}^7$ ,  $-\text{R}^6\text{OR}^9\text{N}(\text{R}^7)_2$ ,  $-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)\text{R}^9\text{N}(\text{R}^7)_2$ ,  $-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^9\text{N}(\text{R}^7)\text{R}^9\text{OR}^7$  vai  $-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)\text{R}^9\text{OR}^7$ ; un

$\text{R}^7$  ir ūdeņradis, pēc izvēles aizvietota alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota alkenilgrupa, pēc izvēles aizvietota alkinilgrupa, pēc izvēles aizvietota cikloalkilgrupa, pēc izvēles aizvietota arilgrupa, pēc izvēles aizvietota aralkilgrupa, pēc izvēles aizvietota heterociklilgrupa, pēc izvēles aizvietota heterociklilalkilgrupa, pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa vai pēc izvēles aizvietota heteroaralkilgrupa.

22. Savienojums saskaņā ar 21. pretenziju, kur  $\text{R}^1$  ir fluors, metilgrupa, etilgrupa, hidroksigrupa, metoksigrupa, dietilaminogrupa vai karboksigrupa.

23. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas atlasīts no grupas, kas sastāv no:

3-(2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil}-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-pirolidin-1-iletīl)-propionamīda;

3-(2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil}-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-piperidin-1-iletīl)-propionamīda;

3-(2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil}-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-pirolidin-1-iletīl)-propionamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(4-metilpiperazin-1-il)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-[2-(4-metilpiperazin-1-il)-etoksi]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-(2-piperidin-1-il-etoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(3-morfolin-4-il-propoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-(3-morfolin-4-il-propoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-[3-(4-metilpiperazin-1-il)-propoksi]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

N-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-N'-(4-{7-[3-(4-etilpiperazin-1-il)propil]imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]-fenil]karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(3-morfolin-4-il-3-oksopropil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-1-metil-1-{4-[7-(3-morfolin-4-il-propil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(3-morfolin-4-il-propil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

N-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-N'-(4-{7-(2-morfolin-4-il-etoksi)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]fenil]karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(morfolin-4-il-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

N-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-N'-(4-{7-(3-piperidin-1-il-propil)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]fenil]karbamīda;

N-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-N-(4-{5-(2-morfolin-4-il-etoksi)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]fenil]karbamīda;

2-(2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-morfolin-4-il-etil)-acetamīda;

2-(2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-piperidin-1-il-etil)-acetamīda;

2-(2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-pirolidin-1-il-etil)-acetamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-[2-(4-etilpiperazin-1-il)-2-oksoetil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(morfolin-4-il-metilimidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(4-etilpiperazin-1-il-metil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(piperidin-1-il-metil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-(2-morfolin-4-il-2-oksoetil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(2-morfolin-4-il-etil)-imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(2-piperidin-1-il-etil)-imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-(4-{7-[2-(4-etilpiperazin-1-il)-etil]imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

N-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-N'-(4-{6-(2-morfolin-4-il-etoksi)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]fenil]-karbamīda;

2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-karbonskābes (2-morfolin-4-il-etil)-amīda;

2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-karbonskābes (2-piperidin-1-il-etil)-amīda;

2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-karbonskābes (2-pirolidin-1-il-etil)-amīda;

2-{4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-karbonskābes (2-dietilaminoetil)-amīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(4-etilpiperazīn-1-karbonil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(piperazīn-1-karbonil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-[7-(4-metilpiperazīn-1-karbonil)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il]-fenil]-karbamīda; un

tā farmaceutiski pieņemams sāls; vai atlasīts no grupas, kas sastāv no:

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-(7-hidroksibenzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il)-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-{4-(7-metoksibenzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il)-fenil]-karbamīda;

1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-[4-(7-(2-dietilaminoetoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il)-fenil]-karbamīda;  
 etil{2-[4-(((5-*terc*-butilizoksazol-3-il)amino)karbonil)amino]fenil}imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-7-il]acetāta;  
 3-(2-[4-(((5-*terc*-butilizoksazol-3-il)amino)karbonil)amino]fenil)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-7-il]etiķskābes;  
 pirolidīn-2-karbonskābes 2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-ilestera;  
 etil-3-{2-[4-(((5-*terc*-butilizoksazol-3-il)amino)karbonil)amino]fenil}imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-7-il]propanoāta;  
 3-(2-[4-(((5-*terc*-butilizoksazol-3-il)amino)karbonil)amino]fenil)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-7-il]propānskābes  
 3-(2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N,N-dietilpropionamīda;  
 2-(2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-dietilaminoetil)-acetamīda;  
 3-(2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-il)-N-(2-dietilaminoetil)-propionamīda;  
 2-amino-3-metil-sviestskābes 2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-ilestera;  
 2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-karbonskābes etilestera;  
 2-[4-[3-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-ureīd]-fenil]-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-7-karbonskābes; un  
 tā farmaceitiski pieņemams sāls; vai  
 atlasīts no grupas, kas sastāv no:  
 1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-[4-(7-fluorbenzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il)-fenil]-karbamīda;  
 1-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-3-[4-(7-metilbenzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il)-fenil]-karbamīda; un  
 tā farmaceitiski pieņemams sāls; vai  
 atlasīts no grupas, kas sastāv no:  
 1-(4-*terc*-butilfenil)-3-[4-(7-(2-morfolin-4-il-etoksi)-benzo[d]imidazo[2,1-b]tiazol-2-il)-fenil]-karbamīda; un  
 tā farmaceitiski pieņemams sāls.

24. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ir N-(5-*terc*-butilizoksazol-3-il)-N'-{4-[7-(2-morfolin-4-il-etoksi)imidazo[2,1-b][1,3]benzotiazol-2-il]fenil]karbamīds vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

25. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 24. pretenzijai izmantošanai proliferatīvas slimības ārstēšanā, kur proliferatīvā slimība pēc izvēles ir akūta mieloīda leukēmija, hroniska mieloīda leukēmija, vairogdziedzera vēzis, kuņģa vēzis, gastrointestināls stromas audzējs, resnās zarnas vēzis, priekšdziedzera vēzis, krūts vēzis, olnīcu vēzis, aizkuņģa dziedzera vēzis, plaušu vēzis, nesīkšūnu plaušu vēzis, limfoma vai mieloma, vai kur proliferatīvā slimība pēc izvēles ir akūta limfoblastiska leukēmija, mielodisplastiskais sindroms, mielodisplastiska leukēmija, sīkšūnu plaušu vēzis, glioblastoma, melanoma, nieru šūnu karcinoma, endometrija vēzis, idiopātiskais hipereozinofīlais sindroms, hronisks eozinofīlais sindroms, sistēmiskā mastocitoze, Langerhansa šūnu histiocitoze, Kapoši sarkoma vai multipla endokrīnā neoplāzija; vai izmantošanai autoimūnās slimības ārstēšanā, kur autoimūnā slimība pēc izvēles ir reimatoīdais artrīts, vilkēde, multiplā skleroze, tireoidīts, 1. tipa diabēts, sarkoidoze, zarnu trakta iekaisuma slimība, Krona slimība vai sistēmiskā vilkēde; vai izmantošanai iekaisuma slimības ārstēšanā, kur iekaisuma slimība pēc izvēles ir ulceratīvais kolīts, alerģiskais rinīts, astma vai hroniska obstruktīva plaušu slimība.

26. Kompozīcija, kas satur efektīvu daudzumu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 24. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju, papildvielu vai atšķaidītāju; kompozīcija papildus pēc izvēles satur otru terapeitisku līdzekli, atlasītu no antiproliferatīva līdzekļa, pretiekaisuma līdzekļa, imūnmodulējoša līdzekļa vai imūnsupresīva līdzekļa.

- (31) 10642007 (32) 03.07.2007 (33) CH  
 (73) cim technologie ag, Gubelstrasse 28, 8050 Zürich, CH  
 Andreoli Bruno, APS Beratung, Schwarzbachstrasse 36, 8713 Uerikon, CH  
 (72) SEGLIAS, Werner, CH  
 ANDREOLI, Bruno, CH  
 (74) Rüedi, Regula Béatrice, E. Blum & Co. AG, Patent- und Markenanwälte VSP, Vorderberg 11, CH-8044 Zürich, CH  
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
 (54) **PANĒMIENS UN IERĪCE PĀRKARSĒTA SILTUMNESĒJA RAŽOŠANAI**  
**METHOD AND DEVICE FOR GENERATING AN OVER-HEATED MEDIUM**

(57) 1. Iekārta pārkarsētas vides, it īpaši tvaika, ražošanai ar siltuma pārneses vides palīdzību, kas aprīkota ar padeves līdzekli (1) kurināmā padevei uz krāsni (2) un tvaika ģeneratoru (3), kas plūsmas virzienā ir savienots ar krāsni siltuma pārnesi no karstajām izplūdes gāzēm, kas rodas degšanas laikā, uz siltumnesēju, kas plūst cauri tvaika ģeneratoram (3), kurš ir savienots ar tvaika pārkarsētāju (9), izmantojot siltumnesēja līniju (15) tādā veidā, ka pārkarsētais siltumnesējs, no karsta līdz pat viegli sakarsētam, no tvaika ģeneratora (3) tiek ievadīts tvaika pārkarsētājā (9), kas ar siltumnesēja līnijas (12) palīdzību ir savienots ar krāsni (2) tādā veidā, ka gāzveida siltumnesējs, kas rodas, izmantojot siltummaiņu krāsnī (2), plūst caur minēto līniju (12) uz tvaika pārkarsētāju (9) un tajā kalpo par siltuma avotu vides pārkarsēšanai, pie tam tvaika pārkarsētājs (9) ar līnijas (16) palīdzību ir savienots ar augstspiediena tvaika turbīnu (8) tādā veidā, ka pārkarsētais nesējs, kas atstāj pārkarsētāju (9), kā dzinējspēks tiek aizvadīts uz augstspiediena tvaika turbīnu (8), turklāt iekārta ir pielāgota speciālu degvielu kā kurināmā sadedzināšanai,

raksturīga ar to, ka krāsns (2) satur degkameru, kas ir izveidota būtībā no ugunsizturīgas keramikas daļām, un ar to, ka degkamas sienās (7), kas ir veidotas no ugunsizturīga materiāla, ir izveidoti kanālveida dobumi (18) gāzveida siltumnesēja pārvadei/pārejai.

2. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir raksturīga ar to, ka krāsns (2) satur degkameru, kas ir izveidota kā galvenā degkammera (19), pēdēdzes kameru (20), dūmvadu (28) un sienas (7), kurās ir izveidoti kanālveida dobumi (18), kas ir izkārtoti paralēli sienu virsmai, pie tam viens to valējais gals ieiet vides sadalītājkānālā (25) priekš siltumnesēja ieplūdes līnijas, bet otrs valējais gals ieiet vides sadalītājkānālā (25) priekš siltumnesēja izplūdes līnijas.

3. Iekārta saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas ir raksturīga ar to, ka dobumi (18) ir izveidoti kā urbumi vai kanāli, vēlams ar nemainīgu, regulāru, it īpaši apaļu šķērsgriezumu.

4. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ir raksturīga ar to, ka krāsns (2) papildus ir aprīkota ar degkamas starpsienu, un ar to, ka degkameru sienu (7b, 7c) un degkameru starpsienu (7a) ugunsizturīgais materiāls ir izdedzūs atgrūdošs keramisks materiāls.

5. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ir raksturīga ar to, ka tā satur vienu vadības ierīci (17a) un/vai otru vadības ierīci (17b), pie kam otrā vadības ierīce (17b) kontrolē siltumnesēja padeves ātrumu kā stipri pārkarsētā nesēja ražošanas funkciju.

6. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ir raksturīga ar to, ka no tvaika ģeneratora (3) plūsmas virzienā nesēja vismaz kāda daļa pa nesēja apvedkanālu (15a) plūst cauri krāsnij (2), lai to sasildītu papildus, opcionāli caur priekšpārkarsētāju (9a), un tikai pēc tam caur pārkarsētāju (9), pie tam vismaz dažas krāsns (2) sienas (7) satur dobumus ar tvaikvadiem (33), kas tajos ir izkārtoti tādā veidā, ka siltumnesējs var plūst apkārt tvaikvadiem.

7. Krāsns (2), kas ir piemērota izmantošanai iekārtā saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam krāsns (2) degkamera būtībā ir izveidota no ugunsizturīgas keramikas daļām un degkamas sienās (7) no ugunsizturīga materiāla ir izveidoti kanālveida dobumi (18), it īpaši dobumi (18), kas ir izkārtoti paralēli degkamas sienu virsmai, pie tam sienas (7) ir izveidotas no sienu elementiem, kuri satur kanālveida dobumus (18) gāzveida siltumnesēja pārvadei/pārejai, un siltumnesēja pievades kanāli (35) stiepjas vienā un tajā pašā virzienā.

- (51) **F23G 5/46**<sup>(200601)</sup> (11) **2011972**  
**F23M 5/08**<sup>(200601)</sup>  
**F22B 1/18**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 08011891.2 (22) 02.07.2008  
 (43) 07.01.2009  
 (45) 31.07.2013



8. Krāsns (2) saskaņā ar 7. pretenziju, kas ir raksturīga ar to, ka degkamerā ir izveidotas starpsienas (7a), kurās ir izveidoti kanālveida dobumi (18) siltumnesēja pārejai, cauri kuriem dūmvadu gāzes tiek virzītas vismaz daļēji meandru veidojošā veidā tā, ka to uzturēšanās laiks krāsnī (2) palielinās un siltumpārnese uz siltumnesēju uzlabojas.

9. Krāsns (2) saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kas ir raksturīga ar to, ka kanālveida dobumi (18) ir ar liešanas paņēmieni izveidoti kanāli vai urbumi ar nemainīgu, regulāru, it īpaši apaļu šķērsgrīzumu.

10. Krāsns (2) saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 9. pretenzijai, kas ir raksturīga ar to, ka keramikajām daļām ir plāksņu forma un minētajām plāksnēm, kas veido degkameras sānu sienas, gala virsmas ir slīpas virzienā uz ārpusi tā, ka kanālveida dobumu (18) sprauslas atveras div- vai trīsdalīgā sadalītājkānālā (25), kas ir izveidots no divām vai trijām keramikām plāksnēm un sadalītāj-elementa (24), kas sadalītājkānālā ar vismaz vienu galu ir savienots ar siltumnesēja ievades cauruļvadu (26) vai siltumnesēja izplūdes cauruļvadu (27).

11. Krāsns (2) saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 10. pretenzijai, kas ir raksturīga ar to, ka vismaz daļa no sienām (7) satur dobumus ar tajos izkārtotiem tvaikvadiem (33).

12. Krāsns (2) saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 11. pretenzijai, kas ir raksturīga ar to, ka ugunsizturīgās keramikas daļas ir izgatavotas no izdedžus atgrūdošas keramikas.

13. Paņēmiens pārkarsēta siltumnesēja, it īpaši tvaika, ražošanai iekārtās saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, it īpaši par kurināmo izmantojot atkritumus, ražošanas pārpalikumus vai biomasu, pie kam minētais nesējs, kas tiek ņemts no pirmā posma (galvenās iekārtas) tvaika ģenerators (3), it īpaši piesātināts tvaiks, mitrs tvaiks vai nedaudz pārkarsēts tvaiks, tiek aizvadīts uz otrā posma (sekundārās iekārtas) pārkarsētāju (9) un tur pārkarsēts, izmantojot pārkarsētāju (9), un tad padots uz augstspiediena tvaika turbīnu (8) enerģijas ražošanai, kas ir raksturīgs ar to, ka pārkarsētājs tiek padots vai ievadīts ar gāzveida siltumnesēju, kas tiek sakarsēts krāsns (2) dobumos (18).

14. Paņēmiens saskaņā ar 13. pretenziju, kas ir raksturīgs ar to, ka tvaika ģenerators (3) un pārkarsētājs (9) tiek savā starpā savienoti ar recirkulācijas gāzveida siltumnesēju.

15. Paņēmiens saskaņā ar 14. pretenziju, kas ir raksturīgs ar to, ka recirkulācijas gāzveida siltumnesējs ir gaiss vai tvaiks.

16. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 15. pretenzijai, kas ir raksturīgs ar to, ka degkameras sienas (7) tiek atdzesētas līdz temperatūrai, kas zemāka par pelnu kušanas temperatūru, izmantojot gāzveida siltumnesēju, kas cirkulē degkameras sienu (7) dobumos (18).

17. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 16. pretenzijai, kas ir raksturīgs ar to, ka no tvaika ģenerators (3) plūsmas virzienā vismaz daļa nesēja pa nesēja apvedkanālu (15a) plūst cauri krāsnij (2) papildu sildīšanai, opcionali caur priekšpārkarsētāju (9a), un tikai pēc tam tiek ievadīts pārkarsētājā (9).

18. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 17. pretenzijai, kas ir raksturīgs ar to, ka sākumstadijā tiek izmantots siltumnesējs, kas ir gāze istabas temperatūrā, vēlams gaiss, un ar to, ka siltumnesējs tiek uzkaršēts, vēlams vismaz līdz 600°C, kā arī ar to, ka kā siltumnesējs tiek izmantots mitrs tvaiks, piesātināts tvaiks vai iepriekš pārkarsēts tvaiks, kas plūst no tvaika ģenerators (3), pārkarsēšanai pārkarsētājā (9) līdz pāri par 520°C, un bez tam ar to, ka gāzveida siltumnesējs nepārtraukti ar tvaiku pa nesēja padeves līniju (14) tiek novirzīts atpakaļ vai sajaukts ar tvaiku vai citu siltumnesēju, pie kam nesējs, kas ir gāze istabas temperatūrā, no siltumnesēja kontūra tiek aizvadīts pa nesēja aizplūdes līniju (13).

19. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 18. pretenzijai, kas ir raksturīgs ar to, ka beigu stadijā tvaiks, kas tiek izmantots kā siltumnesējs, pa nesēja padeves līniju (14) tiek aizstāts ar siltumnesēju, kas ir gāze istabas temperatūrā, un tvaiks no siltumnesēja kontūra tiek aizvadīts pa nesēja aizplūdes līniju (13).

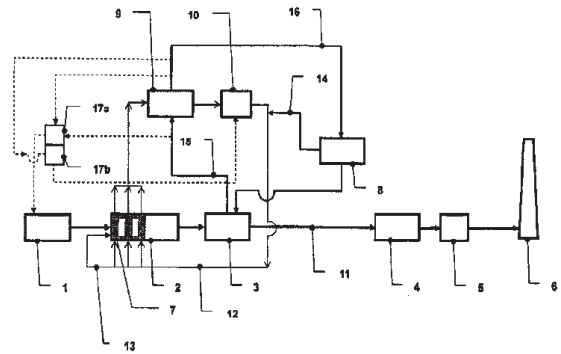


Fig. 1

- (51) **G01S 5/14<sup>(200601)</sup>** (11) **2012136**  
**G01C 21/00<sup>(200601)</sup>**  
**G08G 1/005<sup>(200601)</sup>**
- (21) 07740820.1 (22) 02.04.2007  
(43) 07.01.2009  
(45) 22.05.2013  
(31) 2006103213 (32) 04.04.2006 (33) JP  
(86) PCT/JP2007/057384 02.04.2007  
(87) WO2007/119645 25.10.2007  
(73) GNSS Technologies Inc., 6-12-5, Shinjuku, Shinjuku-ku, Tokyo 160-0022, JP  
(72) TORIMOTO, Hideyuki, JP  
ISHII, Makoto, JP  
ASAKO, Masahiro, JP  
KOGURE, Satoshi, JP  
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Anwaltssozietāt, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE  
Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV  
(54) **POZICIONĒJOŠU INFORMĀCIJU NODROŠINOŠĀ SISTĒMA, POZICIONĒJOŠU INFORMĀCIJU NODROŠINOŠS APARĀTS UN RAIDĪTĀJS**  
**POSITIONAL INFORMATION PROVIDING SYSTEM, POSITIONAL INFORMATION PROVIDING APPARATUS AND TRANSMITTER**
- (57) 1. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts (100) pozicionējošas informācijas nodrošināšanai, kas satur:  
- uztvērējbloku (402), kas pielāgots izkliedēta spektra pozicionēšanas signāla uztveršanai no iekštelpu raidītāja (200-1) vai no satelīta (110, 111, 112, 113);  
- atmiņas bloku (420), kas pielāgots daudzu izkliedēta spektra pozicionēšanas signāla kodu modeļu uzglabāšanai;  
- precizēšanas bloku (412), kas pielāgots, lai no daudzajiem otrajā atmiņas blokā esošajiem koda modeļiem precizētu koda modeli, kas ir ticis lietots no uztvērējbloka saņemtā izkliedēta spektra pozicionēšanas signāla izvērsei,  
pie kam aparāts ir raksturīgs ar to, ka papildus satur noteikšanas bloku (416), kas ir pielāgots, lai:  
noteiktu izstarošanas avotu saņemtajam izkliedētā spektra pozicionēšanas signālam, kas balstīts uz noteiktu koda modeli, pārraidītu datus, kas iegūti no uztvertā izkliedētā spektra pozicionēšanas signāla, uz ārpusē esošu pozicionēšanas bloku (432) gadījumos, kad satelīts ir noteikts kā izstarojuma avots, un pārraidītu datus, kas iegūti no uztvertā izkliedētā spektra pozicionēšanas signāla, uz iekšējā esošu pozicionēšanas bloku (434) gadījumos, kad iekšējais raidītājs ir noteikts kā izstarojuma avots, pie kam:  
ārpusē esošais pozicionēšanas bloks ir pielāgots, lai aprēķinātu pozicionējošās informācijas aparāta pozicionējošo informāciju, kas balstīta uz datiem, kas saņemti no noteikšanas bloka gadījumos, kad noteikšanas bloks nosaka, ka izstarojuma avots ir satelīts, pie tam ārpusē esošais pozicionēšanas bloks ir papildus pielāgots pozicionējošas informācijas padevei uz izejas bloku (440);  
iekšējais pozicionēšanas bloks ir pielāgots, lai iegūtu informāciju par iekšējais raidītāja atrašanās vietu no datiem, kas saņemti no



noteikšanas bloka, un lai lietotu iegūto informāciju kā pozicionējošās informācijas aparāta pozicionējošo informāciju gadījumos, kad noteikšanas bloks nosaka, ka izstarojuma avots ir iekštelpas raidītājs, pie tam iekštelpas pozicionēšanas bloks ir papildus pielāgots pozicionējošās informācijas padevei uz izejas bloku, izejas bloks ir pielāgots, lai izdotu saņemto pozicionējošo informāciju.

2. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam iekštelpas pozicionēšanas bloks ir papildus pielāgots, lai iegūto informāciju lietotu kā pozicionējošās informācijas aparāta pozicionējošo informāciju, kad ir saņemts atsevišķa minētā iekštelpas raidītāja pārraidītais izkliedēta spektra pozicionēšanas signāls.

3. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam ar iekštelpas raidītāju pārraidītajam minētajam izkliedēta spektra pozicionēšanas signālam ir formāts, kas ir līdzīgs satelīta raidītajam izkliedēta spektra pozicionēšanas signālam, un kā navigācijas ziņojumu satur minētos pozicionējošos datus, kas ietverti satelīta raidītajā minētajā izkliedētā spektra pozicionēšanas signālā, pie tam ārpusē esošais pozicionēšanas bloks (432) papildus ir pielāgots, lai izskaitļotu minētā pozicionējošu informāciju nodrošinošā aparāta pozīciju, balstoties uz katru minēto navigācijas ziņojumu, kad no vairākiem satelītiem tiek saņemti vairāki minētie izkliedēta spektra pozicionēšanas signāli.

4. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētie pozicionējošie dati ir dati, kas tieši norāda minētā iekštelpas uztvērēja pozīciju, izmantojot tikai minētos pozicionējošos datus, un minētais izejas bloks papildus ir pielāgots, lai izdotu minēto pozicionējošo informāciju, kas iegūta tikai no minētajiem pozicionējošiem datiem, kā attēlu, kas attēlo izmērīto pozīciju.

5. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētais izejas bloks papildus satur attēlošanas bloku, kas pielāgots, lai, balstoties uz minēto pozicionējošo informāciju, attēlotu vietu, kur ir iebūvēts minētais iekštelpas raidītājs.

6. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētais precizēšanas bloks ietver vairākus korelatorus (1070), kas ir nodrošināti visiem minētajiem izkliedēta spektra pozicionēšanas signāliem, kuri tiek saņemti no iekštelpas uztvērēja un no satelīta, un ir pielāgoti, lai starp minētajiem vairākiem kodu modeļiem un minētajiem izkliedētā spektra pozicionēšanas signāliem paralēli vienam pret otru veiktu korelācijas procesu, precizējot minēto koda modeli.

7. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam:

minētais uztveršanas bloks ir pielāgots, lai saņemtu vairākus izkliedēta spektra pozicionēšanas signālus, kas raidīti no vairākiem iekštelpas raidītājiem, kuri ir iebūvēti vairākās iepriekš noteiktās atrašanās vietās,

minētais pozicionējošu informāciju nodrošinošais aparāts papildus satur bloku, kas ir pielāgots, lai atklātu minētajā uztvērējblokā saņemto izkliedēta spektra pozicionēšanas signāla intensitāti,

minētais atklāšanas bloks ir papildus pielāgots, lai starp minētajiem izkliedēta spektra pozicionēšanas signāliem, kas saņemti no vairākiem iekštelpas raidītājiem, precizētu vienu minēto izkliedēta spektra pozicionēšanas signālu, kuram ir visaugstākā minētā intensitāte, un papildus ir pielāgots, lai iegūtu pozicionējošos datus, kas ietverti precizētajā izkliedēta spektra pozicionēšanas signālā.

8. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētie pozicionējošie dati ietver identifikācijas datus minētā raidītāja identificēšanai, un minētais pozicionējošu informāciju nodrošinošais aparāts papildus satur:

- raidīšanas bloku, kas ir pielāgots, lai caur komunikācijas līniju, no iekštelpas raidītāja saņemot minēto izkliedēta spektra pozicionēšanas signālu, pārraidītu minētos identifikācijas datus un minētā iekštelpas raidītāja pozicionējošās informācijas pārraides pieprasījumu uz serveri, kas, atbildot uz ārēju pieprasījumu, nodrošina pozicionējošo informāciju, pie tam minētajā serverī, saistot vienu pret otru, ir uzglabāti minētā pozicionējošā informācija un minētie identifikācijas dati, un

- ieejas bloku, kas ir pielāgots, lai saņemtu minēto pozicionējošo informāciju, kas pārraidīta ar minētā servera palīdzību, balstoties uz minēto pārraides pieprasījumu, kas nācis caur minēto komunikācijas līniju, pie tam minētais izejas bloks papildus satur displeja bloku minētās pozicionējošās informācijas attēlošanai.

9. Pozicionējošu informāciju nodrošinošs aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur jebkādu portatīvu telefonu, portatīvu informācijas termināli, portatīvu pozicionēšanas aparātu un transportlīdzeklī iebūvētu pozicionēšanas sistēmu.

10. Pozicionējošu informāciju nodrošinoša sistēma pozicionējošās informācijas nodrošināšanai, izmantojot no satelīta (110, 111, 112, 113) vai no iekštelpas raidītāja (200-1) nākušo izkliedēta spektra pozicionēšanas signālu, pie kam pozicionējošo informāciju nodrošinošā sistēma satur:

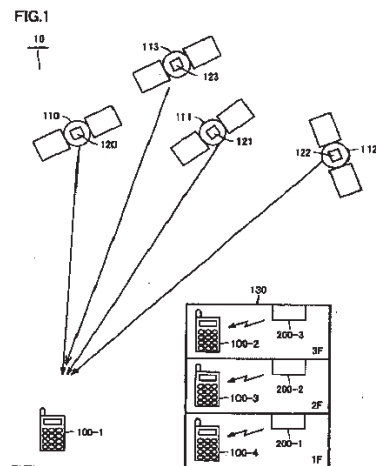
- iekštelpas raidītāju (200-1) tāda paša formāta izkliedēta spektra pozicionēšanas signāla pārraidīšanai kā satelīta raidītais izkliedēta spektra pozicionēšanas signāls, pie kam iekštelpas raidītājs satur:
  - atmiņas bloku (240), kas pielāgots, lai uzglabātu pozicionējošos datus, kas precīzē iebūvētā iekštelpas raidītāja atrašanās vietu,
  - ģenerēšanas bloku (210), kas pielāgots, lai ģenerētu izkliedēta spektra pozicionēšanas signālu, ieskaitot minētos pozicionējošos datus, un
  - pārraidīšanas bloku (292), kas pielāgots, lai pārraidītu minēto izkliedēta spektra pozicionēšanas signālu, pie kam:

- minētajam izkliedētā spektra pozicionēšanas signālam navigācijas ziņojuma vietā, kas iekļauts no satelīta nākošajā izkliedētā spektra pozicionēšanas signālā, ir minētie pozicionējošie dati, un ar minētā izkliedētā spektra pozicionēšanas signāla palīdzību norāda atsevišķa minētā iekštelpas raidītāja minēto atrašanās vietu,

- koda struktūra, kuru lieto ģenerētajam izkliedētā spektra pozicionēšanas signālam, norāda pozicionējošās informācijas nodrošinošajam aparātam, ka izkliedētā spektra pozicionēšanas signālu ir nosūtījis iekštelpas raidītājs;

- informāciju nodrošinošo aparātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai.

11. Pozicionējošu informāciju nodrošinoša sistēma saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam minētā kodētā pozicionējošā signāla centrālā frekvence ir 1575,42 MHz un iekštelpas raidītāja minētā izkliedētā spektra pozicionējošā signāla izkliedētā frekvence ir 1,023 MHz.



(51) **A61K 38/18**<sup>(200601)</sup> (11) **2012814**  
**A61K 39/395**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 37/00**<sup>(200601)</sup>  
**C07K 16/28**<sup>(200601)</sup>

(21) 07760469.2 (22) 11.04.2007  
(43) 14.01.2009  
(45) 22.05.2013  
(31) 744713 P (32) 12.04.2006 (33) US  
(86) PCT/US2007/066416 11.04.2007  
(87) WO2007/121233 25.10.2007  
(73) GENZYME CORPORATION, 500 Kendall Street, Cambridge, MA 02142, US  
(72) KAPLAN, Johanne, US  
MCPHERSON, John, M., US  
(74) Adams, Harvey Vaughan John, et al, Mathys & Squire LLP, 120 Holborn, London EC1N 2SQ, GB  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **METODES AUTOIMŪNO SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**  
**METHODS OF TREATING AUTOIMMUNE DISEASES**

(57) 1. Latenta TGF-β1 izmantošana, ražojot medikamentu sarkanās vilkēdes ārstēšanai zīdītājam, pie kam ārstēšanas laikā:  
 (a) sašķeljot cirkulējošos limfocītus zīdītājā, ievadot antitimocītu antivielu,  
 (b) ļauj limfocītiem uzsākt populācijas atjaunošanu un  
 (c) populācijas atjaunošanas fāzes (b) laikā zīdītājam ievada medikamentu.

2. Kompozīcija, kas satur latentu TGF-β1, izmantošanai sarkanās vilkēdes ārstēšanai zīdītājam, pie kam ārstēšanas laikā:  
 (a) sašķeljot cirkulējošos limfocītus zīdītājā, ievadot antitimocītu antivielu,  
 (b) ļauj limfocītiem uzsākt populācijas atjaunošanu un  
 (c) populācijas atjaunošanas fāzes (b) laikā zīdītājam ievada kompozīciju.

3. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju vai kompozīcijas saskaņā ar 2. pretenziju izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam limfocīti, kuri tiek sašķelti, galvenokārt ir T šūnas.

4. Izmantošana saskaņā ar 1. vai 3. pretenziju vai kompozīcija saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, pie kam latentais TGF-β1 satur nobriedušu TGF-β1 un:  
 (a) ar latentumu saistītu peptīdu (LAP) vai  
 (b) ar latentumu saistītu peptīdu un latento TGF-β saistošu proteīnu (LTBP).

5. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1., 3. vai 4. pretenzijas vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 4. pretenzijai izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 4. pretenzijai, pie kam latentais TGF-β1 ir jāievada sistēmiski.

6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1., 3., 4. vai 5. pretenzijas vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 5. pretenzijai izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 5. pretenzijai, pie kam zīdītājs ir cilvēks.

7. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1., 3., 4., 5. vai 6. pretenzijas vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai, pie kam zīdītājam ir traucēta nieru funkcija un ārstēšanas rezultāts ir zīdītāja nieru funkcijas zušanas palēnināšana vai nieru funkcijas saglabāšana, vai uzlabošana.

8. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1., 3., 4., 5. vai 6. pretenzijas vai kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai, pie kam uz nieru funkcijas zušanas palēnināšanos vai nieru funkcijas uzlabošanu norāda sistēmiskas asins spiediena izmaiņas, proteīnūrija, albuminūrija, glomerulārās filtrācijas ātrums un/vai renālās asins plūsma.

9. Antitimocītu antivielas izmantošana, ražojot medikamentu sarkanās vilkēdes ārstēšanai zīdītājam, pie kam minētās ārstēšanas laikā:  
 (a) sašķeljot cirkulējošos limfocītus zīdītājā, ievadot medikamentu,  
 (b) ļauj limfocītiem uzsākt populācijas atjaunošanu un  
 (c) populācijas atjaunošanas fāzes (b) laikā zīdītājam ievada latento TGF-β1.

10. Antitimocītu antivielas izmantošana, ražojot medikamentu sarkanās vilkēdes ārstēšanai zīdītājam, pie kam minētās ārstēšanas laikā:  
 (a) sašķeljot cirkulējošos limfocītus zīdītājā, ievadot pretvielu,  
 (b) ļauj limfocītiem uzsākt populācijas atjaunošanu un  
 (c) populācijas atjaunošanas fāzes (b) laikā zīdītājam ievada latento TGF-β1.

(72) SCHWARTZ, Jean-Charles, FR  
 LECOMTE, Jeanne-Marie, FR

(74) Blot, Philippe Robert Emile, Cabinet Lavoix 2, place d'Estienne d'Orves, 75441 Paris Cedex 09, FR  
 Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV

(54) **JAUNA RACEKADOTRILA IEVADĪŠANAS FORMA**  
**NEW FORM OF ADMINISTRATION OF RACECADOTRIL**

(57) 1. Racekadotrila tabletes, kas satur kodolu ar pārklājumu, pie kam minētais kodols satur racekadotrīlu, pie kam kodols satur masas %:  
 - 20 līdz 50 % racekadotrila,  
 - 20 līdz 40 % laktozes monohidrāta,  
 - 7 līdz 15 % kalcija karmelozes,  
 - 2 līdz 10 % preželatinizētas cietes;  
 - 0,5 līdz 5 % magnija stearāta.

2. Racekadotrila tablete saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētā tablete satur no 170 līdz 180 mg racekadotrila.

3. Tablete saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas satur 175 mg racekadotrila tablete.

4. Tablete saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam kodols satur:  
 - 175 mg racekadotrila,  
 - 144,1 mg laktozes monohidrāta,  
 - 41 mg kalcija karmelozes,  
 - 8 mg hidroksipropilcelulozes,  
 - 32,5 mg mikrokristāliskās celulozes,  
 - 25 mg preželatinizētas cietes,  
 - 4,4 mg magnija stearāta.

5. Racekadotrila tabletes saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām pagatavošana, kas ietver etapus: 1) kodola pagatavošana, kas satur racekadotrīlu, 2) minētā kodola pārklāšana.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam etaps 1) ietver:  
 (I) granulēšanu,  
 (II) iegūto granulu žāvēšanu,  
 (III) ārējās fāzes pievienošanu un maisīšanu,  
 (IV) galīgā maisījuma saspiešanu.

7. Racekadotrila tablete, kas satur kodolu ar pārklājumu, pie kam minētais kodols satur racekadotrīlu, izmantošanai caurejas ārstēšanā, ievadot minēto tableti divreiz dienā.

8. Racekadotrila tablete izmantošanai saskaņā ar 7. pretenziju, pie kam tablete satur no 170 līdz 180 mg racekadotrila.

9. Tablete izmantošanai saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kas satur 175 mg racekadotrila.

10. Tablete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 9. pretenzijai, kas satur 20 līdz 50 masas % racekadotrila.

11. Tablete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 10. pretenzijai, pie kam minētais kodols satur vēl bez racekadotrila vienu vai vairākas palīgvielas, kas izvēlētas no pildvielas(-ām), saistvielas(-ām), irdinātāja(-iem), smērvielas(-ām).

12. Tablete izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam pildviela vai pildvielas ir izvēlētas no laktozes monohidrāta, mikrokristāliskās celulozes, mannitola, sorbitola.

13. Tablete izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam saistvielas ir izvēlētas no hidroksipropilcelulozes, polividona.

14. Tablete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 13. pretenzijai, pie kam pārklājums ir veidots no vienas vai vairākām palīgvielām, kas izvēlētas no viskozitātes palielināšanas līdzekļiem, blāvētājiem, hidrofilēm plastifikatoriem un krāsojošiem blāvētājiem.

15. Tablete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 14. pretenzijai, pie kam kodols satur masas %:  
 - 20 līdz 50 % racekadotrila,  
 - 25 līdz 50 % pildvielas(-u),  
 - 9 līdz 25 % irdinātāja(-u),  
 - 2 līdz 10 % saistvielas(-u),  
 - 0,5 līdz 5 % smērvielas(-u).

16. Tablete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 15. pretenzijai, pie kam kodols satur masas %:  
 - 20 līdz 50 % racekadotrila,  
 - 20 līdz 40 % laktozes monohidrāta,  
 - 7 līdz 15 % kalcija karmelozes,  
 - 2 līdz 10 % hidroksipropilcelulozes,  
 - 5 līdz 10 % mikrokristāliskās celulozes,

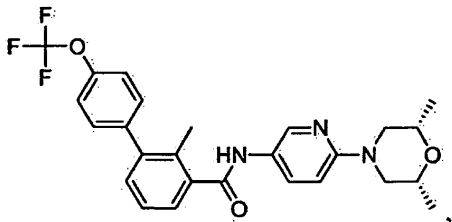
(51) **A61K 9/20**<sup>(200601)</sup> (11) **2018158**  
**A61K 9/28**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/223**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 1/12**<sup>(200601)</sup>

(21) 07731453.2 (22) 14.05.2007  
 (43) 28.01.2009  
 (45) 24.04.2013  
 (31) 0604302 (32) 15.05.2006 (33) FR  
 (86) PCT/FR2007/000814 14.05.2007  
 (87) WO2007/132091 22.11.2007  
 (73) BIOPROJET, 30, rue des Francs-Bourgeois, 75003 Paris, FR

- 2 līdz 10 % preželatinizētas cietes;
  - 0,5 līdz 5 % magnija stearāta.
17. Tablete izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 16. pretenzijai, pie kam kodols satur:
- 175 mg racekadotriļa,
  - 144,1 mg laktozes monohidrāta,
  - 41 mg kalcija karmelozes,
  - 18 mg hidroksipropilcelulozes,
  - 32,5 mg mikrokristāliskās celulozes,
  - 25 mg preželatinizētas cietes,
  - 4,4 mg magnija stearāta.

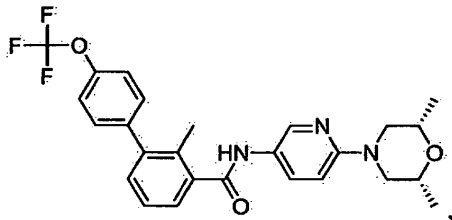
- (51) **C07D 413/04**<sup>(200601)</sup> (11) **2021328**  
 (21) 07761921.1 (22) 04.05.2007  
 (43) 11.02.2009  
 (45) 03.04.2013  
 (31) 797949 P (32) 05.05.2006 (33) US  
 (86) PCT/US2007/068292 04.05.2007  
 (87) WO2007/131201 15.11.2007  
 (73) IRM LLC, Hurst Holme, 12 Trott Road, Hamilton, HM 11, BM  
 (72) GAO, Wenqi, US  
 JIANG, Jiqing, US  
 WAN, Yongqin, US  
 CHENG, Dai, US  
 HAN, Dong, US  
 WU, Xu, US  
 PAN, Shifeng, US  
 (74) Leon, Susanna Iris, Novartis Pharma AG, Forum 1, Novartis  
 Campus, 4056 Basel, CH  
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082,  
 LV  
 (54) **SAVINOJUMI UN KOMPOZĪCIJAS KĀ HEDŽHOGA  
 SIGNĀLCEĻA MODULATORI  
 COMPOUNDS AND COMPOSITIONS AS HEDGEHOG  
 PATHWAY MODULATORS**

(57) 1. Savienojums N-(6-((2R,6S)-2,6-dimetilmorfolīn)piridin-3-il)-2-metil-4'-(trifluormetoksi)bifenil-3-karboksamīds ar formulu:



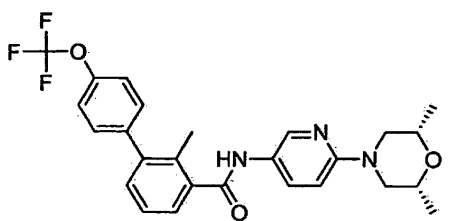
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, hidrāts vai solvāts.

2. Savienojums N-(6-((2R,6S)-2,6-dimetilmorfolīn)piridin-3-il)-2-metil-4'-(trifluormetoksi)bifenil-3-karboksamīds ar formulu:

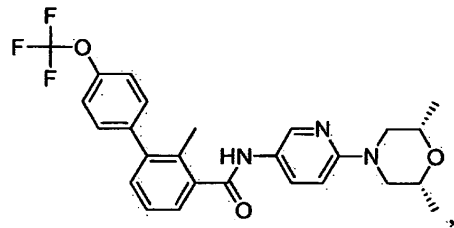


vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

3. Savienojums N-(6-((2R,6S)-2,6-dimetilmorfolīn)piridin-3-il)-2-metil-4'-(trifluormetoksi)bifenil-3-karboksamīds ar formulu:

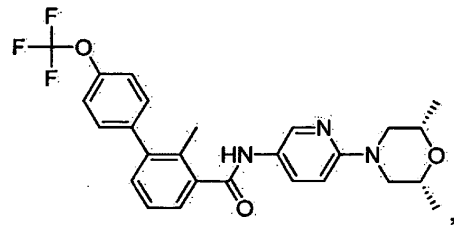


4. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu N-(6-((2R,6S)-2,6-dimetilmorfolīn)piridin-3-il)-2-metil-4'-(trifluormetoksi)bifenil-3-karboksamīdu ar formulu:



brīvā formā vai farmaceutiski pieņemama sāls formā saistībā ar vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu nesēju vai šķīdinātāju.

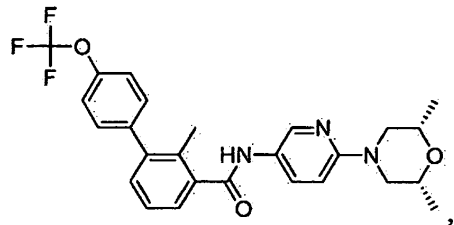
5. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski iedarbīgu savienojuma N-(6-((2R,6S)-2,6-dimetilmorfolīn)piridin-3-il)-2-metil-4'-(trifluormetoksi)bifenil-3-karboksamīda ar formulu:



vai tā farmaceutiski pieņemama sāls daudzumu kombinācijā ar vienu vai vairākiem terapeitiskiem līdzekļiem.

6. Farmaceutiska kombinācija saskaņā ar 5. pretenziju, kur papildu terapeitiskais līdzeklis ir izvēlēts no imūnmodulatora, pretiekaisuma vielām vai citiem pretaudzēju terapeitiskiem līdzekļiem.

7. Savienojums N-(6-((2R,6S)-2,6-dimetilmorfolīn)piridin-3-il)-2-metil-4'-(trifluormetoksi)bifenil-3-karboksamīds ar formulu:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai aizkuņģa dziedzera vēža, prostatas vēža, medulāras blastomas, pamatsēnu karcinomas un sīkšūnu plaušu vēža ārstēšanā.

- (51) **C07D 209/16**<sup>(200601)</sup> (11) **2032533**  
 (21) 07784350.6 (22) 07.06.2007  
 (43) 11.03.2009  
 (45) 03.04.2013  
 (31) 804527 P (32) 12.06.2006 (33) US  
 867878 P 30.11.2006 US  
 (86) PCT/US2007/070564 07.06.2007  
 (87) WO2007/146718 21.12.2007  
 (73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH  
 Novartis Pharma GmbH, Brunner Strasse 59, 1230 Wien, AT  
 (72) ACEMOGLU, Murat, CH  
 BAJWA, Joginder, S., US  
 PARKER, David, John, US  
 SLADE, Joel, US  
 (74) Roth, Peter Richard, Novartis Pharma AG, Patent Department,  
 4002 Basel, CH  
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082,  
 LV  
 (54) **PROCESS N-HIDROKSI-3-[4-[[[2-(2-METIL-1H-INDOL-3-IL)ETIL]AMINO]METIL]FENIL]-2-E-2-PROPĒNAMĪDA IEGŪŠANAI UN PAREDZĒTIE PALAIDES MATERIĀLI**

**PROCESS FOR MAKING N-HYDROXY-3-[4-[[[2-(2-METHYL-1H-INDOL-3-YL)ETHYL]AMINO]METHYL]PHENYL]-2E-2-PROPENAMIDE AND STARTING MATERIALS THEREFOR**

(57) 1. Metode N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīda iegūšanai, kas satur posmus, kuros:

(a) savieno nātrija hidroksīdu un (E)-3-(4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)-etilamino]-metil]-fenil]-akrilskābes metilestera hidrohlorīda sāli, lai iegūtu maisījumu temperatūrā, zemākā par aptuveni -10°C; un pēc tam

(b) maisījumam pievieno hidroksilamīnu, lai iegūtu N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīdu.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur temperatūra (a) posmā ir zemāka par aptuveni -15°C.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur (E)-3-(4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)-etilamino]-metil]-fenil]-akrilskābes metilestera hidrohlorīda sāls tiek pagatavots kā suspensija metanolā.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur nātrija hidroksīds ir metanola šķīduma formā.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur nātrija hidroksīdu pievieno (E)-3-(4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)-etilamino]-metil]-fenil]-akrilskābes metilestera hidrohlorīda sālim ilgāk nekā aptuveni 30 minūtes.

6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur nātrija hidroksīdu izmanto daudzumā aptuveni no 2,5 līdz 3,5 ekvivalentiem.

7. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur pielietotais hidroksilamīns ir ūdens šķīduma formā.

8. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur hidroksilamīnu izmanto daudzumā aptuveni no 4 līdz 13 ekvivalentiem.

9. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur hidroksilamīnu maisījumam pievieno ilgāk nekā aptuveni 30 minūtes.

10. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur posmu, kurā (a) posma temperatūrā veic maisīšanu līdz reakcijas norises galam vai daļējam galam.

11. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur (c) posmu, kurā veic N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīda kristalizāciju.

12. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, kur (c) posms satur apakšposmus, kuros:

(c1) uzsilda reakcijas maisījumu, kas iegūts (b) posmā;

(c2) samaisa reakcijas maisījumu;

(c3) reakcijas maisījumam pievieno ūdeni;

(c4) reakcijas maisījumu filtrē, lai iegūtu filtrātu;

(c5) filtrāta pH regulē līdz pH no aptuveni 10 līdz 11;

(c6) filtrātam pievieno N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīda kristalizācijas aizmetņus;

(c7) filtrātu samaisa, līdz suspensijas iegūšanai;

(c8) suspensijas pH noregulē līdz pH no aptuveni 8,5 līdz 9; un

(c9) samaisa suspensiju.

13. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, kur visus apakšposmus no (c1) līdz (c9) veic temperatūrā, kas iegūta, veicot uzsildīšanu (c1) posmā.

14. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, kur reakcijas maisījumu uzsilda līdz temperatūrai no aptuveni 0°C līdz 25°C.

15. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, kur apakšposmus (c1) un (c2) atkārtoti, lai panāktu pakāpenisku uzsildīšanu.

16. Metode saskaņā ar 12. pretenziju, kur apakšposmā (c5) filtrāta pH regulē līdz pH no aptuveni 10,3 līdz 10,7.

17. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, kas papildus satur posmu (d), kurā atdala N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīdu.

18. Metode saskaņā ar 17. pretenziju, kur (d) posms satur apakšposmus, kuros:

(d1) filtrē posmā (c) kristalizēto N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīdu; un

(d2) žāvē kristalizēto N-hidroksi-3-[4-[[[2-(2-metil-1H-indol-3-il)etil]amino]metil]fenil]-2E-2-propēnamīdu.

19. Metode saskaņā ar 18. pretenziju, kur mazgā apakšposmā (d1) iegūtās pēcfiltrācijas nogulsnes.

(51) **C12N 15/117**<sup>(201001)</sup>  
**C07H 21/00**<sup>(200601)</sup>  
**C12N 7/04**<sup>(200601)</sup>  
**C12N 15/11**<sup>(200601)</sup>

(11) **2032592**

(21) 07764627.1

(22) 12.06.2007

(43) 11.03.2009

(45) 31.07.2013

(31) 812592 P

(32) 12.06.2006 (33) US

PCT/EP2006/069734

14.12.2006 WO

(86) PCT/EP2007/005188

12.06.2007

(87) WO2007/144150

21.12.2007

(73) Cytos Biotechnology AG, Wagistrasse 25, 8952 Zürich-Schlieren, CH

(72) KINZLER, Matthias, CH

PROBA, Karl, CH

(74) Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **PAŅĒMIENI OLIGONUKLEOTĪDU IEPAKOŠANAI VĪRUS-VEIDĪGU RNS BAKTERIOFĀGU DAĻIŅĀS**  
**PROCESSES FOR PACKAGING OLIGONUCLEOTIDES INTO VIRUS-LIKE PARTICLES OF RNA BACTERIOPHAGES**

(57) 1. Paņēmiens nukleotīda kompozīcijas, kas satur oligonukleotīdu, producēšanai, kur minētais paņēmiens ietver šādas stadijas:

(a) oligonukleotīda sagatavošanu šķīdumā I, kur minētais oligonukleotīds satur vismaz vienu poli G garumu; un kur minētajam šķīdumam I ir sārmais pH, kur minētais pH ir labāk 8 līdz 13, vēl labāk minētais pH ir 12;

(b) minētā oligonukleotīda dezagregēšanu, kur minētā dezagregēšana ietver šādas stadijas:

(i) šķīduma I temperatūras regulēšanu līdz temperatūrai I, kur minētā temperatūra I ir 4 līdz 70°C, labāk 45 līdz 70°C, vēl labāk aptuveni 50°C un vislabāk 50°C;

(ii) minētā oligonukleotīda inkubēšanu minētajā šķīdumā I minētajā temperatūrā I, kur minētā inkubēšana tiek veikta, līdz minētais oligonukleotīds satur relatīvo maksimuma-sākuma laiku aptuveni 110 %; un

(iii) minētā šķīduma I temperatūras regulēšanu līdz temperatūrai II, kur minētā temperatūra II ir 0 līdz 70°C, kur, labāk, minētā temperatūra II ir zemāka par temperatūru I un kur, labāk, temperatūra II ir 0 līdz 25°C, vislabāk 0 līdz 2°C,

(c) minētā šķīduma I pH regulēšanu līdz pH 5 līdz 8, kur, labāk, minētā šķīduma I minētā pH minētā regulēšana tiek veikta līdz minētais pH ir 6 līdz 7; un

(d) minētā oligonukleotīda agregāciju, kur minētā agregācija satur šādas stadijas:

(i) minētā oligonukleotīda sagatavošanu šķīdumā II, kur minētais šķīdums II satur pH 5 līdz 8 un vismaz 20 mM kaļjona, kur minētais kaļjons ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no Na<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>, NH<sub>4</sub><sup>+</sup>, Li<sup>+</sup>, Ca<sup>2+</sup> un Mg<sup>2+</sup>; un kur, labāk, minētais šķīdums II satur 200 līdz 275 mM minētā kaļjona, labāk 250 mM;

(ii) šķīduma II temperatūras regulēšanu līdz temperatūrai III, kur minētā temperatūra III ir 50 līdz 99°C, labāk 80 līdz 90°C, vēl labāk aptuveni 85°C un vislabāk 85°C;

(iii) minētā oligonukleotīda inkubēšanu šķīdumā II temperatūrā III, kur minētā inkubēšana tiek veikta, līdz minētais oligonukleotīds satur relatīvo maksimuma-sākuma laiku no 50 līdz 110 %; un

(iv) šķīduma II temperatūras regulēšanu līdz temperatūrai IV, kur minētā temperatūra IV ir zemāka par 50°C, kur, labāk, minētā temperatūra IV ir 0 līdz 25°C, vēl labāk 0 līdz 2°C.

2. Paņēmiens saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, kur minētā šķīduma I minētā temperatūras uzstādīšana līdz temperatūrai II tiek veikta ar temperatūras lineāru izmaiņu vismaz 3,6°C/min un/vai kur šķīduma II minētā temperatūras regulēšana līdz temperatūrai IV tiek veikta ar temperatūras lineāru izmaiņu vismaz 3,6°C/min.

3. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais šķīdums I satur sārmu metāla hidroksīdu, labāk kālija hidroksīdu vai nātrija hidroksīdu, vēl labāk nātrija hidroksīdu, kur minētā hidroksīda koncentrācija ir 10 līdz 200 mM, labāk aptuveni 25 mM, vislabāk 25 mM.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais kaļjons ir Na<sup>+</sup> vai K<sup>+</sup>, kur, labāk, minētais kaļjons ir Na<sup>+</sup>.



5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā oligonukleotīda koncentrācija minētajā šķīdumā I ir 50 µM līdz 2 mM, vislabāk 260 µM un/vai kur minētā oligonukleotīda koncentrācija minētajā šķīdumā II ir 50 µM līdz 2 mM, labāk 100 līdz 300 µM, vislabāk 175 µM.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētā oligonukleotīda minētā inkubēšana šķīdumā II temperatūrā III tiek veikta līdz minētais oligonukleotīds satur relatīvo maksimuma-sākuma laiku no 80 līdz 95 %, labāk no 80 līdz 90 %, tomēr vēl labāk no 83 līdz 90 %, tomēr vēl labāk no 85 līdz 90 % un vislabāk 88 %.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais oligonukleotīds satur pie tā 5' gala vismaz 3 un ne vairāk kā 15 guanozīna struktūras un pie tā 3' gala vismaz 3 un ne vairāk kā 15 guanozīna struktūras un kur, labāk, minētais oligonukleotīds satur palindromisku sekvenci, kur, turklāt labāk, minētā palindromiskā sekvence ir GACGATCGTC (SEQ ID NO: 1) un kur, turklāt vēl labāk, minētais oligonukleotīds satur nukleīnskābes sekvenci, izvēlētu no grupas, kas sastāv no:

- (a) „G4-4” GGGGGACGATCGTCGGGG (SEQ ID NO: 2);
- (b) „G5-5” GGGGGGACGATCGTCGGGGG (SEQ ID NO: 3);
- (c) „G6-6” GGGGGGGACGATCGTCGGGGGG (SEQ ID NO: 4);
- (d) „G7-7” GGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGG (SEQ ID NO: 5);
- (e) „G8-8” GGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGG (SEQ ID NO: 6);
- (f) „G9-9” GGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 7);
- (g) „G10” GGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 8);
- (h) „G11” GGGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 9).

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētajam oligonukleotīdam ir nukleīnskābes sekvence „G10” GGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 8).

9. Paņēmiens kompozīcijas, kas satur (i) vīrusveidīgu daļiņu, kur minētā vīrusveidīgā daļiņa ir vīrusveidīgā RNS bakteriofāga daļiņa un (ii) oligonukleotīdu, kur minētais oligonukleotīds ir iepakots minētajā vīrusveidīgajā daļiņā, producēšanai, kur minētais paņēmiens ietver šādas stadijas:

- (a) minētā RNS bakteriofāga apvalka proteīna sagatavošanu;
- (b) oligonukleotīda sagatavošanu,
- (i) kur minētais oligonukleotīds satur vismaz vienu poli G garumu; un
- (ii) kurā minētais oligonukleotīds satur relatīvo maksimuma-sākuma laiku no 50 līdz 110 %;
- (c) maisījuma ražošanu, kur minētais maisījums satur:
  - (i) minēto apvalka proteīnu, kur labāk minētā apvalka proteīna koncentrācija minētajā maisījumā ir 1 līdz 4 mg/ml, vēl labāk 2,5 mg/ml un/vai kur bez tam labāk minētā oligonukleotīda koncentrācija minētajā maisījumā ir 25 līdz 100 µM, vēl labāk 62,5 µM;
  - (ii) līdzekli, kas spēj ietekmēt minētā apvalka proteīna pašveidošanās aizkavēšanu, kur, labāk, minētais līdzeklis satur denaturizējošu savienojumu, izvēlētu no urīnvielas un guanidīnija hidrohlorīda, kur, turklāt labāk, minētais denaturizējošais savienojums ir urīnviela un kur, vēl labāk, minētās urīnvielas koncentrācija minētajā maisījumā ir 0,25 līdz 7,2 M, labāk 1 M;

(iii) minēto oligonukleotīdu;

(d) minētā līdzekļa izņemšanu no minētā maisījuma, kur, labāk, minētā līdzekļa minētā aizvākšana no minētā maisījuma tiek veikta ar bufera pirmo apmaiņu ar pirmo buferi, kur minētais pirmais buferis satur nātrija hlorīdu, kur, labāk, minētā nātrija hlorīda koncentrācija minētajā pirmajā buferī ir 0 līdz 1 M, labāk 0 līdz 550 mM, vēl labāk 0 līdz 350 mM, tomēr vēl labāk 50 līdz 350 mM un vislabāk 250 mM; un

(e) pieļaušanu minētajam apvalka proteīnam pašam savienoties kopā vīrusveidīgā daļiņā.

10. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kur minētais apvalka proteīns satur vai alternatīvi būtībā sastāv no rekombinantiem proteīniem vai to fragmentiem, no RNS bakteriofāga, kur, labāk, minētais RNS bakteriofāgs ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- (a) bakteriofāga Qβ;
- (b) bakteriofāga R17;
- (c) bakteriofāga fr;

- (d) bakteriofāga GA;
- (d) bakteriofāga SP;
- (e) bakteriofāga MS2;
- (f) bakteriofāga M11;
- (g) bakteriofāga MX1;
- (h) bakteriofāga NL95;
- (i) bakteriofāga f2;
- (j) bakteriofāga PP7; un
- (k) bakteriofāga AP205.

11. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kur minētais RNS bakteriofāgs ir Qβ.

12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, kur minētā oligonukleotīda un minētā apvalka proteīna molārā attiecība minētajā maisījumā ir 0,5 līdz 1,2, vislabāk 0,7.

13. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kur minētais apvalka proteīns satur vai, labāk, sastāv no sekvenču, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no:

- (a) SEQ ID NO: 10 (Qβ CP);
- (b) SEQ ID NO: 10 un SEQ ID NO: 11 maisījuma (Qβ A1 proteīna);
- (c) SEQ ID NO: 12 (R17 apvalka proteīna);
- (d) SEQ ID NO: 13 (fr apvalka proteīna);
- (e) SEQ ID NO: 14 (GA apvalka proteīna);
- (f) SEQ ID NO: 15 (SP apvalka proteīna);
- (g) SEQ ID NO: 15 un SEQ ID NO: 16 maisījuma;
- (h) SEQ ID NO: 17 (MS2 apvalka proteīna);
- (i) SEQ ID NO: 18 (M11 apvalka proteīna);
- (j) SEQ ID NO: 19 (MX1 apvalka proteīna);
- (k) SEQ ID NO: 20 (NL95 apvalka proteīna);
- (l) SEQ ID NO: 21 (f2 apvalka proteīna);
- (m) SEQ ID NO: 22 (PP7 apvalka proteīna) un
- (n) SEQ ID NO: 23 (AP205 apvalka proteīna).

14. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 13. pretenzijai, kur minētais oligonukleotīds satur palindromisku sekvenci, kur minētā palindromiskā sekvence ir GACGATCGTC (SEQ ID NO: 1) un kur minētā palindromiskā sekvence atrodas sānos pie tā 5' gala ar vismaz 3 un ne vairāk kā 15 guanozīna struktūrām un kur minētā palindromiskā sekvence atrodas sānos pie tā 3' gala ar vismaz 3 un ne vairāk kā 15 guanozīna struktūrām, un kur labāk minētais oligonukleotīds satur nukleīnskābes sekvenci, izvēlētu no grupas, kas sastāv no:

- (a) „G4-4” GGGGGACGATCGTCGGGG (SEQ ID NO: 2);
- (b) „G5-5” GGGGGGACGATCGTCGGGGG (SEQ ID NO: 3);
- (c) „G6-6” GGGGGGGACGATCGTCGGGGGG (SEQ ID NO: 4);
- (d) „G7-7” GGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGG (SEQ ID NO: 5);
- (e) „G8-8” GGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGG (SEQ ID NO: 6);
- (f) „G9-9” GGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 7);
- (g) „G10” GGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 8);
- (h) „G11” GGGGGGGGGGGACGATCGTCGGGGGGGGGG (SEQ ID NO: 9).

15. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 14. pretenzijai, kur proteīna ieguve ir vismaz 75 % un/vai kur oligonukleotīda iznākums ir vismaz 75 %.

(51) **C07C 211/42**<sup>(200601)</sup>

**A61K 31/13**<sup>(200601)</sup>

**A61K 31/381**<sup>(200601)</sup>

**A61K 31/404**<sup>(200601)</sup>

**A61K 31/435**<sup>(200601)</sup>

**A61K 31/4453**<sup>(200601)</sup>

**A61P 25/00**<sup>(200601)</sup>

**A61P 25/04**<sup>(200601)</sup>

**A61P 25/16**<sup>(200601)</sup>

**A61P 25/28**<sup>(200601)</sup>

**A61P 43/00**<sup>(200601)</sup>

**C07C 215/42**<sup>(200601)</sup>

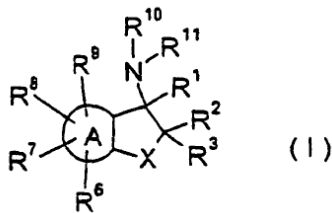
**C07C 215/44**<sup>(200601)</sup>

**C07C 217/52**<sup>(200601)</sup>

(11) **2042480**

**C07C 255/58**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 209/40**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 221/16**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 295/12**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 307/82**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 333/78**<sup>(200601)</sup>  
**C07C 235/40**<sup>(200601)</sup>

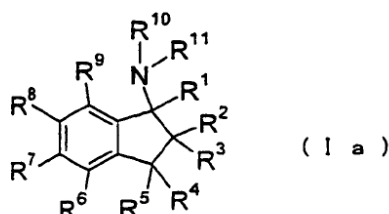
- (21) 07790834.1 (22) 17.07.2007  
 (43) 01.04.2009  
 (45) 01.05.2013  
 (31) 2006195307 (32) 18.07.2006 (33) JP  
 (86) PCT/JP2007/064072 17.07.2007  
 (87) WO2008/010481 24.01.2008  
 (73) Astellas Pharma Inc., 3-11, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 103-8411, JP  
 (72) HAYASHIBE, Satoshi, JP  
 YAMASAKI, Shingo, JP  
 WATANABE, Kazushi, JP  
 SHIRAIISHI, Nobuyuki, JP  
 SUZUKI, Daisuke, JP  
 HOSHII, Hiroaki, JP  
 OHMORI, Junya, JP  
 KANAYAMA, Takatoshi, JP  
 (74) HOFFMANN EITL, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **AMINOINDĀNA ATVASINĀJUMS VAI TĀ SĀLS AMINOINDAN DERIVATIVE OR SALT THEREOF**  
 (57) 1. Savienojums, kas pārstāvēts ar šādu vispārīgo formulu (I) vai tā sāls:



kur simboliem formulā (I) ir šādas nozīmes, proti:  
 gredzens A: 5 vai 6 locekļu heterocikls vai benzola gredzens,  
 X: C(R<sup>4</sup>)(R<sup>5</sup>), O, S vai N(R<sup>12</sup>),  
 R<sup>1</sup>: (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, cikloalkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilēnārilgrupa, arilgrupa, kas var būt aizvietota, heteroarilgrupa, kas var būt aizvietota, vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem,  
 R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa vai arilgrupa,  
 R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – ūdeņraža atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, -OH, -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilēn-OH grupa vai -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilēn-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  
 R<sup>6</sup> līdz R<sup>9</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – ūdeņraža atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēna atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, OH, CN, alkenilgrupa, kurā ir līdz 6 oglekļa atomiem, vai slāpekli saturoša heterocikliska grupa,  
 R<sup>10</sup> un R<sup>11</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – ūdeņraža atoms vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, un  
 R<sup>12</sup>: ūdeņraža atoms vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  
 nodrošinot, lai R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> varētu kopā ar blakusesošo oglekļa atomu veidot cikloalkilgrupu.

2. Savienojums ar šādu vispārīgo formulu (Ia) vai tā sāls:

[Īm. 9]



kur simboliem augstāk esošajā formulā (Ia) ir šādas nozīmes, proti:  
 R<sup>1</sup>: (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, cikloalkilgrupa, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilēnārilgrupa, arilgrupa, kas var būt aizvietota, heteroarilgrupa, kas var būt aizvietota, vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem,  
 R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – zemāka alkilgrupa vai arilgrupa,  
 R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – ūdeņraža atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, -OH, -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilēn-OH grupa vai -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilēn-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  
 R<sup>6</sup> līdz R<sup>9</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – ūdeņraža atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, halogēna atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, OH, CN, alkenilgrupa, kurā ir līdz 6 oglekļa atomiem, vai slāpekli saturoša heterocikliska grupa,  
 R<sup>10</sup> un R<sup>11</sup>: vienādi vai atšķirīgi, katrs no tiem – ūdeņraža atoms vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa,  
 nodrošinot, lai R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> varētu kopā ar blakusesošo oglekļa atomu veidot cikloalkilgrupu.

3. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar 2. pretenziju, kur R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>10</sup> un R<sup>11</sup> augstāk esošajā formulā (Ia) visi ir ūdeņraža atomi.

4. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar 3. pretenziju, kur R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> augstāk esošajā formulā (Ia) ir vienādi vai atšķirīgi viens no otra un katrs no tiem ir (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa vai cikloalkilgrupa, veidota kombinācijā ar blakusesošo oglekļa atomu.

5. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas tiek atlasīts no 2,2-dimetil-1-fenilindān-1-amīna, 1-(4-fluorfenil)-2,2-dimetilindān-1-amīna, 1-(2-metoksifenil)-2,2-dimetilindān-1-amīna, 1-(3-metoksifenil)-2,2-dimetilindān-1-amīna, 1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 1,2,2,5-tetrametilindān-1-amīna, 1,2,2,6-tetrametilindān-1-amīna, 4-fluor-1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 5-fluor-1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 7-fluor-1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 5-metoksi-1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 6-metoksi-1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 6-izopropoksi-1,2,2-trimetilindān-1-amīna, 1-etil-2,2-dimetilindān-1-amīna, 1-izopropil-2,2-dimetilindān-1-amīna un 1'-metil-1',3'-dihidrospiro[ciklopropān-1,2'-indēn]-1'-amīna.

6. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 1,2,2,6-tetrametilindān-1-amīns vai tā sāls.

7. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 1,2,2-trimetilindān-1-amīns vai tā sāls.

8. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 6-metoksi-1,2,2-trimetilindān-1-amīns vai tā sāls.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu vai tā sāli saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 9. pretenziju, kas ir NMDA receptoru antagonists.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 9. pretenziju, kas ir līdzeklis demences ārstēšanai.

12. Savienojuma vai tā sāls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošana NMDA receptoru antagonista vai demences ārstēšanas līdzekļa pagatavošanai.

13. Savienojums vai tā sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, izmantošanai demences ārstēšanai metodē.

- (51) **C07K 16/28**<sup>(200601)</sup> (11) **2044121**  
**G01N 33/00**<sup>(200601)</sup>  
**C07K 16/00**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 07801422.2 (22) 11.07.2007  
 (43) 08.04.2009  
 (45) 21.08.2013  
 (31) 06450095 (32) 11.07.2006 (33) EP  
 (86) PCT/EP2007/006123 11.07.2007  
 (87) WO2008/006554 17.01.2008  
 (73) Greenovation Biotech GmbH, Bötzingger Strasse 29b, 79111 Freiburg i.Br, DE  
 (72) SCHUSTER, Manfred, AT  
 KIRCHEIS, Ralf, AT  
 NECHANSKY, Andreas, AT  
 JOST, Wolfgang, DE  
 GORR, Gilbert, DE  
 (74) Sonn & Partner, Patentanwälte, Riemergasse 14, 1010 Wien, AT

Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **GLIKO-KONSTRUĒTAS ANTIVIELAS  
GLYCO-ENGINEERED ANTIBODIES**

(57) 1. Paņēmiens antivielas preparāta, kas ietver modificētas dzīvnieku IgG antivielas vai to atvasinājumus, vai fragmentu, kas ietver imūnglobulīna saistošo domēnu un Fc rajonu, kas ir specifisks pret antigēnu, ražošanai, kur paņēmiens raksturīgs ar to, ka

- antivielas vai to atvasinājumi vai fragmenti satur N-glikāna struktūru, kas ir brīva no fukozes un ksilozes un
- vismaz 90 %, labāk vismaz 95 %, vēl labāk vismaz 99 %, vislabāk vismaz 100 % modificēto antivielu, to atvasinājumu vai nesatur fragmentu C-gala lizīna atlikumu, kas raksturīgs ar to, ka antivielas, fragmenti vai atvasinājumi, kas satur imūnglobulīna saistošo domēnu un Fc rajonu, tiek ekspresēti augu šūnās ar nepietiekamu β1,2-ksiloziltransferāzes un α1,3-fukoziltransferāzes aktivitāti, kur antivielu, fragmentu vai atvasinājumu C-gala lizīns ir izņemts.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur augu šūnas papildus ir ar nepietiekamu 1,4-galaktoziltransferāzes aktivitāti.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka nemodificētajam antivielas preparātam ir tāda pati afinitāte pret antigēnu, kā modificētās antivielas, vai tās atvasinājuma, vai fragmenta preparātam.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka preparāta ADCC aktivitāte ir par vismaz 10 %, labāk par vismaz 15 %, vēl labāk par vismaz 20 % mazāk inhibēta vismaz 10 %-īgā, labāk vismaz 40 %-īgā seruma šķīdumā, kas satur nespecifiskas dzīvnieka, labāk zīdītāja antivielas nekā nemodificētas dzīvnieka antivielas preparāts, kurš ir specifisks pret to pašu antigēnu.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka N-glikāna struktūra ir izvēlēta no  $\text{GlcNAc}_2\text{Man}_3$ ,  $\text{GlcNAc}_6\text{Man}_3\text{GlcNAc}$  vai  $\text{GlcNAc}_2\text{Man}_3\text{GlcNAc}_2$ .

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka ADCC efektoru funkcija ir vismaz 5-kārt, labāk vismaz 10-kārt, vēl labāk vismaz 20-kārt, vēl labāk vismaz 30-kārt, bet vēl labāk vismaz 40-kārt, vislabāk vismaz 50-kārt palielināta, salīdzinot ar nemodificēto dzīvnieka antivielas preparātu, labāk specifisku preparātu pret to pašu antigēnu.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka mazāk par 50 %, labāk mazāk par 30 %, vēl labāk mazāk par 10 % antivielu, to atvasinājumu vai fragmentu nav ar N-glikāna struktūru.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dzīvnieks ir zīdītājs, labāk cilvēks vai kaniņš, vai pele, vai rāpulis, labāk krokodils, un/vai modificētās dzīvnieka antivielas vai to atvasinājumi vai fragmenti ir himēriski, humanizēti vai arī tie ir cilvēka un/vai monoklonāli.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dzīvnieka ADCC aktivitāte ir vismaz par 20 %, labāk par vismaz 30 % mazāk inhibēta nespecifiskas antivielas šķīdumā.

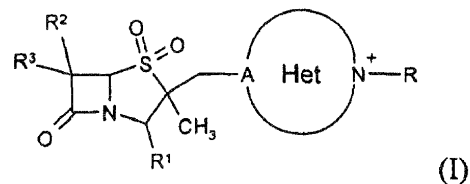
10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka CDC aktivitāte ir vismaz par 10 % samazināta, salīdzinot ar nemodificēto antivielas preparātu, specifisku pret to pašu antigēnu.

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka modificēto antivielu, to atvasinājumu vai fragmentu saistīšana uz  $\text{CD16}_{158\text{ FF}}$  vismaz 10 %-īgā, labāk vismaz 40 %-īgā seruma šķīdumā, kas satur nespecifiskas dzīvnieka antivielas, ir vismaz par 10 % mazāk inhibēta nekā nemodificēta dzīvnieka antivielas preparāta saistīšana, kas ir specifisks pret to pašu antigēnu, un/vai ar to, ka modificēto antivielu, to atvasinājumu vai fragmentu mērķšūnas līze, ko pārnes ar efektoru šūnām ar jebkuru  $\text{CD16}_{158}$  genotipu, vismaz 10 %-īgā, labāk vismaz 40 %-īgā seruma šķīdumā, kas satur nespecifiskas dzīvnieka antivielas, ir vismaz par 10 % mazāk inhibēta nekā nemodificēts dzīvnieka antivielas preparāts, specifisks pret to pašu antigēnu.

12. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka C-gala lizīns ir izņemts ar karboksipeptidāzi.

13. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka C-gala lizīns ir izņemts *in vivo*, izvēloties atbilstošus šūnu kultūras nosacījumus.

- (51) **C07D 499/87<sup>(200601)</sup>** (11) **2046802**  
**C07D 499/21<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 499/28<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 499/32<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/431<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 31/00<sup>(200601)</sup>**
- (21) 07804590.3 (22) 11.07.2007  
(43) 15.04.2009  
(45) 21.08.2013  
(31) CH12172006 (32) 12.07.2006 (33) IN  
(86) PCT/IB2007/001941 11.07.2007  
(87) WO2008/010048 24.01.2008  
(73) Allecre Therapeutics GmbH, c/o Loebe Treuhand GmbH, Wallbrunnstrasse 24, 79539 Lörrach, DE  
(72) UDAYAMPALAYAM, Palanisamy, Senthikumar, IN  
GANAPATHY, Panchapakesan, IN  
MUKUT, Gohain, IN  
VENKATASUBRAMANIAN, Hariharan, IN  
SRIRAM, Rajagopal, IN  
PAUL-SATYASEELA, Maneesh, IN  
SOLANKI, Shakti, Singh, IN  
DEVARAJAN, Sathishkumar, IN  
(74) Murphy, Colm Damien, et al, Ipulse Carrington House, 126-130 Regent Street, London W1B 5SE, GB  
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV  
(54) **2-AIZVIETOTI METILPENAMA ATVASINĀJUMI  
2-SUBSTITUTED METHYL PENAM DERIVATIVES**  
(57) 1. 2-aizvietoti metilpenama atvasinājumi ar formulu (I)

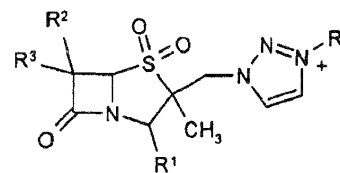


to tautomērās formas, to stereoizomēri, to polimorfi, to solvāti un to farmaceutiski pieņemami sāļi, kur:

A = C vai N;

Het ir trīs- līdz septiņlocekļu heterociklisks gredzens;  
R<sup>1</sup> apzīmē karboksilāta anjonu vai -COOR<sup>4</sup>, kur R<sup>4</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, metoksibenzilgrupu, nitrobenzilgrupu, sililgrupu, alkilgrupu, difenilmetilgrupu, proksetilgrupu, aksetilgrupu, pivoksilgrupu, heks-etilgrupu, daloksātu vai farmaceutiski pieņemamu sāļi;  
R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> var būt vienādi vai dažādi un neatkarīgi apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu, aminogrupu, eventuāli aizvietotu alkilgrupu, alkenilgrupu vai alkinilgrupu un  
R apzīmē aizvietotu vai neaizvietotu alkilgrupu.

2. Penama atvasinājumi ar šādu formulu:



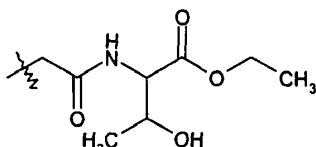
to tautomērās formas, to stereoizomēri, to polimorfi, to solvāti, to farmaceutiski pieņemami sāļi un to farmaceutiski pieņemamas kompozīcijas, kur:

R<sup>1</sup> apzīmē karboksilāta anjonu vai -COOR<sup>4</sup>, kur R<sup>4</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, metoksibenzilgrupu, nitrobenzilgrupu, sililgrupu, alkilgrupu, difenilmetilgrupu, proksetilgrupu, aksetilgrupu, pivoksilgrupu, heks-etilgrupu, daloksātu vai farmaceutiski pieņemamu sāļi;  
R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> var būt vienādi vai dažādi un neatkarīgi apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu, aminogrupu, eventuāli aizvietotu alkilgrupu, alkenilgrupu vai alkinilgrupu un  
R apzīmē aizvietotu vai neaizvietotu alkilgrupu.

3. Penama atvasinājumi saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju,

turklāt R ir izvēlēts no metilgrupas, etilgrupas, n-propilgrupas, izopropilgrupas, n-butilgrupas, izobutilgrupas, t-butilgrupas, n-pentilgrupas, izopentilgrupas un heksilgrupas.

4. Penama atvasinājumi saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt R ir izvēlēts no  $-(CH_2)_n-CH_3$ ,  $-(CH_2)_n-C_6H_5$ ,  $-(CH_2)_n-CH=CH_2$ ,  $-CH_2-CO-NH_2$ ,  $-CH_2-COOBu^t$ ,  $-(CH_2)_n-CO$ -heterociklilgrupas,  $-CH_2-CO-NH-(CH_2)_n-COOEt$ ,



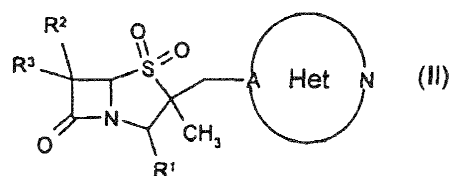
un atbilstošām esteru skābēm, kur n ir vesels skaitlis līdz 5.

5. Penama atvasinājumi saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt heterocikliskais gredzens ir izvēlēts no pirolil-, pirolinil-, imidazolil-, pirazolil-, piridil-, pirimidinil-, pirazinil-, piperidinil-, oksazolidinil-, tiazolil-, benzotiazolil-, purinil-, piridazinil-, triazolilgrupas, kas izvēlēta no 4H-1,2,4-triazolil-, 1H-1,2,3-triazolil- vai 2H-1,2,3-triazolilgrupas; tetrazolilgrupas, kas izvēlēta no 1H-tetrazolil- vai 2H-tetrazolilgrupas; piperidinil-, imidazolidinil-, indolil-, benzimidazolil-, hinolil-, izohinolil-, indazolil-, benzotriazolil-, 1,2,4-oksadiazolil-, 1,3,4-oksadiazolil-, 1,2,5-oksadiazolil-, 1,2,3-tiadiazolil-, 1,2,4-tiadiazolil-, 1,3,4-tiadiazolil-, 1,2,5-tiadiazolilgrupas, kas eventuāli ir papildus aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, un aizvietotāji ir vienādi vai dažādi, turklāt piemērotais(-ie) aizvietotājs(-i) ir izvēlēts(-i) no zemākās alkilgrupas, izvēlētas no metilgrupas un etilgrupas; zemākās alkoksigrupas, izvēlētas no metoksigrupas, etoksigrupas un propoksigrupas; zemākās alkiltiogrupas, izvēlētas no metiltiogrupas, etiltiogrupas; zemākās alkilaminogrupas; zemākās cikloalkilgrupas, izvēlētas no ciklopentilgrupas un cikloheksilgrupas; zemākās cikloalkenilgrupas, izvēlētas no cikloheksenilgrupas un cikloheksadienilgrupas; hidroksilgrupas, halogēna atoma, izvēlēta no hlora un broma atoma; aminogrupas; ciāngrupas; nitrogrupas; karboksigrupas; sulfogrupas; sulfamoilgrupas; iminogrupas; oksogrupas; zemākās aminoalkilgrupas, izvēlētas no aminometilgrupas un aminoetilgrupas; halogēna atoma, trihalogēnmetilgrupas, izvēlētas no  $CF_3$ .

6. Penama atvasinājumi, kā definēts 1. vai 2. pretenzijā, kas ir izvēlēti no savienojumu grupas, kas sastāv no:

- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-metil-1H-1,2,3-triazol-3-ija];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-etil-1H-1,2,3-triazol-3-ija];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-n-propil-1H-1,2,3-triazol-3-ija];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-alkil-1H-1,2,3-triazol-3-ija];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-(2-amino-2-oksoetil)-1H-1,2,3-triazol-3-ija un atbilstošās skābes];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-(2-t-butoksi-2-oksoetil)-1H-1,2,3-triazol-3-ija un atbilstošās skābes];
- 1-[[[(1S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-(2-morfolin-4-il-2-oksoetil)-1H-1,2,3-triazol-3-ija un atbilstošās skābes];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-[[[(2-etoksi-2-oksoetil)amino]-2-oksoetil]-1H-1,2,3-triazol-3-ija un atbilstošās skābes];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-(2-[[[(3-etoksi-3-oksopropil)amino]-2-oksoetil]-1H-1,2,3-triazol-3-ija un atbilstošās skābes];
- 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-(2-[[[(1-(etoksikarbonil)-2-hidroksipropil]amino)-2-oksoetil]-1H-1,2,3-triazol-3-ija un atbilstošās skābes un 1-[[[(2S,3S,5R)-2-karboksi-3-metil-4,4,7-triokso-4-tia-1-azabicyclo[3.2.0]hept-3-il]metil]-3-benzil-1H-1,2,3-triazol-3-ija].

7. Metode 2-aizvietot metilpenama atvasinājumu ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver: savienojuma ar formulu (II)



kur A = C vai N; Het ir trīs- līdz septiņlocekļu heterocikliskais gredzens, pakļaušanu reakcijai ar savienojumu ar formulu (IIb)



kur R ir, kā noteikts iepriekš, un X apzīmē halogēna atomu, lai iegūtu savienojumu ar formulu (I) sililējoša reaģenta klātbūtnē vai bez tā.

8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt sililējošais reaģents ir un tas ir izvēlēts no heksametildisilazāna (HMDS), trimetilhlorsilāna (TMCS), trimetilsililjodīda (TMSI), N,O-bis(trimetilsilil)acetamīda (BSA), metiltrimetilsililtrifluoracetamīda (MSTFA), N,O-bistrimetilsililtrifluoracetamīda (BSTFA), metildihlorsilāna, dimetildihlorsilāna, difenildihlorsilāna, N-metilsililacetamīda (MSA), bistrimetilsililurīnvielas un to maisījuma.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vismaz vienu no 2-aizvietotajiem metilpenama atvasinājumiem ar formulu (I) saskaņā ar 1., 2. vai 6. pretenziju.

10. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vismaz vienu no 2-aizvietotajiem metilpenama atvasinājumiem ar formulu (I) saskaņā ar 1., 2. vai 6. pretenziju un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kas papildus satur antibiotisku līdzekli.

12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt antibiotiskais līdzeklis ir penicilīns, karbapenēms, cefalosporīns vai to atvasinājumi.

13. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt antibiotiskais līdzeklis ir izvēlēts no piperacilīna, ampicilīna, amoksicilīna, bakampicilīna, lenampicilīna, tikarcilīna, amikacīna, gentamicīna, tobramicīna, meropenēma, imipenēma, panipenēma, flukloksacilīna, oksacilīna, aztreonāma, ceftriaksona, cefbuperazona, cefalotīna, cefazolīna, cefapirīna, ceftezola, cefamandola, cefotiāma, cefuroksīma, cefotaksīma, ceftizoksīma, cefmenoksīma, ceftriaksona, cefuzonāma, ceftazidīma, cefoperazona, cefsulodīna, cefoksitīna, cefmetazola, latamoksefa, cefotetāna, cefbuperazona, cefminoksā, flomoksefa, cefaleksīna, cefradīna, cefaklora, cefadrok-sila, cefprozila, cefuroksīma aksetila, cefotiāma heksetila, cefiksīma, cefpodoksīma proksetila, ceftibutēna, cefetameta pivokсила, cefdinira, cefepima vai to atvasinājumiem.

14. Penama atvasinājums saskaņā ar 1., 2. vai 6. pretenziju izmantošanai bakteriālas infekcijas ārstēšanā.

- |   |                         |
|---|-------------------------|
| (51) <b>B01J 31/04</b> <sup>(200601)</sup>  | (11) <b>2049258</b>     |
| <b>B01J 31/14</b> <sup>(200601)</sup>   |                         |
| (21) 07810448.6   | (22) 13.07.2007         |
| (43) 22.04.2009   |                         |
| (45) 29.05.2013   |                         |
| (31) 834116 P   | (32) 28.07.2006 (33) US |
| 511719  | 29.08.2006 US           |
| (86) PCT/US2007/016003  | 13.07.2007              |
| (87) WO2008/016476  | 07.02.2008              |
| (73) GRUPO PETROTEMEX, S.A. DE C.V., Ricardo Margain No. 444 Torre sur, Piso, 16 Col. Valle del Campestre, San Pedro Garza Garcia, Nuevo Leon 66265, MX |                         |
| (72) WHITE, Alan Wayne, US  |                         |
| (74) Brown, Fraser Gregory James, et al, Cleveland, 10 Fetter Lane, London EC4A 1BR, GB   |                         |
| Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga LV-1083, LV   |                         |
| (54) <b>BEZNOGULŠŅU SĀRMU/SĀRMZEMJU METĀLA UN ALUMĪNIJA KOMPOZĪCIJAS, IEGŪTAS NO ORGANISKĀM HIDROKSISKĀBĒM</b>  |                         |
| <b>NON-PRECIPIATING ALKALI/ALKALINE EARTH METAL AND ALUMINUM COMPOSITIONS MADE WITH ORGANIC HYDROXYACIDS</b>  |                         |



(57) 1. Kompozīcija, kas iegūta, kombinējot:  
 i. M, kur M ir sārsmzemju metāls vai sārsmu metāls, un  
 ii. alumīniju, un  
 iii. etilēnglikolu, un  
 iv. organiskās hidroksiskābes savienojumu, kam ir vismaz trīs oglekļa atomi un mazāk kā trīs karbonskābes grupas, ja hidroksiskābes savienojums satur 8 vai mazāk oglekļa atomus, kur kompozīcija ir šķīduma formā, kas iegūta, kombinējot (i), (ii), un (iii) komponentu, un pievienojot tam organiskas hidroksiskābes komponentu un maisot temperatūrā no 20 līdz 150°C, kur molārā attiecība etilēnglikols:alumīnijs ir vismaz 35:1 un molārā attiecība M:alumīnijs:hidroksiskābe ir no 0,2:1:0 līdz 10:1:5.  
 2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur molārā attiecība etilēnglikols:alumīnijs ir vismaz 50:1.  
 3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur alumīnijs tiek iegūts no alumīnija savienojumiem ar formulu:



kur R, R', R'' neatkarīgi viens no otra ir alkilgrupa, arilgrupa, acilgrupa vai ūdeņradis, R''' ir anjonu grupa, un a, b, c, neatkarīgi viens no otra ir 0 vai pozitīvs vesels skaitlis, un a+b+c nav lielāks par 3.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur alumīnija komponents satur alumīnija karbonskābes sāli vai alumīnija alkoholātu.

5. Kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kur alumīnija karbonskābes sāls satur diacetāta monohidroksi savienojumu vai monoacetāta dihidroksi savienojumu vai to maisījumu.

6. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur kompozīcija ir šķīdums, kas satur vismaz 3000 ppm alumīnija, rēķinot uz kompozīcijas masu.

7. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur šķīdums satur vismaz 1 masas % alumīnija, rēķinot uz kompozīcijas masu.

8. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur M satur litiju, nātriju, kāliju vai to kombinācijas.

9. Kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kur sārsmzemju metāla vai sārsmu metāla daudzums kompozīcijā ir vismaz 100 ppm, rēķinot uz kompozīcijas masu.

10. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur molārās attiecības M:Al ir vismaz 0,75:1.

11. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur Al atomu koncentrācija ir vismaz 3000 ppm un M:Al molārās attiecības ir robežās no 0,2:1 līdz 5:1.

12. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojumu M:hidroksiskābe molārās attiecības ir vismaz 0,80:1.

13. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur šķīdums satur organiskās hidroksiskābes šķīdinātājus apjomā no 0,01 līdz 5 masas %, rēķinot uz šķīduma masu.

14. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur organiskās hidroksiskābes savienojumam ir no 3 līdz 14 oglekļa atomi.

15. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur organiskā hidroksiskābe ir pienskābe, vīnskābe, mandeļskābe, salicilskābe vai to maisījumi.

16. Kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kur kompozīcijai M:Al molārās attiecības ir robežās no 0,75:1 līdz 2:1.

17. Poliestera polimēra kompozīcijas pagatavošanas paņēmieni, kas poliestera polimēra iegūšanai ietver šķīduma, kas satur kompozīciju saskaņā ar 1. pretenziju, pievienošanu polimerizācijas procesā izkausētai fāzei.

(54) **BRILŅU RĀMIS AR KOMBINĒTĀM ENĢĒM SPECTACLES FRAME HAVING A COMPOSITE HINGE**

(57) 1. Brilles, kas satur:  
 lēcu turēšanas mezglu (11);  
 pāri kājiņu (20), kuras stieejas no minētā lēcu turēšanas mezgla (11), lai balstītu brilles uz lietotāja;  
 enģu mezglu (22), lai attiecīgo vienu no minētajām kājiņām (20) savienotu ar minēto lēcu turēšanas mezglu (11), pie tam: katram no minētajiem enģu mezgliem (22) ir pāris savstarpēji perpendikulāru griešanās asi (38, 54), lai minētajām kājiņām ļautu kustēties attiecībā pret minēto lēcu turēšanas mezglu ap minētajām divām būtībā perpendikulārajām asīm, pie tam katrs no minētajiem enģu mezgliem (22) satur starp minēto kājiņu (20) un minēto lēcu turēšanas mezglu (11) ievietotu ekscentru (36), un minētajam ekscentram (36) ir uz minētā lēcu turēšanas mezgla (11) pusi vērsts atloks (35),

pirmo tapiņu (38), kas stieejas starp minēto lēcu turēšanas mezglu (11) un minēto atloku (35), lai grozāmā veidā savienotu minēto lēcu turēšanas mezglu (11) un minēto atloku (35), veidojot pirmo griešanās asi (38),

pirmo ekscentra virsmu (34) uz minētā atloka (35), pie tam minētajai pirmajai ekscentra virsmai ir progresīvi pieaugošs radiālais attālums no minētās pirmās griešanās ass uz abām pusēm no vidusdaļas,

pirmo ekscentra bīdītāju (30), kas atrodas saskarē ar minēto pirmo ekscentra virsmu, un

pirmo priekšspriegošanas elementu (31, 32), kas darbojas starp minēto pirmo ekscentra bīdītāju un minēto lēcu turēšanas mezglu, lai darbotos pret minētās kājiņas kustībai attiecībā pret minēto lēcu turēšanas mezglu ap minēto pirmo griešanās asi projām no iepriekš noteikta stāvokļa, pie tam minētajam ekscentram (36) papildus ir minētās kājiņas (20) virzienā vērsta mēlīte (40),

otru tapiņu (54), kas stieejas starp minēto kājiņu un minēto mēlīti (40), lai grozāmā veidā savienotu minēto kājiņu (20) un minēto mēlīti (40), veidojot otro griešanās asi (54), kas perpendikulāra minētajai pirmajai griešanās asij (38),

otru ekscentra virsmu (42) uz minētās mēlītes (40), pie tam minētajai otrajai ekscentra virsmai ir progresīvi pieaugošs radiālais attālums no minētās otrās griešanās ass uz abām pusēm no vidusdaļas,

otru ekscentra bīdītāju, kas atrodas saskarē ar minēto otro ekscentra virsmu (42), un

otru priekšspriegošanas elementu (50, 52), kas darbojas starp minēto otro ekscentra bīdītāju un minēto kājiņu, lai darbotos pret minētās kājiņas kustībai attiecībā pret minēto lēcu turēšanas mezglu ap minēto otro griešanās asi projām no minētā iepriekš noteiktā stāvokļa.

2. Brilles atbilstoši 1. pretenzijai, pie tam minētais iepriekš noteiktais stāvoklis atrodas vidū kustības intervālam, kuru nodrošina attiecīgā no minētajām asīm.

3. Brilles atbilstoši 2. pretenzijai, pie tam minētās ekscentra virsmas (34, 42) ir izveidotas tā, lai minēto kājiņu (20) virzītu atpakaļ uz minēto iepriekš noteikto stāvokli attiecībā pret minēto lēcu turēšanas mezglu (11).

4. Brilles atbilstoši 3. pretenzijai, pie tam katrs no minētajiem priekšspriegošanas elementiem (30, 32, 50, 52) satur atsperi (32, 52), kas rada minētā bīdītāja (30, 50) priekšspriegojumu pret minēto vienu ekscentra virsmu (34, 42).

5. Brilles atbilstoši 4. pretenzijai, pie tam katrs no minētajiem bīdītājiem (30, 50) ir pārbīdāmā veidā iestiprināts attiecīgajā minētajā kājiņā (20) un minētajā lēcu turēšanas mezglā (11).

6. Brilles atbilstoši 5. pretenzijai, pie tam minētā atspere (32, 52) ir nostiprināta uz minētā bīdītāja (30, 50) pagarinājuma (31, 51).

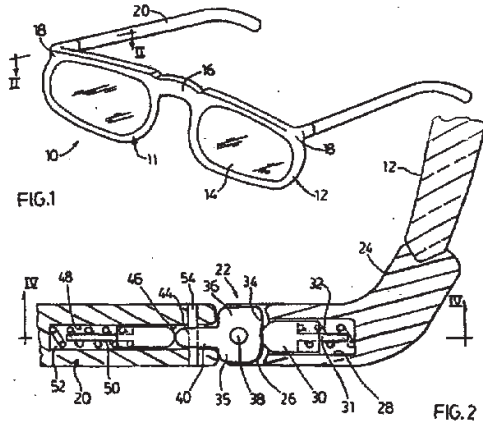
7. Brilles atbilstoši 6. pretenzijai, pie tam minētā atspere (32, 52) un minētais bīdītājs (30, 50) ir ievietots dziļā urbumā (28, 48) minētajā otrajā elementā no grupas, kas satur minēto kājiņu (20) un minēto lēcu turēšanas mezglu (11), un minētajā urbumā (28, 48) to notur tapiņa (38, 54), kas veido vienu no minētajām griešanās asīm.

8. Brilles atbilstoši jebkurai iepriekšējai pretenzijai, pie tam minēto ekscentru virsmu (34, 42) profili ir izveidoti tā, lai nodrošinātu kājiņas (20) stabilu novietojumu attiecībā pret lēcu turēšanas mezglu (11), kad minētā kājiņa un minētais lēcu turēšanas mezgls ir perpendikulāri viens pret otru.

(51)	<b>G02C 5/22<sup>(200601)</sup></b>	(11)	<b>2069853</b>
	<b>G02C 5/10<sup>(200601)</sup></b>		
(21)	07815801.1	(22)	12.09.2007
(43)	17.06.2009		
(45)	17.04.2013		
(31)	531180	(32)	12.09.2006
(86)	PCT/CA2007/001594		12.09.2007
(87)	WO2008/031204		20.03.2008
(73)	Groupe Aspx Inc., 5440 rue Pare, Mont Royal, QC H4P 1R3, CA		
(72)	IFERGAN, Nonu, CA		
(74)	Raimondi, Margherita, Dott. Ing. Prof. Alfredo Raimondi S.r.l., Piazzale Cadorna, 15, 20123 Milano, IT		
	Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV		

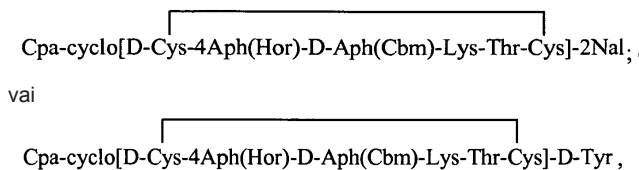
9. Brillēs atbilstoši 8. pretenzijai, pie tam minētajām ekscentru virsmām (34, 42) vidējā daļa atrodas minimālā radiālā attālumā no minētās griešanās ass (38, 54), un minēto virsmu radiālais attālums no minētās griešanās ass progresīvi pieaug virzienā uz abām pusēm no minētās vidējās daļas.

10. Brillēs atbilstoši jebkurai no 1. līdz 9. pretenzijai, pie tam minētā kājiņa (20) var tikt pārvietota uz glabāšanas stāvokli, griežot ap vienu no minētajām asīm (38, 54), un ar minēto asi saistītā minētā ekscentra virsma (34, 42) ir profilēta tā, ka pastāv pretestība kustībai no minētā iepriekš noteiktā stāvokļa kustības sākuma intervālā un ka minētā kājiņa tiek spiesta minētajā glabāšanas stāvoklī, kad minētais kustības intervāls tiek pārsniegts.



- (51) **C07K 14/655<sup>(200601)</sup>** (11) **2076535**  
**C07K 7/06<sup>(200601)</sup>**  
 (21) 07854075.4 (22) 15.10.2007  
 (43) 08.07.2009  
 (45) 06.03.2013  
 (31) 829637 P (32) 16.10.2006 (33) US  
 (86) PCT/US2007/081430 15.10.2007  
 (87) WO2008/048942 24.04.2008  
 (73) THE SALK INSTITUTE FOR BIOLOGICAL STUDIES,  
 10010 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, US  
 Universität Bern, Verwaltungsdirektion, Hochschulstrasse 4,  
 3012 Bern, CH  
 University Hospital Basel, Hebelstrasse 32, 4031 Basel, CH  
 (72) RIVIER, Jean E. F., US  
 ERCHEGYI, Judit, US  
 REUBI, Jean Claude, CH  
 MAECKE, Helmut R., CH  
 (74) Kanopka, Martin, EP&US, Patent Law Office, Kapuziner-  
 strasse 39, 80469 Munich, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **SELEKTĪVI SOMATOSTATĪNA RECEPTORA (SSTR2)  
 ANTAGONISTI  
 RECEPTOR(SSTR2)-SELECTIVE SOMATOSTATIN  
 ANTAGONISTS**

(57) 1. Ciklisks somatostatīna (SRIF) analogs peptīds, kas selektīvi piesaista SRIF receptoru SSTR2, kur peptīdam atbilst viena no šādām aminoskābju sekvencēm, kurās C-gals ir amidēts:



kur Cpa apzīmē hlor-Phe, Aph (Hor) apzīmē 4-[(2,6-dioksa-heksahidro-pirimidīn-4-karbonil)-amino]-fenilalanīnu un Aph (Cbm) apzīmē 4-ureido-fenilalanīnu.

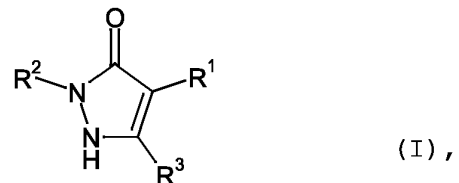
2. Peptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kur tas ir pievienots Cpa grupai (Z), kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no helatoriem uz DOTA bāzes, helatoriem uz DTPA bāzes, helatoriem uz NOTA

bāzes, karbonilsavienojumiem, 2-hidrazino-nikotīnamīda, N<sub>4</sub>-helatoriem, deferoksamīna un N<sub>x</sub>S<sub>y</sub>-helatoriem.

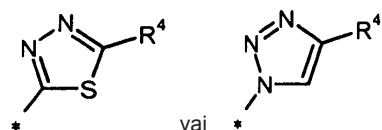
3. Peptīds saskaņā ar 2. pretenziju, kur DOTA helators ir pievienots Cpa ar kovalentu saiti.

4. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur peptīda saskaņā ar 1. pretenziju un vismaz viena farmaceutiski pieņemama nesēja maisījumu.

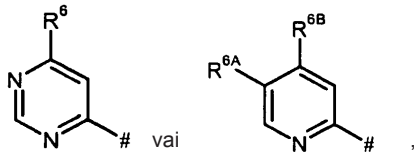
- (51) **C07D 401/14<sup>(200601)</sup>** (11) **2084151**  
**C07D 403/14<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 413/14<sup>(200601)</sup>**  
**C07D 417/14<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/41<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/435<sup>(200601)</sup>**  
**A61K 31/495<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 7/00<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 9/00<sup>(200601)</sup>**  
 (21) 07818948.7 (22) 12.10.2007  
 (43) 05.08.2009  
 (45) 29.05.2013  
 (31) 102006050516 (32) 26.10.2006 (33) DE  
 (86) PCT/EP2007/008877 12.10.2007  
 (87) WO2008/067871 12.06.2008  
 (73) Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Strasse 10,  
 40789 Monheim, DE  
 (72) THEDE, Kai, DE  
 FLAMME, Ingo, DE  
 OEHME, Felix, DE  
 ERGÜDEN, Jens-Kerim, DE  
 STOLL, Friederike, DE  
 SCHUHMACHER, Joachim, DE  
 WILD, Hanno, DE  
 KOLKHOF, Peter, DE  
 BECK, Hartmut, DE  
 KELDENICH, Jörg, DE  
 AKBABA, Metin, DE  
 JESKE, Mario, DE  
 (74) BIP Patents, c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Creative  
 Campus Monheim, Alfred-Nobel-Straße 10, 40789 Monheim,  
 DE  
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV &  
 Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
 (54) **AIZVIETOTI DIHIDROPIRAZOLONI KARDIOVASKULĀRO  
 UN HEMATOLOĢISKO SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI  
 SUBSTITUTED DIHYDROPIRAZOLONES FOR TREAT-  
 ING CARDIOVASCULAR AND HAEMATOLOGICAL  
 DISEASES**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kurā  
 R<sup>1</sup> apzīmē heteroarilgrupu ar formulu:



kur  
 \* apzīmē savienošanas vietu ar dihidropirazolona gredzenu;  
 un  
 R<sup>4</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, hlora atomu, bromu ato-  
 mu, ciāngrupu, C<sub>1-4</sub>alkilgrupu, trifluormetilgrupu, hidroksimetilgrupu,  
 C<sub>1-4</sub>alkoksigrupu, trifluormetoksigrupu, hidroksikarbonilgrupu vai  
 C<sub>1-4</sub>alkoksikarbonilgrupu;  
 R<sup>2</sup> apzīmē heteroarilgrupu ar formulu:



kur

# apzīmē savienošanas vietu ar dihidropirazolona gredzenu;

un

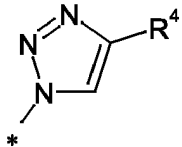
$R^6$ ,  $R^{6A}$  un  $R^{6B}$  ir vienādi vai dažādi un neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu vai aizvietotāju, kas ir izvēlēts no rindas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, broma atoma, ciāngrupas,  $C_{1-6}$  alkilgrupas, trifluometilgrupas, hidroksilgrupas,  $C_{1-6}$  alkoksigrupas, trifluorometoksigrupas, aminogrupas, mono- $C_{1-4}$  alkilaminogrupas, di- $C_{1-4}$  alkilaminogrupas, hidroksikarbonilgrupas,  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupas, 4- līdz 6-locekļu heterocikloalkilgrupas, fenilgrupas un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupas, kur  $C_{1-6}$  alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu vai aminogrupu; un 4- līdz 6-locekļu heterocikloalkilgrupa, fenilgrupa un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa savukārt attiecīgi var būt aizvietota vienreiz vai divreiz, vienādi vai dažādi, ar fluora atomu, hlora atomu, bromu atomu, ciāngrupu,  $C_{1-4}$  alkilgrupu, trifluometilgrupu, hidroksilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu, trifluorometoksigrupu, oksogrupu, aminogrupu, mono- $C_{1-4}$  alkilaminogrupu, di- $C_{1-4}$  alkilaminogrupu, hidroksikarbonilgrupu un/vai  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupu; un

 $R^3$  apzīmē ūdeņraža atomu;

kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju,

kurā

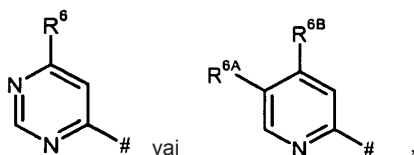
 $R^1$  apzīmē heteroarilgrupu ar formulu:

kur

\* apzīmē savienošanas vietu ar dihidropirazolona gredzenu;

un

$R^4$  apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, hlora atomu, bromu atomu, ciāngrupu,  $C_{1-4}$  alkilgrupu, trifluometilgrupu, hidroksimetilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu, trifluorometoksigrupu, hidroksikarbonilgrupu vai  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupu; un

 $R^2$  apzīmē heteroarilgrupu ar formulu:

kur

# apzīmē savienošanas vietu ar dihidropirazolona gredzenu;

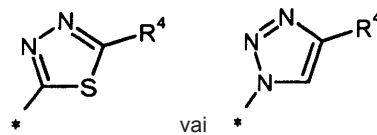
un

$R^6$ ,  $R^{6A}$  un  $R^{6B}$  ir vienādi vai dažādi un neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu vai aizvietotāju, kas ir izvēlēts no rindas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, bromu atoma, ciāngrupas,  $C_{1-6}$  alkilgrupas, trifluometilgrupas, hidroksilgrupas,  $C_{1-6}$  alkoksigrupas, trifluorometoksigrupas, aminogrupas, mono- $C_{1-4}$  alkilaminogrupas, di- $C_{1-4}$  alkilaminogrupas, hidroksikarbonilgrupas,  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupas, 4- līdz 6-locekļu heterocikloalkilgrupas, fenilgrupas un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupas, kur  $C_{1-6}$  alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu vai aminogrupu; un 4- līdz 6-locekļu heterocikloalkilgrupa, fenilgrupa un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa savukārt attiecīgi var būt aizvietota vienreiz vai divreiz, vienādi vai dažādi, ar fluora atomu, hlora atomu, bromu atomu, ciāngrupu,  $C_{1-4}$  alkilgrupu, trifluometilgrupu, hidroksilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu, trifluorometoksigrupu, oksogrupu, aminogrupu, mono- $C_{1-4}$  alkilaminogrupu, di- $C_{1-4}$  alkilaminogrupu, hidroksikarbonilgrupu un/vai  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupu; un

 $R^3$  apzīmē ūdeņraža atomu;

kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

3. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā  $R^1$  apzīmē heteroarilgrupu ar formulu:

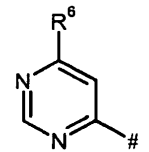


kur

\* apzīmē savienošanas vietu ar dihidropirazolona gredzenu;

un

$R^4$  apzīmē ūdeņraža atomu, fluora atomu, hlora atomu, bromu atomu, ciāngrupu,  $C_{1-4}$  alkilgrupu, trifluometilgrupu, hidroksimetilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu, trifluorometoksigrupu, hidroksikarbonilgrupu vai  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupu; un

 $R^2$  apzīmē heteroarilgrupu ar formulu:

kur

# apzīmē savienošanas vietu ar dihidropirazolona gredzenu;

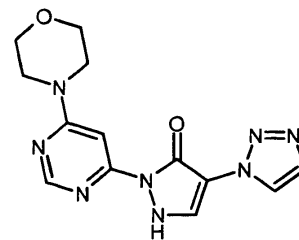
un

$R^6$  apzīmē ūdeņraža atomu vai aizvietotāju, kas ir izvēlēts no rindas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, bromu atoma, ciāngrupas,  $C_{1-6}$  alkilgrupas, trifluometilgrupas, hidroksilgrupas,  $C_{1-6}$  alkoksigrupas, trifluorometoksigrupas, aminogrupas, mono- $C_{1-4}$  alkilaminogrupas, di- $C_{1-4}$  alkilaminogrupas, hidroksikarbonilgrupas,  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupas, 4- līdz 6-locekļu heterocikloalkilgrupas, fenilgrupas un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupas, kur  $C_{1-6}$  alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu vai aminogrupu; un 4- līdz 6-locekļu heterocikloalkilgrupa, fenilgrupa un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa savukārt attiecīgi var būt aizvietota vienreiz vai divreiz, vienādi vai dažādi, ar fluora atomu, hlora atomu, bromu atomu, ciāngrupu,  $C_{1-4}$  alkilgrupu, trifluometilgrupu, hidroksilgrupu,  $C_{1-4}$  alkoksigrupu, trifluorometoksigrupu, oksogrupu, aminogrupu, mono- $C_{1-4}$  alkilaminogrupu, di- $C_{1-4}$  alkilaminogrupu, hidroksikarbonilgrupu un/vai  $C_{1-4}$  alkoksikarbonilgrupu; un

 $R^3$  apzīmē ūdeņraža atomu;

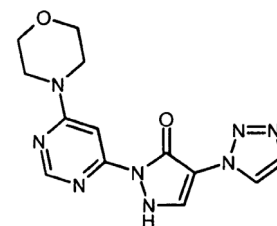
kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

4. 2-(6-morfolin-4-ilpirimidin-4-il)-4-(1H-1,2,3-triazol-1-il)-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-ons saskaņā ar 1. pretenziju ar šādu formulu:

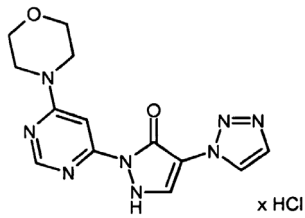


vai viens no tā sāļiem, solvātiem vai sāļu solvātiem.

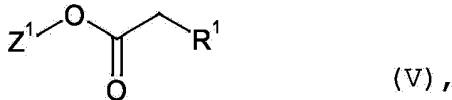
5. 2-(6-morfolin-4-ilpirimidin-4-il)-4-(1H-1,2,3-triazol-1-il)-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-ons saskaņā ar 1. pretenziju ar šādu formulu:



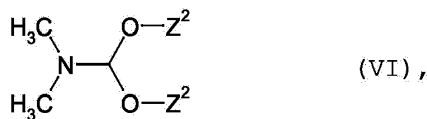
6. 2-(6-morfolin-4-ilpirimidin-4-il)-4-(1H-1,2,3-triazol-1-il)-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on-hidrohlorīds saskaņā ar 1. pretenziju ar šādu formulu:



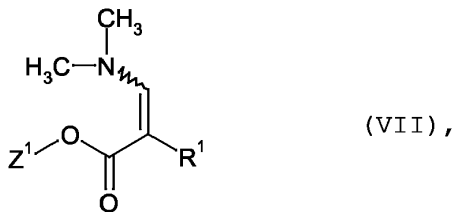
7. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, kur R<sup>3</sup> apzīmē ūdeņraža atomu, iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka vispirms savienojumu ar formulu (V):



kurā R<sup>1</sup> nozīme ir jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai minētā, un Z<sup>1</sup> apzīmē metilgrupu vai etilgrupu, pakļauj kondensācijas reakcijai ar savienojumu ar formulu (VI):



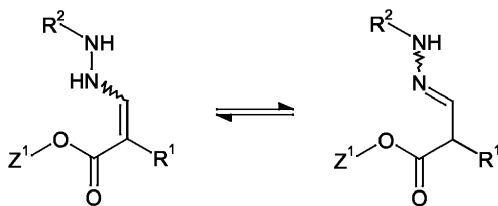
kurā Z<sup>2</sup> apzīmē metilgrupu vai etilgrupu, iegūstot savienojumus ar formulu (VII):



kurā Z<sup>1</sup> un R<sup>1</sup> nozīmes ir iepriekš minētās, un pēc tam tos pakļauj reakcijai skābes klātbūtnē ar savienojumu ar formulu (III):



kurā R<sup>2</sup> nozīme ir jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai minētā, iegūstot savienojumus ar formulu (IV-A):



(IV-A)

kurā Z<sup>1</sup>, R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> nozīmes ir iepriekš minētās, kuri ciklizē jau šādos reakcijas apstākļos vai sekojošā reakcijas stadijā bāzes ietekmē, iegūstot savienojumus ar formulu (I), kur R<sup>3</sup> apzīmē ūdeņraža atomu.

8. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, slimību ārstēšanai un/vai profilaksei.

9. Savienojuma, kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts sirds un asinsvadu saslimšanu, sirds mazspējas, anēmijas, hronisku nieru saslimšanu un nieru mazspējas ārstēšanai un/vai profilaksei.

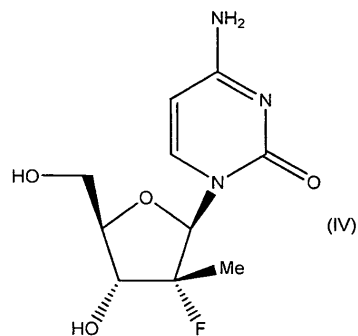
10. Medikaments, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, kombinācijā ar inertu, netoksisku, farmaceutiski pieņemamu palīgvielu.

11. Medikaments, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, kombinācijā ar vienu vai vairākām citām aktīvām vielām, kas izvēlētas no grupas, kas sastāv no ACE-inhibitoriem,

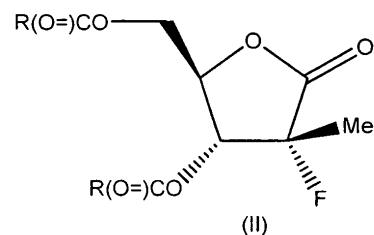
angiotenzīna II receptora antagonistiem, beta-receptoru blokētājiem, kalcija antagonistiem, PDE-inhibitoriem, minerālkortikoīdu receptoru antagonistiem, diurētiskiem līdzekļiem, aspirīna, dzelzi saturošām piedevām, B12 vitamīna un folskābes piedevām, statīna, *digitalis* (digoksīna)-atvasinājumiem, ķīmijterapijas līdzekļiem pret audzējiem un antibiotiķiem.

12. Medikaments saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju, kas paredzēts sirds un asinsvadu saslimšanu, sirds mazspējas, anēmijas, hronisku nieru saslimšanu un nieru mazspējas ārstēšanai un/vai profilaksei.

- (51) **C07H 19/06**<sup>(200601)</sup> (11) **2084174**  
**C07H 5/02**<sup>(200601)</sup>  
(21) 07839369.1 (22) 05.10.2007  
(43) 05.08.2009  
(45) 31.07.2013  
(31) 850962 P (32) 10.10.2006 (33) US  
(86) PCT/US2007/021548 05.10.2007  
(87) WO2008/045419 17.04.2008  
(73) Gilead Pharmasset LLC, c/o Gilead Sciences, Inc, 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US  
F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH  
(72) AXT, Steven D., US  
SARMA, Keshab, US  
VITALE, Justin, US  
ZHU, Jiang, US  
ROSS, Bruce, US  
RACHAKONDA, Suguna, US  
JIN, Qingwu, US  
CHUN, Byoung-kwon, US  
(74) Walker, Ross Thomson, et al, Forresters Skygarden, Erika-Mann-Strasse 11, 80636 München, DE  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
(54) **NUKLEOZĪDU RIBOFURANOZILPIRIMIDĪNU IEGŪŠANA PREPARATION OF NUCLEOSIDES RIBOFURANOSYL PYRIMIDINES**  
(57) 1. Process 4-amino-1-((2R,3R,4R,5R)-3-fluor-4-hidroksi-5-hidroksimetil-3-metil-tetrahydro-furan-2-il)-1H-pirimidin-2-ona ar formulu (IV)

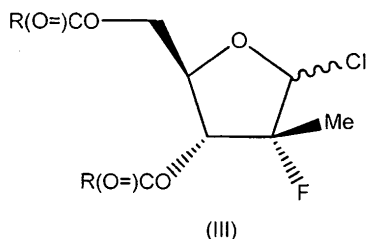


iegūšanai, kas ietver posmus, kuros a) (aril)alkānskābes (2R,3R,4R)-2-(aril)alkanoiloksimetil-4-fluor-4-metil-5-okso-tetrahydro-furan-3-ilesteri ar formulu (II)



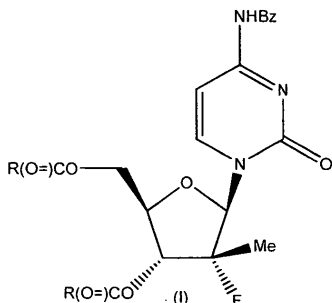
kur R ir arilgrupa vai alkilgrupa, pārvērs (aril)alkānskābes (2R,3R,4R)-2-(aril)alkanoiloksimetil-5-hlor-4-fluor-4-metil-tetrahydro-furan-3-ilesteri ar formulu (III)





kur R ir arilgrupa vai alkilgrupa;

b) (aril)alkānskābes (2R,3R,4R)-2-(aril)alkanoiloksimetil-5-hlor-4-fluor-4-metil-tetrahidro-furan-3-ilesteri ar formulu (III) pārvērš (aril)alkānskābes (2R,3R,4R,5R)-3-(aril)alkanoiloksi-5-(4-benzoil-amino-2-okso-2H-pirimidin-1-il)-4-fluor-4-metil-tetrahidro-furan-2-ilmetilesteri ar formulu (I)



kur R ir arilgrupa vai alkilgrupa, un Bz ir benzoilgrupa, un

c) (aril)alkānskābes (2R,3R,4R,5R)-3-(aril)alkanoiloksi-5-(4-benzoilamino-2-okso-2H-pirimidin-1-il)-4-fluor-4-metil-tetrahidro-furan-2-ilmetilesteri ar formulu (I) hidrolizē, iegūstot 4-amino-1-((2R,3R,4R,5R)-3-fluor-4-hidroksi-5-hidroksimetil-3-metil-tetrahidro-furan-2-il)-1H-pirimidin-2-onu ar formulu (IV).

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka R ir fenilgrupa.

3. Process saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka a) posmā minētā pārvēršana ietver reducēšanu reducēšanas līdzekļa klātbūtnē un pēc tam veicamu hlorēšanu hlorēšanas līdzekļa klātbūtnē.

4. Process saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka reducēšanas līdzeklis ir nātrija bis-(2-metoksietoksi)(2,2,2-trifluor-etoksi)alumīnija hidrīds.

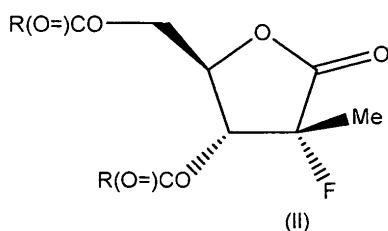
5. Process saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka hlorēšanas līdzekli izvēlas no sulfūrilhlorīda, tionilhlorīda vai fosfora oksihlorīda.

6. Process saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka hlorēšanas līdzeklis ir sulfūrilhlorīds katalītiska daudzuma tetrabutilamonija bromīda klātbūtnē.

7. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka b) posmā pārvēršana ietver (aril)alkānskābes (2R,3R,4R)-2-(aril)alkanoiloksimetil-5-hlor-4-fluor-4-metil-tetrahidro-furan-3-ilesteri ar formulu (III) reakciju ar O-trimētilsilil-N4-benzoil-citosīnu Lūisa skābes klātbūtnē.

8. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka c) posmā hidrolīzi veic bāzes klātbūtnē.

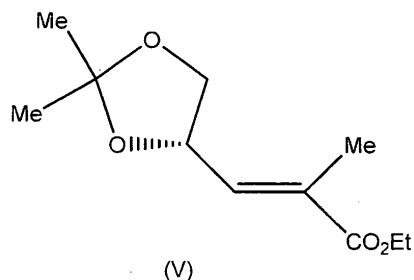
9. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver (aril)alkānskābes (2R,3R,4R)-2-(aril)alkanoiloksimetil-4-fluor-4-metil-5-okso-tetrahidro-furan-3-ilesteri ar formulu (II)



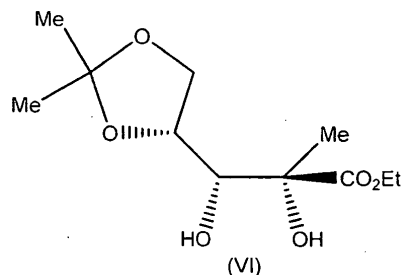
kur R ir fenilgrupa,

iegūšanu, kas ietver posmus, kuros

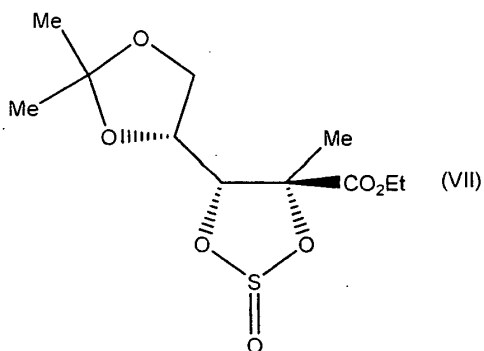
a1) (E)-3-((S)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-il)-2-metakrīlskābes etilesteri ar formulu (V)



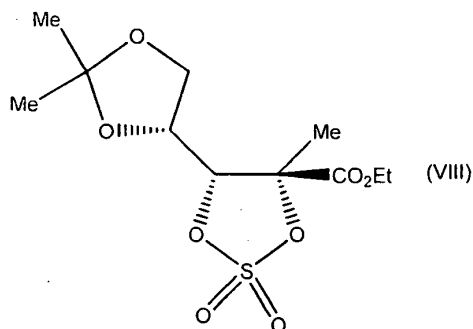
pārvērš (2S,3R)-3-((R)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-il)-2,3-dihidroksi-2-metilpropānskābes etilesteri ar formulu (VI)



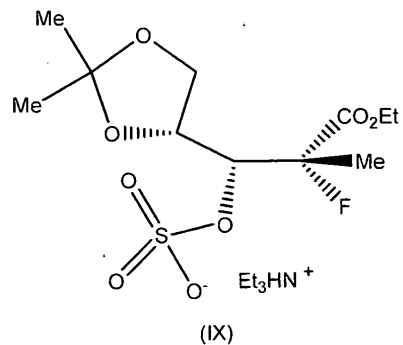
b1) (2S,3R)-3-((R)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-il)-2,3-dihidroksi-2-metil-propānskābes etilesteri ar formulu (VI) pārvērš sulfītā ar formulu (VII)



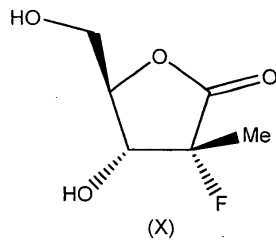
c1) sulfīts ar formulu (VII) pēc tam reaģē līdz sulfātam ar formulu (VIII)



d1) sulfātu ar formulu (VIII) pārvērš fluorhidrīna sulfātā ar formulu (IX)



e1) fluorhidrīna sulfātu ar formulu (IX) sadala, iegūstot laktonu ar formulu (X)



un, beidzot,

f1) laktonu ar formulu (X) acilē, iegūstot galaproduktu ar formulu (II), kur R ir fenilgrupa.

10. Process saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka a1) posmā pārvēršanu veic ar nātrija permanganātu etilēnglikola un nātrija bikarbonāta klātbūtnē.

11. Process saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka b1) posmā pārvēršanu veic ar tionilhlorīdu.

12. Process saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka c1) posmā pārvēršanu veic ar nātrija hipohlorītu.

13. Process saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 12. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka d1) posmā pārvēršanu veic ar trialkilamīnu.

14. Process saskaņā ar 13. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka trietilamīnu izmanto kopā ar trietilamīntrihidrofluorīdu.

15. Process saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 14. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka e1) posmā sadalīšanu veic ar bārija hlorīdu ūdenī.

16. Process saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 15. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka f1) posmā acilēšanu veic ar benzoanhidrīdu.

un atenololu vai vienu no tā hidrātiem, kristāliskām formām vai farmaceutiski pieņemamiem pievienotās skābes sāļiem.

6. Farmaceutiska kompozīcija, kas kā aktīvo ingredientu satur kombināciju saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vienu pašu vai kopā ar vienu vai vairākām farmaceutiski pieņemamām pildvielām.

7. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kuru izmanto medikamenta ražošanā stenokardijas, išēmijas un sirds mazspējas ārstēšanai.

8. Kombinācijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā stenokardijas, išēmijas un sirds mazspējas ārstēšanai.

9. Farmaceutiskās kompozīcijas saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanā stenokardijas, išēmijas un sirds mazspējas ārstēšanai.

- (51) **A61K 31/165<sup>(200601)</sup>** (11) **2090303**  
**A61K 31/55<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 9/10<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 9/04<sup>(200601)</sup>**
- (21) 09290099.2 (22) 12.02.2009  
(43) 19.08.2009  
(45) 01.05.2013  
(31) 0800800 (32) 14.02.2008 (33) FR  
(73) Les Laboratoires Servier, 35, rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR  
(72) LEREBOURS, Guy, FR  
CALVET, Jean-Henri, FR  
(74) Bestel, Delphine, et al, Les Laboratoires Servier Direction Brevets, 35 rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
(54) **SINUSA MEZGLA I<sub>1</sub> STRĀVAS INHIBITORA UN BETA-BLOKATORA KOMBINĀCIJA**  
**ASSOCIATION OF A SINUS CURRENT INHIBITOR I<sub>1</sub> AND A BETA BLOCKER**

(57) 1. Sinusa mezgla I<sub>1</sub> strāvas inhibitora un beta-blokatora kombinācija, kas raksturīga ar to, ka sinusa mezgla I<sub>1</sub> strāvas inhibitors ir ivabradīns un beta-blokators ir bisoprolols.

2. Kombinācija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka sinusa mezgla I<sub>1</sub> strāvas inhibitors ir ivabradīns jeb 3-{3-[[[(7S)-3,4-dimetoksibiciklo[4.2.0]okta-1,3,5-trien-7-il]metil](metil)amino]propil]-7,8-dimetoksi-1,3,4,5-tetrahidro-2H-3-benzazepin-2-ons vai viens no tā hidrātiem, kristāliskām formām vai farmaceutiski pieņemamiem pievienotās skābes sāļiem.

3. Kombinācija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka sinusa mezgla I<sub>1</sub> strāvas inhibitors ir ivabradīns jeb 3-{3-[[[(7S)-3,4-dimetoksibiciklo[4.2.0]okta-1,3,5-trien-7-il]metil](metil)amino]propil]-7,8-dimetoksi-1,3,4,5-tetrahidro-2H-3-benzazepin-2-ona hidrohlorīds vai viens no tā hidrātiem vai kristāliskām formām.

4. Kombinācija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka beta-blokators ir atenolols vai viens no tā hidrātiem, kristāliskām formām vai farmaceutiski pieņemamiem pievienotās skābes sāļiem.

5. Kombinācija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā satur ivabradīnu vai vienu no tā hidrātiem, kristāliskām formām vai farmaceutiski pieņemamiem pievienotās skābes sāļiem

- (51) **A61K 31/48<sup>(200601)</sup>** (11) **2091537**  
**A61K 31/00<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 9/10<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 9/08<sup>(200601)</sup>**
- (21) 07846885.7 (22) 23.11.2007  
(43) 26.08.2009  
(45) 22.05.2013  
(31) 06024308 (32) 23.11.2006 (33) EP  
06025263 06.12.2006 EP  
(86) PCT/EP2007/010360 23.11.2007  
(87) WO2008/061805 29.05.2008  
(73) Sinoxa Pharma GmbH, Königin Luise Strasse 27, 14195 Berlin, DE

- (72) REITER, Rudolf, CH  
TACK, Johannes, DE  
HOROWSKI, Reinhard, DE  
(74) Kilger, Ute, et al, Forrester & Boehmert, Pettenkoferstrasse 20-22, 80336 München, DE  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
(54) **FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS KAPILĀRĀS ARTERIOPĀTIJAS ĀRSTĒŠANAI**  
**PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS FOR THE TREATMENT OF CAPILLARY ARTERIOPATHY**

(57) 1. Lisurīds vai tergurīds, kā arī tā sāļi, enantiomēri, enantiomēru maisījumi, diastereomēri, diastereomēru maisījumi, hidrāti, solvāti un racemāti, kurus izmanto pulmonālās arteriālās hipertensijas, endogēni izraisītās vai eksogēni izraisītās glomerulosklerozes un sekundārā Reino sindroma ārstēšanā un profilaksē.

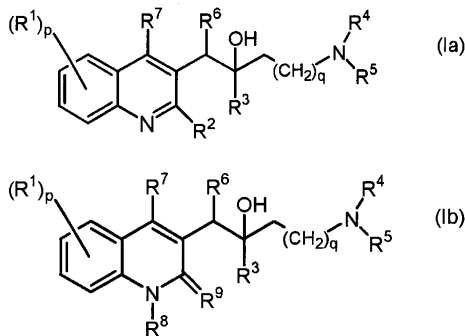
2. Lisurīda vai tergurīda, kā arī tā sāļu, enantiomēru, enantiomēru maisījumu, diastereomēru, diastereomēru maisījumu, hidrātu, solvātu un racemātu izmantošana farmaceutiskas kompozīcijas iegūšanai pulmonālās arteriālās hipertensijas, endogēni izraisītās vai eksogēni izraisītās glomerulosklerozes un sekundārā Reino sindroma ārstēšanai un profilaksei.

3. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vismaz vienu lisurīda vai tergurīda savienojumu, kā arī tā sāļus, enantiomērus, enantiomēru maisījumus, diastereomērus, diastereomēru maisījumus, hidrātus, solvātus un racemātus ar aktīvās vielas koncentrāciju no 0,1 mg līdz 10 mg vienreizējā devā kopā ar farmakoloģiski pieņemamiem nesējiem, palīgvielām un/vai šķīdinātājiem, kuru izmanto pulmonālās arteriālās hipertensijas, endogēni izraisītās vai eksogēni izraisītās glomerulosklerozes un sekundārā Reino sindroma ārstēšanā un profilaksē.

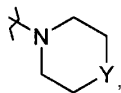
4. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto saskaņā ar 3. pretenziju, kur farmaceutiskā kompozīcija ir piemērota perorālai, sublingvālai, parenterālai ievadīšanai, lietošanai uz ādas, aiz vaiga, iekļūšanai caur ādu, subkutānai ievadīšanai, ievadīšanai inhalācijas veidā, intranazālai ievadīšanai.

5. Farmaceutiskā kompozīcija, kuru izmanto saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju, tablešu, apvalkotu tablešu, kapsulu, ilgstošas darbības tablešu, supozitoriju, mikrosastāvu, nanosastāvu, liposomu sastāvu, pilienu, deguna pilienu, nazālu aerosolu, aerosolu, ampulu, šķīdumu, emulsiju, suspensiju, pulveru, inhalācijas pulveru, mikrokristālistisku sastāvu, inhalācijas aerosolu, transdermālu sistēmu vai subkutānu sastāvu veidā.

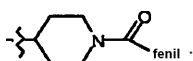
- (51) **C07D 215/22**<sup>(200601)</sup> (11) **2099760**  
**C07D 401/06**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 401/10**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 405/06**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 405/10**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 409/10**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/435**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 31/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 07847812.0 (22) 04.12.2007  
(43) 16.09.2009  
(45) 20.02.2013  
(31) 06125510 (32) 06.12.2006 (33) EP  
(86) PCT/EP2007/063314 04.12.2007  
(87) WO2008/068268 12.06.2008  
(73) Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE  
(72) GUILLEMONT, Jérôme Emile Georges, FR  
DORANGE, Ismet, SE  
MOTTE, Magali Madeleine Simone, FR  
ANDRIES, Koenraad Jozef Lodewijk Marcel, BE  
KOUL, Anil, BE  
(74) Vervoort, Liesbeth, Janssen Pharmaceutica N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE  
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
(54) **ANTIBAKTERIĀLIE HINOLĪNA ATVASINĀJUMI**  
**ANTIBACTERIAL QUINOLINE DERIVATIVES**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (1a) vai (1b)



ieskaitot tā jebkuru stereoķīmiski izomēru formu, kur p ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 1, 2, 3 vai 4; q ir vesels skaitlis, kas ir vienlīdzīgs 0, 1, 2, 3 vai 4; R<sup>1</sup> ir ūdeņraža atoms, ciāngrupa, halogēna atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, hidroksilgrupa, alkiloksigrupa, alkiltiogrupa, alkiltioalkilgrupa, arilalkilgrupa, di(aril)alkilgrupa, arilgrupa vai Het; R<sup>2</sup> ir ūdeņraža atoms, alkiloksigrupa, arilgrupa, ariloksigrupa, hidroksilgrupa, merkaptogrupa, alkiloksialkiloksigrupa, alkiltiogrupa, mono- vai di(alkil)aminogrupa, pirolidinogrupa vai atlikums ar formulu:

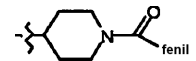


kur Y ir CH<sub>2</sub>, O, S, NH vai N-alkilgrupa; R<sup>3</sup> ir alkilgrupa, arilalkilgrupa, aril-O-alkilgrupa, aril-alkil-O-alkilgrupa, arilgrupa, aril-arilgrupa, Het, Het-alkilgrupa, Het-O-alkilgrupa, Het-alkil-O-alkilgrupa vai



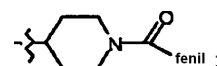
R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa vai benzilgrupa; vai R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup>, ņemti kopā un ieskaitot slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, var veidot atlikumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no pirolidinilgrupas, 2-pirolinilgrupas, 3-pirolinilgrupas, pirolilgrupas, imidazolidinilgrupas, pirazolidinilgrupas, 2-imidazolinilgrupas, 2-pirazolilgrupas, imidazolilgrupas, pirazolilgrupas, triazolilgrupas, piperidinilgrupas, piridinilgrupas, piperazinilgrupas, imidazolidinilgrupas, piridazinilgrupas, pirimidinilgrupas, pirazinilgrupas, triazinilgrupas, morfolinilgrupas un tiomorfolinilgrupas, katrs atlikums

ir neobligāti aizvietots ar alkilgrupu, halogēna atomu, halogēnalkilgrupu, hidroksilgrupu, alkiloksigrupu, aminogrupu, mono- vai dialkilaminogrupu, alkiltiogrupu, alkiloksialkilgrupu, alkiltioalkilgrupu un pirolidinilgrupu; R<sup>6</sup> ir aril'grupa vai Het; R<sup>7</sup> ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, alkilgrupa, arilgrupa vai Het; R<sup>8</sup> ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa; R<sup>9</sup> ir oksogrupa; vai R<sup>8</sup> un R<sup>9</sup> kopā veido atlikumu -CH=CH-N=; arilgrupa ir homocikls, kas ir izvēlēts no fenilgrupas, naftilgrupas, acenaftilgrupas vai tetrahidronaftilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no hidroksilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, aminogrupas, mono- vai dialkilaminogrupas, alkilgrupas, C<sub>2-6</sub>alkenilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar fenilgrupu, halogēnalkilgrupas, alkiloksigrupas, halogēnalkiloksigrupas, karboksilgrupas, alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, morfolinilgrupas vai mono- vai dialkilaminokarbonilgrupas; aril'grupa ir homocikls, kas ir izvēlēts no fenilgrupas, naftilgrupas, acenaftilgrupas vai tetrahidronaftilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no hidroksilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, aminogrupas, mono- vai dialkilaminogrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, alkiloksigrupas, alkiltiogrupas, halogēnalkiloksigrupas, karboksilgrupas, alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, morfolinilgrupas, Het vai mono- vai dialkilaminokarbonilgrupas; Het ir monociklisks heterocikls, kas ir izvēlēts no N-fenoksipiperidinilgrupas, piperidinilgrupas, pirolilgrupas, pirazolilgrupas, imidazolilgrupas, furanilgrupas, tienilgrupas, oksazolilgrupas, izoksazolilgrupas, tiazolilgrupas, izotiazolilgrupas, piridinilgrupas, pirimidinilgrupas, pirazinilgrupas vai piridazinilgrupas; vai biciklisks heterocikls, kas izvēlēts no hinolinilgrupas, hinoksalinilgrupas, indolilgrupas, benzimidazolilgrupas, benzoksazolilgrupas, benzizoksazolilgrupas, benzotiazolilgrupas, benzizotiazolilgrupas, benzofuranilgrupas, benzotienilgrupas, 2,3-dihidrobenzo[1,4]dioksiniilgrupas vai benzo[1,3]dioksoliilgrupas; katrs monociklisks un biciklisks heterocikls ir neobligāti aizvietots ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkilgrupas vai alkiloksigrupas; ar nosacījumu, ka tad, kad R<sup>3</sup> ir alkilgrupa, arilalkilgrupa, arilgrupa, Het, Het-alkilgrupa vai



R<sup>6</sup> ir Het; fenilgrupa, kas ir aizvietota ar Het; naftilgrupa, kas ir aizvietota ar Het; vai acenaftilgrupa vai tetrahidronaftilgrupa, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no hidroksilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, aminogrupas, mono- vai dialkilaminogrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, alkiloksigrupas, alkiltiogrupas, halogēnalkiloksigrupas, karboksilgrupas, alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, morfolinilgrupas, Het vai mono- vai dialkilaminokarbonilgrupas; tā N-oksīds, tā farmaceitiski pieņemams sāls vai tā solvāts, un kur alkilgrupa, kas šeit ir izmantota, apzīmē lineāru vai sazarotu piesātinātu ogļūdeņraža atlikumu ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem; vai ir ciklisks piesātināts ogļūdeņraža atlikums ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem; vai ir ciklisks piesātināts ogļūdeņraža atlikums ar 3 līdz 6 oglekļa atomiem kas ir pievienoti lineāram vai sazarotam piesātinātam ogļūdeņraža atlikumam ar 1 līdz 6 oglekļa atomiem; un kur katrs oglekļa atoms var būt neobligāti aizvietots ar ciāngrupu, hidroksilgrupu, C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupu vai oksogrupu.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>3</sup> ir alkilgrupa, arilalkilgrupa, aril-O-alkilgrupa, aril-alkil-O-alkilgrupa, arilgrupa, Het, Het-alkilgrupa, Het-O-alkilgrupa, Het-alkil-O-alkilgrupa vai



arilgrupa ir homocikls, kas ir izvēlēts no fenilgrupas, naftilgrupas, acenaftilgrupas vai tetrahidronaftilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, katrs aizvietotājs ir neatkarīgi izvēlēts no hidroksilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas,

nitrogrupas, aminogrupas, mono- vai dialkilaminogrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, alkiloksigrupas, halogēnalkiloksigrupas, karboksilgrupas, alkiloksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, morfolinilgrupas vai mono- vai dialkilaminokarbonilgrupas.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur alkilgrupa apzīmē  $C_{1-6}$  alkilgrupu.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^1$  ir halogēna atoms.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $p$  ir vienlīdzīgs 1.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^2$  ir  $C_{1-6}$  alkiloksigrupa.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur  $R^2$  ir metiloksigrupa.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^3$  ir aril- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa, aril- $C_{1-6}$  alkil- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa, aril-arilgrupa, Het- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa vai Het- $C_{1-6}$  alkil- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa.

9. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur  $R^3$  ir aril- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa, aril- $C_{1-6}$  alkil- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa, Het- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa vai Het- $C_{1-6}$  alkil- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa.

10. Savienojums saskaņā ar 9. pretenziju, kur  $R^3$  ir aril- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa vai aril- $C_{1-6}$  alkil- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur  $R^3$  ir arilgrupa.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $q$  ir vienlīdzīgs 1, 3 vai 4.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^4$  un  $R^5$  apzīmē  $C_{1-6}$  alkilgrupu, vai kur  $R^4$  un  $R^5$  ir ņemti kopā ar slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, un veido atlikumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no piperidinogrupas vai piperazinogrupas, katrs no minētajiem gredzeniem ir neobligāti aizvietots ar  $C_{1-6}$  alkilgrupu.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^6$  ir Het vai neobligāti aizvietota fenilgrupa.

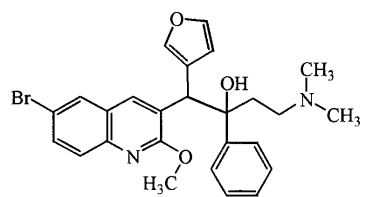
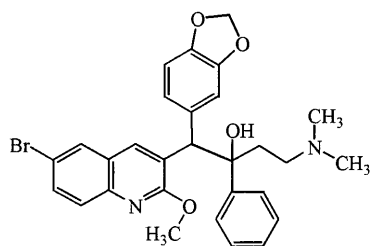
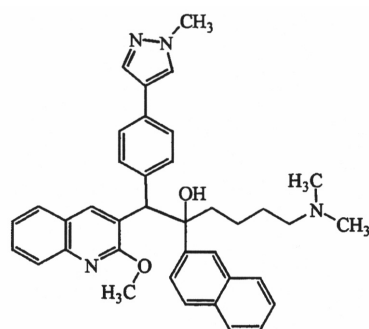
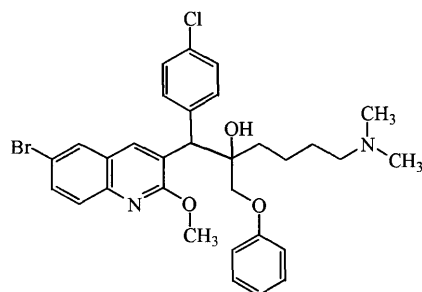
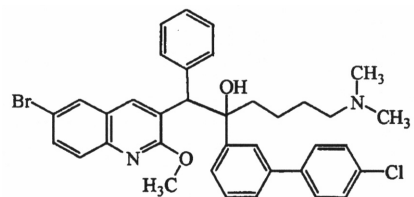
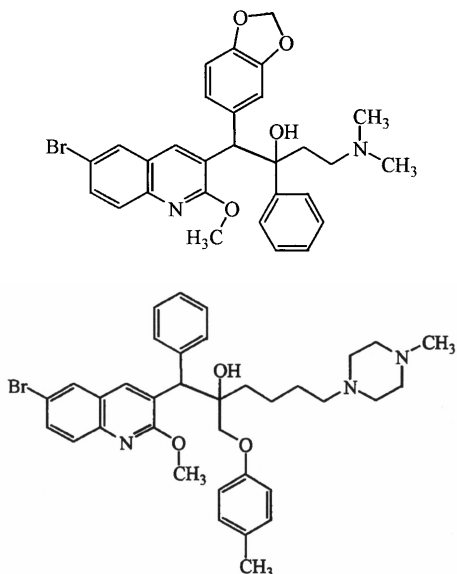
15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^7$  ir ūdeņraža atoms.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur savienojums ir savienojums ar formulu (Ia).

17. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ir savienojums ar formulu (Ia), kur  $R^1$  ir ūdeņraža vai halogēna atoms;  $R^2$  ir  $C_{1-6}$  alkiloksigrupa;  $R^3$  ir aril- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa, aril- $C_{1-6}$  alkil- $O-C_{1-6}$  alkilgrupa, arilgrupa vai aril-arilgrupa;  $R^4$  un  $R^5$  ir  $C_{1-6}$  alkilgrupas; vai  $R^4$  un  $R^5$  kopā ar slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido atlikumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no piperidinogrupas vai piperazinogrupas, katrs no minētajiem gredzeniem ir neobligāti aizvietots ar  $C_{1-6}$  alkilgrupu;  $R^6$  ir Het vai neobligāti aizvietota fenilgrupa;  $R^7$  ir ūdeņraža atoms;  $q$  ir 1, 3 vai 4;  $p$  ir 1.

18. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur  $R^1$  atrodas hinolīna gredzena 6. pozīcijā.

19. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ir izvēlēts no:



ieskaitot tā jebkuru stereoķīmiski izomēru formu, tā  $N$ -oksīdu, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā solvātu.

20. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām izmantošanai par medikamentu.

21. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 19. pretenzijai izmantošanai par medikamentu bakteriālas infekcijas ārstēšanā.

22. Farmaceutiska kompozīcija, kurā ietilpst farmaceutiski pieņemams nesējs un kā aktīvais ingredients savienojuma, kā definēts jebkurā pretenzijā no 1. līdz 19., terapeitiski efektīvs daudzums.

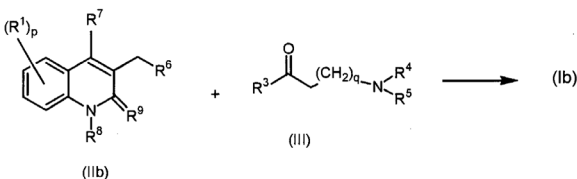
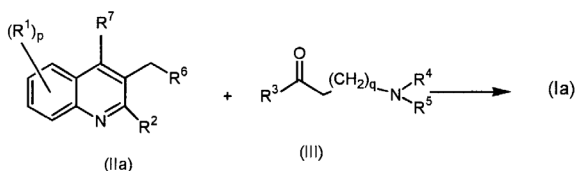
23. Savienojums saskaņā ar 21. pretenziju, kur bakteriālā infekcija ir infekcija ar gram-pozitīvu baktēriju.

24. Savienojums saskaņā ar 23. pretenziju, kur gram-pozitīvā baktērija ir *Streptococcus pneumonia* vai *Staphylococcus aureus*.

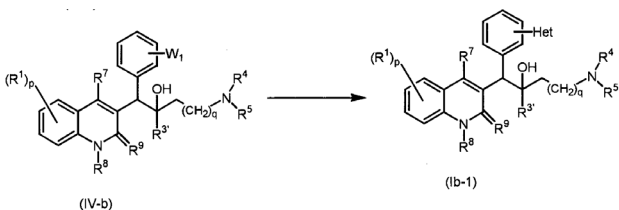
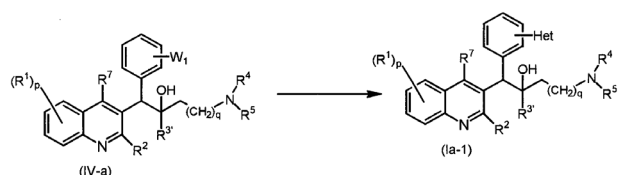
25. Paņēmieni savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka

a) starpprodukts ar formulu (IIa) vai (IIb) tiek pakļauts reakcijai ar starpproduktu ar formulu (III) saskaņā ar šādu reakcijas shēmu:

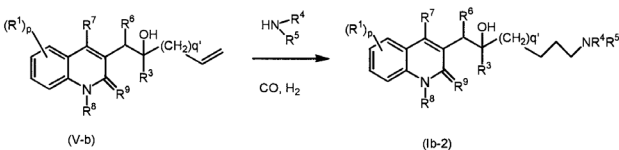
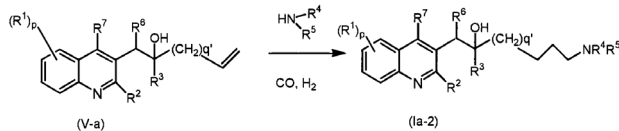




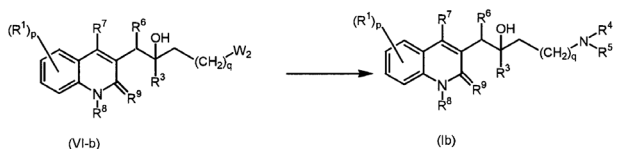
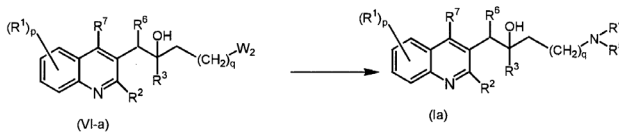
izmantojot nBuLi piemērotas bāzes un piemērota šķīdinātāja maisījumā, kur visi mainīgie lielumi ir, kā definēts 1. pretenzijā; b) starpprodukts ar formulu (IV-a) vai (IV-b), kur W<sup>1</sup> apzīmē piemērotu aizejošo grupu, tiek pakļauts reakcijai ar Het-B(OH)<sub>2</sub> piemērota katalizatora, piemērotas bāzes un piemērota šķīdinātāja klātbūtnē, saskaņā ar šādu reakcijas shēmu:



kur visi mainīgie lielumi ir, kā definēts 1. pretenzijā, un kur R<sup>3</sup> apzīmē alkilgrupu, arilalkilgrupu, arilgrupu, Het, Het-alkilgrupu; c) starpprodukts ar formulu (V-a) vai (V-b), kur q' ir 0, 1 vai 2, tiek pakļauts reakcijai ar pirmējo vai otrējo amīnu HNR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> piemērota katalizatora klātbūtnē, neobligāti otra katalizatora klātbūtnē (reducēšanai), piemērota liganda klātbūtnē, piemērotā šķīdinātājā, CO un H<sub>2</sub> klātbūtnē (zem spiediena),



kur visi mainīgie lielumi ir, kā definēts 1. pretenzijā; d) starpprodukts ar formulu (VI-a) vai (VI-b), kur W<sub>2</sub> apzīmē piemērotu aizejošo grupu, tiek pakļauts reakcijai ar piemērotu pirmējo vai otrējo amīnu HNR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> neobligāti piemērota šķīdinātāja klātbūtnē



kur visi mainīgie lielumi ir, kā definēts 1. pretenzijā; vai, ja vēlams, savienojumi ar formulu (Ia) vai (Ib) tiek pārvērsti viens otrā ar zināmām pārvēršanas metodēm un tālāk, ja vēlams, savienojumi ar formulu (Ia) vai (Ib) tiek pārvērsti terapeitiski aktīvā netoksiskā pievienotas skābes sāļi, apstrādājot ar skābi, vai terapeitiski aktīvā netoksiskā pievienotas bāzes sāļi, apstrādājot ar bāzi, vai pretēji, pievienotas skābes sāls forma tiek pārvērsta brīvā bāzē, apstrādājot ar sārmu, vai pievienotas bāzes sāls tiek pārvērsts brīvā skābē, apstrādājot ar skābi; un, ja vēlams, tiek iegūtas to stereoķīmiski izomēras formas, ceturtēji amīni vai N-oksīdu formas.

26. Kombinācija, kurā ietilpst (a) savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 19. pretenzijai un (b) viens vai vairāki citi antibakteriāli līdzekļi.

27. Produkts, kas satur (a) savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 19. pretenzijai un (b) vienu vai vairākus citus antibakteriālus līdzekļus, kā kombinēts preparāts vienlaicīgi, atsevišķi vai secīgi izmantošanai bakteriālas infekcijas ārstēšanai.

28. Savienojums saskaņā ar 24. pretenziju, kur gram-pozitīvā baktērija ir pret meticilīnu rezistents *Staphylococcus aureus*.

29. Savienojums saskaņā ar 21. pretenziju, kur bakteriālā infekcija ir infekcija ar *Mycobacterium tuberculosis*.

- (51) **C07K 16/28**<sup>(200601)</sup> (11) **2101877**
- A61K 39/395**<sup>(200601)</sup>
- A61P 35/00**<sup>(200601)</sup>
- A61K 38/17**<sup>(200601)</sup>
- A61K 31/7088**<sup>(200601)</sup>
- (21) 07857153.6 (22) 28.12.2007
- (43) 23.09.2009
- (45) 19.06.2013
- (31) 877367 P (32) 28.12.2006 (33) US
- (86) PCT/EP2007/011461 28.12.2007
- (87) WO2008/080623 10.07.2008
- (73) Deutsches Krebsforschungszentrum, Stiftung des öffentlichen Rechts, Im Neuenheimer Feld 280, 69120 Heidelberg, DE  
Universitätsklinikum Heidelberg, Im Neuenheimer Feld 672, 69120 Heidelberg, DE
- (72) MARTIN-VILLALBA, Ana, DE  
KLEBER, Susanne, DE  
WIESTLER, Benedikt, DE  
KRAMMER, Peter, G., DE  
HEROLD-MENDE, Christel, DE  
SANCHO-MARTINEZ, Ignacio, US
- (74) Weiss, Wolfgang, et al, Weickmann & Weickmann, Patentanwälte, Postfach 86 08 20, 81635 München, DE  
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **CD95 AKTIVITĀTES NEITRALIZĒŠANA GLIOBLASTOMAS ŠŪNU INVĀZIJAS BLOKĒŠANAI IN VIVO**  
**NEUTRALIZATION OF CD95 ACTIVITY BLOCKS INVASION OF GLIOBLASTOMA CELLS IN VIVO**

(57) 1. Medikaments izmantošanai indivīda ar augstas pakāpes gliomu ārstēšanā, kas satur aģentu, kas neitralizē CD95 aktivitāti, neļaujot CD95 saistīties ar CD95L vai sagraujot CD95/CD95L kompleksu,

turklāt augstās pakāpes glioma ir PVO klasifikācijas IV pakāpes glioma, turklāt aģents ir CD95 vai CD95L inhibitors, kas ir izvēlēts no (a) inhibējošas anti-CD95L antivielas vai tās funkcionāla fragmenta, (b) šķīstošas CD95 molekulas vai tās CD95L saistošas daļas, (c) CD95L inhibitora, kas izvēlēts no FLINT, DcR3 vai to fragmentiem,

(d) antivielas, kas saitās ar CD95, vai tās funkcionāla fragmenta, (e) antisensām molekulām, RNSi molekulām un ribozīmiem, kas ir spējīgi inhibēt CD95 ekspresiju, un (f) sapludināta proteīna, kas satur ārpusšūnas CD95 domēnu un cilvēka Fc domēnu.

2. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir anti-CD95L antivielas, kas saistās ar CD95L.

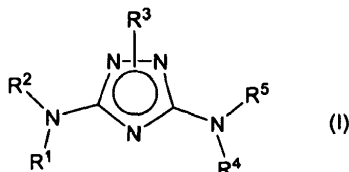
3. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt savienojums ir anti-CD95L antivielas, kas saistās ar CD95L.

4. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt aģents ir šķīstoša CD95 receptora molekula vai tās daļa, kas saistās ar CD95 ligandu.

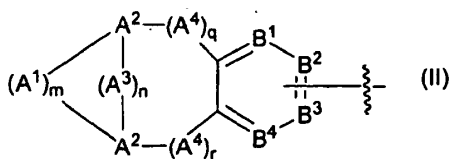
5. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt aģents ir sapludinātais proteīns, kas satur ārpusšūnas CD95 domēnu un cilvēka Fc domēnu.

6. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt sapludinātais proteīns ir APG101, kā parādīts SEQ ID NO: 1.

- (51) **C07D 495/04**<sup>(200601)</sup> (11) **2114955**  
**A61K 31/4196**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 19/00**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 249/14**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 401/04**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 401/14**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 403/04**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 403/14**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 491/04**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 471/18**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 401/12**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 403/12**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 409/14**<sup>(200601)</sup>
- (21) 07866125.3 (22) 28.12.2007  
(43) 11.11.2009  
(45) 13.02.2013  
(31) 882783 P (32) 29.12.2006 (33) US  
981053 P 18.10.2007 US  
(86) PCT/US2007/089156 28.12.2007  
(87) WO2008/083357 10.07.2008  
(73) Rigel Pharmaceuticals, Inc., 1180 Veterans Boulevard, South San Francisco, CA 94080, US  
(72) GOFF, Dane, US  
ZHANG, Jing, US  
SINGH, Rajinder, US  
HOLLAND, Sacha, US  
DING, Pingyu, US  
YU, Jiaxin, US  
LITVAK, Joane, US  
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Anwaltssozietāt, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE  
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
(54) **TRIAZOLI, KAS AIZVIETOTI AR BICIKLISKU CAUR TILTIŅU SAVIENOTU ARILGRUPU UN BICIKLISKU CAUR TILTIŅU SAVIENOTU HETEROARILGRUPU IZMANTOŠANAI PAR AXL INHIBITORIEM BRIDGED BICYCLIC ARYL AND BRIDGED BICYCLIC HETEROARYL SUBSTITUTED TRIAZOLES USEFUL AS AXL INHIBITORS**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kur:  
R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, arilgrupas, aralkilgrupas, -C(O)R<sup>9</sup> vai -C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>;  
R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> katrs neatkarīgi ir caur tiltiņu savienota bicikliska arilgrupa vai caur tiltiņu savienota bicikliska heteroarilgrupa ar formulu (II):



kur:  
m un n neatkarīgi ir no 1 līdz 4;  
q un r neatkarīgi ir no 0 līdz 3;  
A<sup>1</sup>, A<sup>3</sup> un A<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>, O, S(O)<sub>p</sub> (kur p ir 0, 1 vai 2), P(O)<sub>p</sub> (kur p ir 0, 1 vai 2) un N(R<sup>9</sup>);

katrs A<sup>2</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>) un N; B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>13</sup>) un N, ar nosacījumu, ka viens no B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> ir oglekļa atoms, kas ir tieši saistīts ar slāpekļa atomu, kuram attiecīgs R<sup>2</sup> vai R<sup>3</sup> ir pievienots;

vai R<sup>2</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no: caur tiltiņu savienotas bicikliskas arilgrupas ar formulu (II) un caur tiltiņu savienotas bicikliskas heteroarilgrupas ar formulu (II), kā definēts iepriekš, un R<sup>3</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, kur katra arilgrupa un heteroarilgrupa neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkinilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R<sup>15</sup>-OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-OC(O)-R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>OR<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>14</sup> ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa, un katrs R<sup>15</sup> ir neatkarīgi tieša saite vai lineāra vai sazarota alkilēnķēde vai alkenilēnķēde;

vai R<sup>2</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkinilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R<sup>15</sup>-OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-OC(O)-R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>OR<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>14</sup> ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa, un katrs R<sup>15</sup> ir neatkarīgi tieša saite vai lineāra vai sazarota alkilēnķēde vai alkenilēnķēde;

un R<sup>3</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no caur tiltiņu savienotas bicikliskas arilgrupas ar formulu (II) un caur tiltiņu savienotas bicikliskas heteroarilgrupas ar formulu (II), kā definēts iepriekš; katrs R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> ir neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkinilgrupas, hidroksialkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas

heteroarilalkilgrupas,  $-R^{11}-OR^9$ ,  $-R^{11}-CN$ ,  $-R^{11}-NO_2$ ,  $-R^{11}-N(R^9)_2$ ,  $-R^{11}-C(O)OR^9$  un  $-R^{11}-C(O)N(R^9)_2$ , vai jebkurš  $R^6$  un  $R^7$ , kopā ar kopējo slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido neobligāti aizvietotu *N*-heteroarilgrupu vai neobligāti aizvietotu *N*-heterociklilgrupu;

katrs  $R^8$  neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas,  $-R^{10}-OR^9$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-OR^9$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-OR^9$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-CN$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-C(O)OR^9$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-C(O)N(R^6)R^7$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-S(O)R^9$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2),  $-R^{10}-OR^{11}-N(R^6)R^7$ ,  $-R^{10}-OR^{11}-C(NR^{12})N(R^{12})H$ ,  $-R^{10}-OC(O)-R^9$ ,  $-R^{10}-N(R^6)R^7$ ,  $-R^{10}-C(O)R^9$ ,  $-R^{10}-C(O)OR^9$ ,  $-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ ,  $-R^{10}-N(R^6)C(O)OR^{14}$ ,  $-R^{10}-N(R^6)C(O)R^9$ ,  $-R^{10}-N(R^6)S(O)R^9$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-R^{10}-S(O)OR^9$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-R^{10}-S(O)_pR^9$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2) un  $-R^{10}-S(O)_iN(R^6)R^7$  (kur *t* ir 1 vai 2), vai divi atlikumi  $R^8$  pie blakusesošiem oglekļa atomiem var būt apvienoti, lai veidotu dubultsaiti;

katrs  $R^9$  neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkililgrupas, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkililgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkililgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkililgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkililgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkililgrupas,

katrs  $R^{10}$  neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites, neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkilēnķēdes, neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkenilēnķēdes un neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkinilēnķēdes;

katrs  $R^{11}$  neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkilēnķēdes, neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkenilēnķēdes un neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkinilēnķēdes;

katrs  $R^{12}$  ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, ciāngrupa, nitrogrupa vai  $-OR^9$ ; un

katrs  $R^{13}$  neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas,  $-R^{10}-OR^9$ ,  $-R^{10}-OC(O)-R^9$ ,  $-R^{10}-N(R^6)R^7$ ,  $-R^{10}-C(O)R^9$ ,  $-R^{10}-C(O)OR^9$ ,  $-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ ,  $-R^{10}-N(R^6)C(O)OR^{14}$ ,  $-R^{10}-N(R^6)C(O)R^9$ ,  $-R^{10}-N(R^6)S(O)R^9$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-R^{10}-S(O)OR^9$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-R^{10}-S(O)_pR^9$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2) un  $-R^{10}-S(O)_iN(R^6)R^7$  (kur *t* ir 1 vai 2);

kā izolēts stereocentrs vai tā maisījums, vai kā tā farmaceutiski pieņemams sāls;

kur „alkil” apzīmē atlikumu ar lineāru vai sazarotu ogļūdeņraža ķēdi, kas sastāv vienīgi no oglekļa un ūdeņraža atomiem, kas nesatur nepiesātinātās saites, kas satur no viena līdz divpadsmit oglekļa atomiem, un kas ir pievienots molekulas atlikumam ar vienkāršu saiti, kur alkilatlikums var būt neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem no sekojošiem aizvietotājiem: halogēna atomu, ciāngrupu, nitrogrupu, oksogrupu, tioksogrupu, trimetilsilanilgrupu,  $-OR^{20}$ ,  $-OC(O)-R^{20}$ ,  $-N(R^{20})_2$ ,  $-C(O)R^{20}$ ,  $-C(O)OR^{20}$ ,  $-C(O)N(R^{20})_2$ ,  $N(R^{20})C(O)OR^{20}$ ,  $-N(R^{20})C(O)R^{20}$ ,  $-N(R^{20})S(O)R^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)OR^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)_pR^{20}$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2) un  $-S(O)_iN(R^{20})_2$  (kur *t* ir 1 vai 2), kur katrs  $R^{20}$  neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa;

„alkenil” apzīmē atlikumu ar lineāru vai sazarotu ogļūdeņraža ķēdi, kas sastāv vienīgi no oglekļa un ūdeņraža atomiem, kas satur vismaz vienu dubultsaiti, kas satur no diviem līdz divpadsmit

oglekļa atomiem, un kas ir pievienots molekulas atlikumam ar vienkāršu saiti, kur alkenilatlikums var būt neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem no sekojošiem aizvietotājiem: halogēna atomu, ciāngrupu, nitrogrupu, oksogrupu, tioksogrupu, trimetilsilanilgrupu,  $-OR^{20}$ ,  $-OC(O)-R^{20}$ ,  $-N(R^{20})_2$ ,  $-C(O)R^{20}$ ,  $-C(O)OR^{20}$ ,  $-C(O)N(R^{20})_2$ ,  $-N(R^{20})C(O)OR^{20}$ ,  $-N(R^{20})C(O)R^{20}$ ,  $-N(R^{20})S(O)R^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)OR^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)_pR^{20}$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2) un  $-S(O)_iN(R^{20})_2$  (kur *t* ir 1 vai 2), kur katrs  $R^{20}$  ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa;

„alkinil” apzīmē atlikumu ar lineāru vai sazarotu ogļūdeņraža ķēdi, kas sastāv vienīgi no oglekļa un ūdeņraža atomiem, kas satur vismaz vienu trīskāršu saiti, kas neobligāti satur vismaz vienu dubultsaiti, kas satur no diviem līdz divpadsmit oglekļa atomiem, un kas ir pievienots molekulas atlikumam ar vienkāršu saiti, kur alkinilatlikums var būt neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem no sekojošiem aizvietotājiem: halogēna atomu, ciāngrupu, nitrogrupu, oksogrupu, tioksogrupu, trimetilsilanilgrupu,  $-OR^{20}$ ,  $-OC(O)-R^{20}$ ,  $-N(R^{20})_2$ ,  $-C(O)R^{20}$ ,  $-C(O)OR^{20}$ ,  $-C(O)N(R^{20})_2$ ,  $-N(R^{20})C(O)OR^{20}$ ,  $-N(R^{20})C(O)R^{20}$ ,  $-N(R^{20})S(O)R^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)OR^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2) un  $-S(O)_iN(R^{20})_2$  (kur *t* ir 1 vai 2), kur katrs  $R^{20}$  ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa;

„alkilēn” vai „alkilēnķēde” apzīmē lineāru vai sazarotu divvērtīgu ogļūdeņraža ķēdi, kas saista molekulas atlikumu ar radikāļa grupu, kas sastāv vienīgi no oglekļa un ūdeņraža atomiem, kas nesatur nepiesātinātās saites, un kas satur no viena līdz divpadsmit oglekļa atomiem, kur alkilēnķēde ir pievienota molekulas atlikumam ar vienkāršu saiti un radikāļa grupai ar vienkāršu saiti, alkilēnķēdes saistīšanas vietas ar molekulas atlikumu un radikāļa grupu var būt caur vienu oglekļa atomu alkilēnķēdē vai caur jebkuriem diviem oglekļa atomiem ķēdē, kur alkilēnķēde var būt neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem no sekojošiem aizvietotājiem: halogēna atomu, ciāngrupu, nitrogrupu, arilgrupu, cikloalkilgrupu, heterociklilgrupu, heteroarilgrupu, oksogrupu, tioksogrupu, trimetilsilanilgrupu,  $-OR^{20}$ ,  $-OC(O)-R^{20}$ ,  $-N(R^{20})_2$ ,  $-C(O)R^{20}$ ,  $-C(O)OR^{20}$ ,  $-C(O)N(R^{20})_2$ ,  $-N(R^{20})C(O)OR^{20}$ ,  $-N(R^{20})C(O)R^{20}$ ,  $-N(R^{20})S(O)R^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)OR^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)_pR^{20}$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2) un  $-S(O)_iN(R^{20})_2$  (kur *t* ir 1 vai 2), kur katrs  $R^{20}$  ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa;

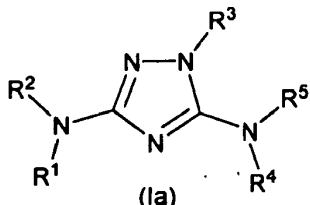
„alkenilēn” vai „alkenilēnķēde” apzīmē lineāru vai sazarotu divvērtīgu ogļūdeņraža ķēdi, kas saista molekulas atlikumu ar radikāļa grupu, kas sastāv vienīgi no oglekļa un ūdeņraža atomiem, kas satur vismaz vienu dubultsaiti, un kas satur no diviem līdz divpadsmit oglekļa atomiem, un kur alkilēnķēde ir pievienota molekulas atlikumam ar dubultsaiti vai ar vienkāršu saiti un pievienota radikāļa grupai ar dubultsaiti vai vienkāršu saiti, alkenilēnķēdes saistīšanas vietas ar molekulas atlikumu un radikāļa grupu var būt caur vienu oglekļa atomu vai caur jebkuriem diviem oglekļa atomiem ķēdē, kur alkenilēnķēde var būt neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem no sekojošiem aizvietotājiem: halogēna atomu, ciāngrupu, nitrogrupu, arilgrupu, cikloalkilgrupu, heterociklilgrupu, heteroarilgrupu, oksogrupu, tioksogrupu, trimetilsilanilgrupu,  $-OR^{20}$ ,  $-OC(O)-R^{20}$ ,  $-N(R^{20})_2$ ,  $-C(O)R^{20}$ ,  $-C(O)OR^{20}$ ,  $-C(O)N(R^{20})_2$ ,  $-N(R^{20})C(O)OR^{20}$ ,  $-N(R^{20})C(O)R^{20}$ ,  $-N(R^{20})S(O)R^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)OR^{20}$  (kur *t* ir 1 vai 2),  $-S(O)_pR^{20}$  (kur *p* ir 0, 1 vai 2) un  $-S(O)_iN(R^{20})_2$  (kur *t* ir 1 vai 2), kur katrs  $R^{20}$  ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa;

„alkinilēn” vai „alkinilēnķēde” apzīmē lineāru vai sazarotu divvērtīgu ogļūdeņraža ķēdi, kas saista molekulas atlikumu ar radikāļa grupu, kas sastāv vienīgi no oglekļa un ūdeņraža atomiem, kas satur vismaz vienu trīskāršu saiti un kas satur no diviem līdz divpadsmit oglekļa atomiem, kur alkinilēnķēde ir pievienota molekulas atlikumam ar vienkāršu saiti un radikāļa grupai ar dubultsaiti vai vienkāršu saiti, alkinilēnķēdes saistīšanas vietas ar molekulas atlikumu un radikāļa grupu var būt caur vienu oglekļa atomu vai caur jebkuriem diviem oglekļa atomiem ķēdē, kur alkinilēnķēde var būt neobligāti aizvietota



ar vienu vai vairākiem no sekojošiem aizvietotājiem: alkilgrupu, alkenilgrupu, halogēna atomu, halogēnalkenilgrupu, ciāngrupu, nitrogrupu, arilgrupu, cikloalkilgrupu, heterociklilgrupu, heteroarilgrupu, oksogrupu, tioksogrupu, trimetilsilanilgrupu, -OR<sup>20</sup>, -OC(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>, -C(O)R<sup>20</sup>, -C(O)OR<sup>20</sup>, -C(O)N(R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)C(O)OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)C(O)R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)S(O)R<sup>20</sup> (kur t ir 1 vai 2), -S(O)<sub>t</sub>OR<sup>20</sup> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>20</sup> ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir savienojums ar formulu (Ia):



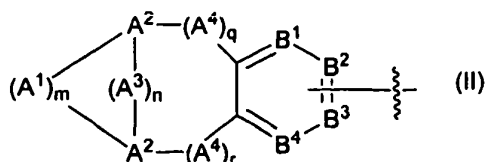
kur R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> ir, kā definēts iepriekš 1. pretenzijā; kā izolēts stereocizomērs vai tā maisījums vai kā tā farmaceutiski pieņemams sāls.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju,

kur:

R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> katrs ir ūdeņraža atoms;

R<sup>2</sup> ir caur tiltiņu savienota bicikliska arilgrupa vai caur tiltiņu savienota bicikliska heteroarilgrupa ar formulu (II):



kur:

m un n neatkarīgi ir no 1 līdz 2;

q un r neatkarīgi ir no 0 līdz 2;

A<sup>1</sup>, A<sup>3</sup> un katrs A<sup>4</sup> ir katrs neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub> un N(R<sup>9</sup>);

katrs A<sup>2</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>) un N; B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>13</sup>) un N, ar nosacījumu, ka viens no B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> ir oglekļa atoms, kas ir tieši saistīts ar slāpekļa atomu, kuram R<sup>2</sup> ir pievienots;

R<sup>3</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R<sup>15</sup>-OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-OC(O)-R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)S(O)R<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>t</sub>OR<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>t</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>14</sup> ir neatkarīgi ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa, un katrs R<sup>15</sup> ir neatkarīgi tieša saite vai lineāra vai sazarota alkilēnķēde vai alkenilēnķēde;

katrs R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R<sup>11</sup>-OR<sup>9</sup>, -R<sup>11</sup>-CN, -R<sup>11</sup>-NO<sub>2</sub>, -R<sup>11</sup>-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>11</sup>-C(O)OR<sup>9</sup> un -R<sup>11</sup>-C(O)N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>,

vai jebkurš R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> kopā ar kopēju slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido neobligāti aizvietotu N-heteroarilgrupu vai neobligāti aizvietotu N-heterociklilgrupu;

katrs R<sup>8</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, -R<sup>10</sup>-OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-OC(O)-R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)S(O)R<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>t</sub>OR<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2), un -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>t</sub>N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup> (kur t ir 1 vai 2), vai divi atlikumi R<sup>9</sup> pie blakusesošiem oglekļa atomiem var būt apvienoti, lai veidotu dubultsaiti;

katrs R<sup>9</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas un neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas;

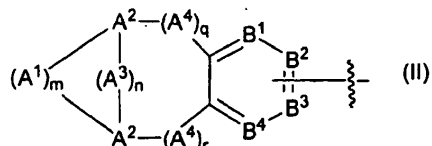
katrs R<sup>10</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkilēnķēdes;

katrs R<sup>11</sup> ir neobligāti aizvietota lineāra vai sazarota alkilēnķēde; katrs R<sup>13</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, -R<sup>10</sup>-OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-OC(O)-R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)S(O)R<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>t</sub>OR<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>t</sub>N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup> (kur t ir 1 vai 2).

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju,

kur:

R<sup>2</sup> ir caur tiltiņu savienota bicikliska arilgrupa ar formulu (II):



kur:

m un n neatkarīgi ir no 1 līdz 2;

q un r neatkarīgi ir no 0 līdz 2;

A<sup>1</sup>, A<sup>3</sup> un katrs A<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>;

katrs A<sup>2</sup> neatkarīgi ir C(R<sup>8</sup>);

B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir C(R<sup>13</sup>), ar nosacījumu, ka viens no B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> ir oglekļa atoms, kas ir tieši saistīts ar slāpekļa atomu, kuram R<sup>2</sup> ir pievienots;

R<sup>3</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no monocikliskas arilgrupas un monocikliskas heteroarilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R<sup>15</sup>-OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-OC(O)-R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)S(O)R<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>t</sub>OR<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>t</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>14</sup> neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa, kurā



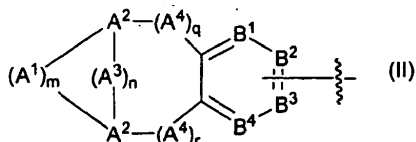
katrs R<sup>15</sup> neatkarīgi ir tieša saite vai lineāra vai sazarota alkilēnķēde vai alkenilēnķēde;

katrs R<sup>13</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, -R<sup>10</sup>-OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-OC(O)-R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>OR<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup> (kur t ir 1 vai 2).

5. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju,

kur:

R<sup>2</sup> ir caur tiltiņu savienota bicikliska arilgrupa vai caur tiltiņu savienota bicikliska heteroarilgrupa ar formulu (II):



kur:

m un n neatkarīgi ir no 1 līdz 2;

q un r neatkarīgi ir no 0 līdz 2;

A<sup>1</sup>, A<sup>3</sup> un A<sup>4</sup> ir katrs neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub> un N(R<sup>8</sup>);

katrs A<sup>2</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>) un N; B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>13</sup>) un N, ar nosacījumu, ka viens no B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> ir oglekļa atoms, kas ir tieši saistīts ar slāpekļa atomu, kuram R<sup>2</sup> ir pievienots;

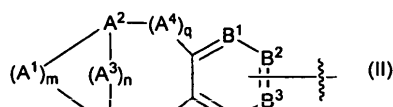
R<sup>3</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no bicikliskas arilgrupas un bicikliskas heteroarilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R<sup>15</sup>-OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-OC(O)-R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>OR<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>14</sup> neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa, un katrs R<sup>15</sup> neatkarīgi ir tieša saite vai lineāra vai sazarota alkilēnķēde vai alkenilēnķēde.

6. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, kur:

R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> katrs ir ūdeņraža atoms;

R<sup>2</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R<sup>15</sup>-OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-OC(O)-R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-C(O)N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -R<sup>15</sup>-N(R<sup>14</sup>)S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>OR<sup>14</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>14</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>15</sup>-S(O)<sub>p</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub> (kur t ir 1 vai 2), kur katrs R<sup>14</sup> neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, arilgrupa, aralkilgrupa, heterociklilgrupa, heterociklilalkilgrupa, heteroarilgrupa vai heteroarilalkilgrupa, un katrs R<sup>15</sup> neatkarīgi ir tieša saite vai lineāra vai sazarota alkilēnķēde vai alkenilēnķēde;

R<sup>3</sup> ir caur tiltiņu savienota bicikliska arilgrupa vai caur tiltiņu savienota bicikliska heteroarilgrupa ar formulu (II):



kur:

m un n neatkarīgi ir no 1 līdz 2;

q un r neatkarīgi ir no 0 līdz 2;

A<sup>1</sup>, A<sup>3</sup> un A<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub> un N(R<sup>8</sup>);

katrs A<sup>2</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>8</sup>) un N; B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C(R<sup>13</sup>) un N, ar nosacījumu, ka viens no B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup>, B<sup>3</sup> un B<sup>4</sup> ir oglekļa atoms, kas ir tieši saistīts ar slāpekļa atomu, kuram R<sup>2</sup> ir pievienots;

katrs R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R<sup>11</sup>-OR<sup>9</sup>, -R<sup>11</sup>-CN, -R<sup>11</sup>-NO<sub>2</sub>, -R<sup>11</sup>-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, -R<sup>11</sup>-C(O)OR<sup>9</sup> un -R<sup>11</sup>-C(O)N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, vai jebkurš R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup>, kopā ar kopējo slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido neobligāti aizvietotu N-heteroarilgrupu vai neobligāti aizvietotu N-heterociklilgrupu;

katrs R<sup>8</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, -R<sup>10</sup>-OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-OC(O)-R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)OR<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)OR<sup>14</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)C(O)R<sup>9</sup>, -R<sup>10</sup>-N(R<sup>6</sup>)S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>OR<sup>9</sup> (kur t ir 1 vai 2), -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R<sup>10</sup>-S(O)<sub>p</sub>N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup> (kur t ir 1 vai 2), vai divi atlikumi R<sup>8</sup> pie blakusesošiem oglekļa atomiem var būt apvienoti, lai veidotu dubultsaiti;

katrs R<sup>9</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, halogēnalkilgrupas, halogēnalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas un neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas; katrs R<sup>10</sup> neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas lineāras vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R<sup>11</sup> ir neobligāti aizvietota lineāra vai sazarota alkilēnķēde.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- 1-(5-trifluorometoksipiridin-2-il)-N<sup>3</sup>-(7-pirolidin-1-il-6,8-etano-6,7,8,9-tetrahydro-5H-benzo[7]anulen-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(2-hlor-7-metilieno[3,2-d]pirimidin-4-il)-N<sup>3</sup>-(7-pirolidin-1-il-6,8-etano-6,7,8,9-tetrahydro-5H-benzo[7]anulen-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(6,7-dimetoksihinazolin-4-il)-N<sup>3</sup>-(7-pirolidin-1-il-6,8-etano-6,7,8,9-tetrahydro-5H-benzo[7]anulen-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(7-metilieno[3,2-d]pirimidin-4-il)-N<sup>3</sup>-(7-pirolidin-1-il-6,8-etano-6,7,8,9-tetrahydro-5H-benzo[7]anulen-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(2-hlor-7-metilieno[3,2-d]pirimidin-4-il)-N<sup>3</sup>-(5,7-etano-5,7,8-trihidro-6-metil-1,6-naftiridin-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(7-metilieno[3,2-d]pirimidin-4-il)-N<sup>3</sup>-(5,7-etano-5,6,7,8-tetrahydro-6-metil-1,6-naftiridin-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(7-metilieno[3,2-d]pirimidin-4-il)-N<sup>3</sup>-(6,9-etano-6,7,8,9-tetrahydro-5H-pirido[3,2-c]azepin-3-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(1,4-etano-8-fenil-1,2,3,4-tetrahydro-1,5-naftiridin-6-il)-N<sup>3</sup>-(3-fluor-4-(4-(pirolidin-1-il)piperidin-1-il)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(1,4-etano-8-tiofen-2-il-1,2,3,4-tetrahydro-1,5-naftiridin-6-il)-N<sup>3</sup>-(3-fluor-4-(4-(pirolidin-1-il)piperidin-1-il)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;
- 1-(1,4-etano-8-piridin-4-il-1,2,3,4-tetrahydro-1,5-naftiridin-6-il)-N<sup>3</sup>-(3-fluor-4-(4-(pirolidin-1-il)piperidin-1-il)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna;



1-(5,8-metano-5,6,7,8-tetrahidrohiazolin-2-il)-N<sup>3</sup>-(1,2,3,4-tetrahydroizohinolin-6-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna.

8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, kur savienojums ir 1-(1,4-etano-8-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-1,5-naftiridin-6-il)-N<sup>3</sup>-(3-fluor-4-(4-(pirolidin-1-il)piperidin-1-il)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīns kā izolēts stereoizomērs vai tā maisījums vai kā tā farmaceutiski pieņemams sāls.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceutiski pieņemamu pildvielu un savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai terapeitiski efektīvu daudzumu; kā izolēts stereoizomērs vai tā maisījums vai kā tā farmaceutiski pieņemams sāls.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai; kā izolēts stereoizomērs vai tā maisījums vai kā tā farmaceutiski pieņemams sāls vai farmaceutiskas kompozīcijas saskaņā ar 9. pretenziju terapeitiski efektīvs daudzums izmantošanai slimības vai stāvokļa, kas saistīts ar Axl aktivitāti zīdītājā, ārstēšanā.

11. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai kā izolēta stereoizomēra vai tā maisījuma vai kā tā farmaceutiski pieņemama sāls vai farmaceutiskas kompozīcijas saskaņā ar 9. pretenziju terapeitiski efektīva daudzuma izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts slimības vai stāvokļa, kas saistīts ar Axl aktivitāti zīdītājā, ārstēšanai.

(51) **A61P 1/12**<sup>(200601)</sup> (11) **2120977**  
**A61K 35/44**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 35/50**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 35/64**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 38/21**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 37/06**<sup>(200601)</sup>

(21) 08725458.7 (22) 12.02.2008  
(43) 25.11.2009  
(45) 15.05.2013  
(31) 901067 P (32) 12.02.2007 (33) US  
(86) PCT/US2008/001831 12.02.2008  
(87) WO2008/100498 21.08.2008  
(73) Anthrogenesis Corporation, 7 Powder Horn Drive, Warren, NJ 07059, US

(72) EDINGER, James, W., US  
HARIRI, Robert, J., US  
WANG, Jia-lun, US  
YE, Qian, US  
FALECK, Herbert, US

(74) Weber, Martin, Jones Day, Prinzregentenstraße 11, 80538 München, DE  
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013, LV

(54) **IEKAISUMA SLIMĪBU ĀRSTĒŠANA, IZMANTOJOT PLACENTAS CILMES ŠŪNAS TREATMENT OF INFLAMMATORY DISEASES USING PLACENTAL STEM CELLS**

(57) 1. Placentas cilmes šūnas izmantošanai paņēmienā, lai ārstētu iekaisīgo zarnu slimību, kurā paņēmieni ietver minēto placentas cilmes šūnu ievadīšanu terapeitiski iedarbīgā daudzumā, kas ir pietiekams, lai izraisītu uztveramu uzlabošanu vienā vai vairākos minētās iekaisīgo zarnu slimības simptomos; un kurā minētās placentas cilmes šūnas ir CD10+, CD34-, CD105+ un CD200+.

2. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētā iekaisīgo zarnu slimība ir čūlainais kolīts vai Krona slimība.

3. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kurā minētā iekaisīgo zarnu slimība ir čūlainais kolīts.

4. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kurā minētā iekaisīgo zarnu slimība ir Krona slimība.

5. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kurā minētā Krona slimība ir gastrooduēnāla Krona slimība, jejunoileīts (*jejunoileitis*), ileīts, ileokolīts vai Krona kolīts.

6. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 5. pretenzijai, kurā minētais simptoms ir viens vai vairāki no simptomiem: iekaisuma un kuņģa-zarnu trakta daļas pietūkuma, vēdera sāpēm, biežas zarnu iztukšošanās, caurejas, taisnās zarnas asiņošanas, anēmijas, svāra zuduma, zarnu sienas sabiezējuma,

rētaudu veidošanās zarnās, jēlumu vai čūlu veidošanās zarnās, vienas vai vairāku fistulu veidošanās zarnu sienā, viena vai vairāku plīsumu veidošanās anālā atverē, uztura deficīta atbilstības, asiņainas caurejas, nelabuma, vēdera krampjiem, noguruma, apetītes zuduma, ķermeņa šķidrumu un uzturvielu zuduma, augstākiem par normālo bilirubīna līmeņiem, paaugstinātiem alanīna aminotransferāzes (ALT) līmeņiem, paaugstinātiem aspartāta aminotransferāzes (AST) līmeņiem, paaugstinātiem sārmainās fosfatāzes (AP) līmeņiem, iekšējās asiņošanas, krampjiem vai zarnu aizsprostojuma.

7. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kurā minētais paņēmieni ietver papildu otra terapeitiska līdzekļa ievadīšanu.

8. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 7. pretenziju, kurā minētais otrais terapeitiskais līdzeklis satur mesalāmīnu, 5-ASA (5-aminosalicilskābi) līdzekli, osalazīnu, sulfasalazīnu (kombināciju no 5-ASA un sulfapiridīna), pretiekaisuma antivieli, steroīdu vai imūnsupresoru.

9. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kurā minētā pretiekaisuma antiviela ir infliksimabs.

10. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kurā minētais steroīds ir kortizons, hidrokortizons, prednizons vai metilprednizons.

11. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kurā minētais paņēmieni ietver papildu otra terapeitiska līdzekļa ievadīšanu.

12. Placentas cilmes šūnas izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kurā minētais imūnsupresors ir ciklosporīns A, 6-merkaptopurīns vai azatioprīns.

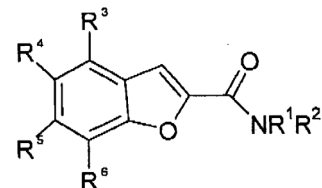
(51) **C07D 307/85**<sup>(200601)</sup> (11) **2121649**  
(21) 07856224.6 (22) 22.11.2007  
(43) 25.11.2009

(45) 27.02.2013  
(31) 102006060597 (32) 21.12.2006 (33) DE  
(86) PCT/EP2007/010123 22.11.2007  
(87) WO2008/080456 10.07.2008  
(73) Merck Patent GmbH, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, DE

(72) BATHE, Andreas, DE  
(74) Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **METODE BENZOFURĀN-2-KARBOKSAMĪDU IEGŪŠANAI METHOD FOR THE PRODUCTION OF BENZOFURAN-2-CARBOXAMIDES**

(57) 1. Metode benzofurān-2-karboksamīdu ar formulu (I)



kurā R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> nozīmē H vai neaizvietotu vai ar A aizvietotu cikloalkilgrupu ar 3 līdz 7 C atomiem, vai nesazarotu vai sazarotu alkilgrupu ar 1 līdz 10 C atomiem, pie kam viena vai vairākas alkilgrupas CH<sub>2</sub> grupas var būt aizstātas ar O vai S atomu vai ar CH=CH grupām vai kurā viens vai vairāki alkilgrupas udeņraža atomi var būt aizstāti ar Hal, OH, Ar, Het, cikloalkilgrupu ar 3 līdz 10 C atomiem, N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, CN, COOR<sup>7</sup>, CON(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>7</sup>COR<sup>7</sup>, NR<sup>7</sup>CON(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>7</sup>SO<sub>2</sub>A vai SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>.

NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> kopā nozīmē trīs- līdz 7-locekļu piesātinātu heterociklisku gredzenu, kurā papildus var būt 1 vai 2 N un/vai 1 vai 2 S, un/vai 1 vai 2 O atomi, un/vai viena S(O)<sub>m</sub> grupa, kas var būt aizvietots ar A, Hal, cikloalkilgrupu ar 3 līdz 10 C atomiem, OR<sup>7</sup>, N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, CN, COOR<sup>7</sup>, CON(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>7</sup>COR<sup>7</sup> un/vai karbonilskābekli,

A nozīmē nesazarotu vai sazarotu alkilgrupu ar 1 līdz 6 C atomiem, kurā vismaz viena CH<sub>2</sub> grupa var būt aizstāta ar O vai S atomu vai ar CH=CH grupu, vai vismaz viens H atoms var būt aizstāts ar F, Ar nozīmē neaizvietotu vai vienreiz vai vairākkārt ar Hal, A, OR<sup>7</sup>, N(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, COOR<sup>7</sup>, CON(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>7</sup>COR<sup>7</sup>, NR<sup>7</sup>CON(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>,



$\text{NR}^7\text{SO}_2\text{A}$ ,  $\text{COR}^7$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^7$  vai  $\text{S(O)}_m\text{A}$  aizvietotu fenilgrupu, naftilgrupu vai difenilgrupu,

Het nozīmē piesātinātu, nepiesātinātu vai aromātisku mono- vai biciklisku heterociklisku grupu ar 5 līdz 10 gredzena locekļiem, kurā var būt 1 līdz 4 N un/vai 1 līdz 4 S, un/vai 1 līdz 4 O atomi, un heterocikliskā grupa var būt vienreiz, divkārt vai trīskārt aizvietota ar Hal, A,  $-\text{[C(R}^7\text{)]}_2$ , -Ar,  $-\text{[C(R}^7\text{)]}_2$ -cikloalkilgrupu,  $\text{OR}^7$ ,  $\text{N(R}^7\text{)}_2$ ,  $\text{NO}_2$ , CN,  $\text{COOR}^7$ ,  $\text{CON(R}^7\text{)}_2$ ,  $\text{NR}^7\text{COA}$ ,  $\text{NR}^7\text{CON(R}^7\text{)}_2$ ,  $\text{NR}^7\text{SO}_2\text{A}$ ,  $\text{COR}^7$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^7$  vai  $\text{S(O)}_m\text{A}$ , un/vai karbonilskābekli,

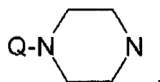
Hal nozīmē F, Cl, Br vai I,

n nozīmē 2, 3, 4 vai 5,

m nozīmē 1 vai 2,

o nozīmē 0, 1, 2, 3 vai 4,

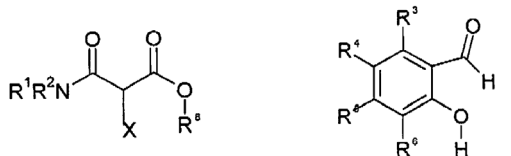
$\text{R}^3$ ,  $\text{R}^4$ ,  $\text{R}^5$ ,  $\text{R}^6$  ikreiz cits no cita neatkarīgi nozīmē H, A vai alkoksigrupu ar 1 līdz 20 C atomiem, Ar, ariloksigrupu vai  $\text{COOR}^7$ , Hal, OH, CN,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{N(R}^7\text{)}_2$ ,  $\text{NHCOR}^7$ ,  $\text{CH}_2\text{OH}$ ,  $\text{CH}_2\text{OR}^7$  vai  $\text{CO(R}^7\text{)}_2$ , un viena no  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^4$ ,  $\text{R}^5$ ,  $\text{R}^6$  grupām tā vietā var nozīmēt arī 4-benzilpiperazinilgrupu, 4-*terc*-butoksikarbonilpiperazin-1-ilgrupu, atšķelamu grupu vai



$\text{R}^7$  nozīmē H vai A,

Q nozīmē aminoaizsarggrupu,

iegūšanai, pakļaujot reakcijai piemērotas bāzes klātbūtnē savienojumus ar formulām (II) un (III)



kurās

X nozīmē Hal,

$\text{R}^8$  nozīmē A un

$\text{R}^1$ - $\text{R}^7$  ir ar iepriekš doto nozīmi.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $\text{R}^4$  nozīmē atšķelamu grupu, 4-*terc*-butoksikarbonilpiperazin-1-ilgrupu vai 4-benzilpiperazinilgrupu.

3. Metode saskaņā ar vienu vai vairākām no 1. līdz 2. pretenzijai, kur  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^5$  un  $\text{R}^6$  neatkarīgi cits no cita nozīmē H vai metilgrupu.

4. Metode saskaņā ar vienu vai vairākām no 1. līdz 3. pretenzijai, kur  $\text{R}^7$  nozīmē H.

5. Metode saskaņā ar vienu vai vairākām no 1. līdz 4. pretenzijai, kur  $\text{R}^8$  nozīmē alkilgrupu.

6. Metode 5-(4-*terc*-butoksikarbonil-1-piperazinil)benzofurān-2-karboksamīda iegūšanai saskaņā ar vienu vai vairākām no 1. līdz 5. pretenzijai.

7. Metode saskaņā ar kādu no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka savienojumu ar formulu (II) pakļaušana reakcijai ar savienojumiem ar formulu (III) notiek polārā aprotiskā šķīdinātājā.

8. Metode savienojumu ar formulu (I) iegūšanai saskaņā ar vienu vai vairākām no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka savienojumu ar formulu (II) pakļaušana reakcijai ar savienojumiem ar formulu (III), lai iegūtu savienojumus ar formulu (I), notiek pie pH vērtībām starp 7 un 14 un temperatūrās no 0 līdz 200°C.

9. Metode saskaņā ar kādu no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka par savienojumu ar formulu (III) tiek izmantots 5-(4-*terc*-butoksikarbonilpiperazin-1-il)-2-hidroksibenzaldehīds.

**A61K 33/24**<sup>(200601)</sup>

**A61K 39/395**<sup>(200601)</sup>

**C07D 403/06**<sup>(200601)</sup>

**A61P 35/00**<sup>(200601)</sup>

**A61K 45/06**<sup>(200601)</sup>

- (21) 07860480.8 (22) 28.12.2007  
 (43) 02.12.2009  
 (45) 15.05.2013  
 (31) 882809 P (32) 29.12.2006 (33) US  
 950771 P 19.07.2007 US  
 (86) PCT/JP2007/075277 28.12.2007  
 (87) WO2008/081927 10.07.2008  
 (73) Astellas Pharma Inc., 5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 103-8411, JP  
 (72) NAKAHARA, Takahito, JP  
 YAMANAKA, Kentaro, JP  
 KITA, Aya, JP  
 KOUTOKU, Hiroshi, JP  
 (74) Bates, Philip Ian, Reddie & Grose LLP, 16 Theobalds Road, London WC1X 8PL, GB  
 Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV  
 (54) **VĒŽA ĀRSTĒŠANAS METODE, IZMANTOJOT PRETVĒŽA LĪDZEKLI KOMBINĀCIJĀ**  
**METHOD FOR TREATING CANCER USING ANTICANCER AGENT IN COMBINATION**

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur 1-(2-metoksietil)-2-metil-4,9-dioksa-3-(pirazin-2-ilmetil)-4,9-dihidro-1H-nafto[2,3-d]imidazol-3-ija bromīdu kā aktīvu komponentu, izmantošanai vēža ārstēšanā kombinētā terapijā, kas iekļauj

i) rituksimaba izmantošanu vai

ii) kombinācijas terapiju, atlasītu no R-ICE, kas sastāv no rituksimaba, ifosfamīda, karboplatīna un etopozīda, un R-DHAP, kas sastāv no rituksimaba, citarabīna un cisplatīna kā pretvēža līdzekļiem.

2. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur kombinētā terapija iekļauj rituksimaba izmantošanu.

3. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur kombinētā terapija iekļauj kombinācijas terapijas, atlasītas no R-ICE un R-DHAP, izmantošanu.

4. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 3. pretenziju, kur kombinētā terapija iekļauj kombinācijas terapijas R-ICE izmantošanu.

5. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur kompozīcija ir izmantojama limfomas ārstēšanā.

6. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur kompozīcija ir zāļu forma 1-(2-metoksietil)-2-metil-4,9-dioksa-3-(pirazin-2-ilmetil)-4,9-dihidro-1H-nafto[2,3-d]imidazol-3-ija bromīda intravenozai ievadīšanai ar infūziju, ar devu 1-10 mg/m<sup>2</sup>/dienā pastāvīgi 4-14 dienu laikā.

7. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kur zāļu forma ir paredzēta 1-(2-metoksietil)-2-metil-4,9-dioksa-3-(pirazin-2-ilmetil)-4,9-dihidro-1H-nafto[2,3-d]imidazol-3-ija bromīda intravenozai ievadīšanai ar infūziju, ar devu 3-8 mg/m<sup>2</sup>/dienā pastāvīgi 7 dienu laikā, kam seko 14 dienu pārtraukums, atkārtotot minēto ievadīšanas ciklu atkarībā no apstākļiem.

8. 1-(2-metoksietil)-2-metil-4,9-dioksa-3-(pirazin-2-ilmetil)-4,9-dihidro-1H-nafto[2,3-d]imidazol-3-ija bromīda izmantošana vēža ārstēšanas medikamenta ražošanā, kur medikaments tiek izmantots kombinētā terapijā, kas iekļauj

i) rituksimaba izmantošanu vai

ii) kombinācijas terapiju, atlasītu no R-ICE, kas sastāv no rituksimaba, ifosfamīda, karboplatīna un etopozīda, un R-DHAP, kas sastāv no rituksimaba, citarabīna un cisplatīna kā pretvēža līdzekļiem.

9. Līdzeklis izmantošanai vēža ārstēšanā, kas satur kā aktīvu komponentu 1-(2-metoksietil)-2-metil-4,9-dioksa-3-(pirazin-2-ilmetil)-4,9-dihidro-1H-nafto[2,3-d]imidazol-3-ija bromīdu,

kur līdzeklis ir izmantojams kombinētā terapijā, kas iekļauj

i) rituksimaba izmantošanu vai

ii) kombinācijas terapiju, atlasītu no R-ICE, kas sastāv no rituksimaba, ifosfamīda, karboplatīna un etopozīda, un R-DHAP, kas sastāv no rituksimaba, citarabīna un cisplatīna kā pretvēža līdzekļiem.

10. Pastiprinātais pretvēža efekts no i) rituksimaba vai ii) kombinācijas terapijas, atlasītas no R-ICE, kas sastāv no rituksimaba, ifosfamīda, karboplatīna un etopozīda, un R-DHAP, kas sastāv no rituksimaba, citarabīna un cisplatīna kā pretvēža līdzekļiem, kur

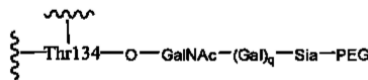
- (51) **A61K 31/497**<sup>(200601)</sup> (11) **2127652**  
**A61K 31/337**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/4164**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/4745**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/475**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/675**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/704**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/7048**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/7068**<sup>(200601)</sup>



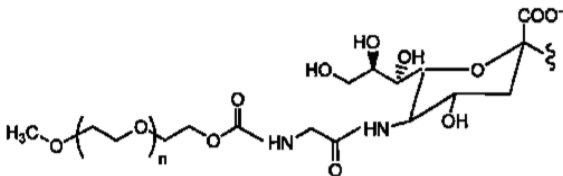
pastiprinājais satur 1-(2-metoksietil)-2-metil-4,9-dikso-3-(pirazin-2-ilmetil)-4,9-dihidro-1H-nafto[2,3-d]imidazol-3-ija bromīdu kā aktīvu komponentu.

- (51) **C07K 1/00**<sup>(200601)</sup> (11) **2144923**  
**A61K 47/48**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 7/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 35/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 08744881.7 (22) 01.04.2008  
(43) 20.01.2010  
(45) 13.02.2013  
(31) 909917 P (32) 03.04.2007 (33) US  
911788 P 13.04.2007 US  
986240 P 07.11.2007 US  
(86) PCT/US2008/059045 01.04.2008  
(87) WO2008/124406 16.10.2008  
(73) BioGeneriX AG, Janderstrasse 3, 68199 Mannheim, DE  
(72) ZOPF, David, A., US  
LUBENAU, Heinz, DE  
(74) Lasar, Andrea Gisela, et al, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstraße 3, 80335 München, DE  
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **ĀRSTĒŠANAS METODES AR GLIKOPEGILĒTU G-CSF METHODS OF TREATMENT USING GLYCOPEGYLATED G-CSF**

(57) 1. Peptīds, kas ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu



kur  
q ir 0 vai 1; un  
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:

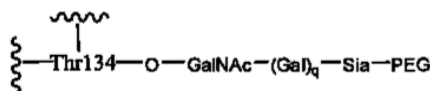


kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500 izmantošanai cilmes šūnu ražošanas palielināšanai donora organismā.

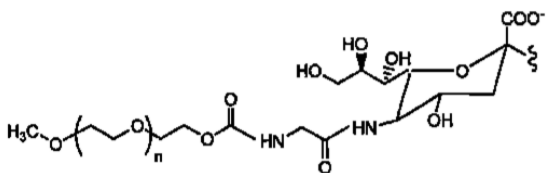
2. Peptīds izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētajam G-CSF peptīdam ir aminoskābju sekvence SEQ ID NO: 1.

3. Peptīds izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kur minētās aminoskābes atlikums ir treonīns SEQ ID NO: 1 134. pozīcijā.

4. Peptīds, kas ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu

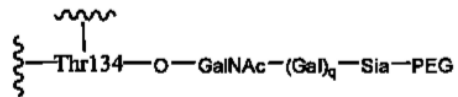


kur  
q ir 0 vai 1; un  
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:

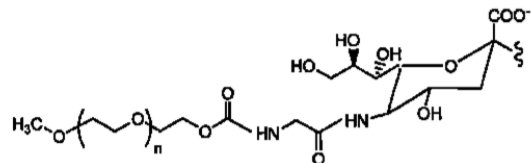


kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, pie kam minētajam G-CSF peptīdam ir aminoskābju sekvence SEQ ID NO: 1, izmantošanai granulocītu skaita pieaugumam objektā, pie kam minētais objekts ir piemērots kaulu smadzeņu transplants.

5. Peptīds, kurš ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu

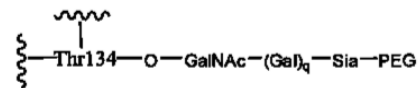


kur  
q ir 0 vai 1; un  
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:

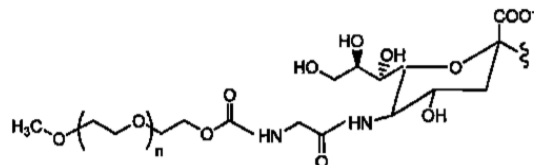


kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, izmantošanai cilmes šūnu ražošanas pieaugumam objektā.

6. Peptīds, kurš ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu

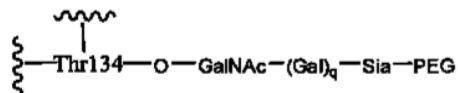


kur  
q ir 0 vai 1; un  
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:

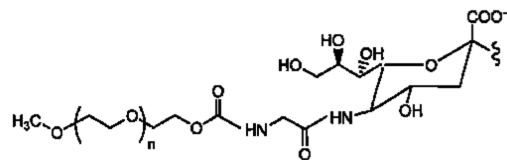


kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, izmantošanai mielosu-presiju, kas radušās vēža terapijas saņēmējam no minētās vēža terapijas, novēršanai, ārstēšanai un atvieglošanai.

7. Peptīda, kurš ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu

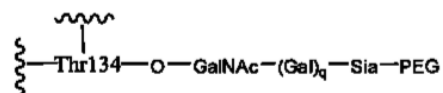


kur  
q ir 0 vai 1; un  
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:

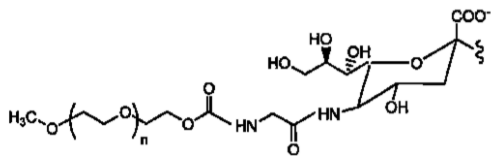


kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, farmaceutiski efektīvs daudzums izmantošanai neitropēnijas vai trombocitopēnijas ārstēšanai zīdītājiem.

8. Hemopoētisko cilmes šūnu paplašināšanas paņēmieni kultūrā, pie kam minētais paņēmieni ietver etapu, kad minētajās cilmes šūnās ievada efektīvu daudzumu peptīda, kurš ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu

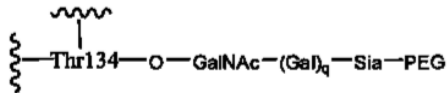


kur  
q ir 0 vai 1; un  
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:



kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500.

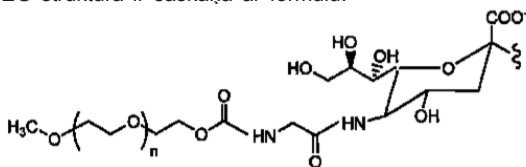
9. Efektīvs daudzums peptīda, kurš ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu



kur

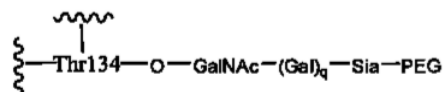
q ir 0 vai 1; un

Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:



kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, izmantošanai asinsrades paaugstināšanai vai asinsrades priekštečšūnu skaita palielināšanai objektā.

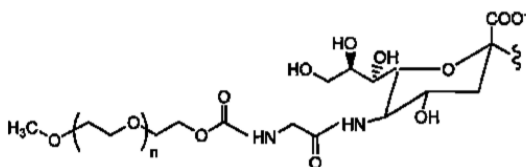
10. Peptīds, kas ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu



kur

q ir 0 vai 1; un

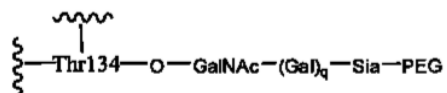
Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:



kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, izmantošanai stabilas kaulu smadzeņu transplantāta pieaudzēšanas nodrošināšanas paņēmienā, pie kam minētais paņēmieni ietver sekojošus etapus: (a) minētā peptīda došana minētā kaulu smadzeņu transplantāta donoram;

(b) minēto kaulu smadzeņu izdalīšana no minētā donora; un (c) minēto kaulu smadzeņu ievadīšana recipientam infūzijas ceļā.

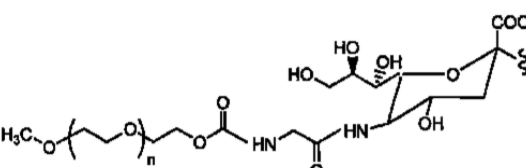
11. Pirmais sastāvs, kas satur savienojumu ar formulu (1) ir 1,1'-[1,4-fenilen-bis(metilen)-bis-1,4,8,11-tetraazaciklotetradekāns (AMD3100); un otrs sastāvs, kas satur peptīdu, kas ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, pie kam minētais G-CSF peptīds ietver struktūru saskaņā ar formulu



kur

q ir 0 vai 1; un

Sia-PEG struktūra ir saskaņā ar formulu:



kurā n ir vesels skaitlis no 400 līdz 500, izmantošanai asinsrades

priekštečšūnu skaita palielināšanai objektā; pie kam pirmais sastāvs un otrs sastāvs jāievada secīgi un jebkādā kārtībā, vai vienlaicīgi.

12. Peptīds izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur to izmanto daudzuma diapazonā no apmēram 1 mg līdz apmēram 20 mg.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur peptīdu, kas ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai vai ar 12. pretenziju, vai efektīvu daudzumu peptīda, kas ir kovalents konjugāts starp G-CSF peptīdu un polimēru modificējošu grupu, izmantošanai saskaņā ar 7. vai 9. pretenziju, pie kam peptīds ir definēts kā 1. pretenzijā.

- (51) **A24C 5/56**<sup>(200601)</sup> (11) **2162023**  
**A24D 1/02**<sup>(200601)</sup>  
**A24D 1/00**<sup>(200601)</sup>  
**A24D 3/06**<sup>(200601)</sup>
- (21) 08807184.0 (22) 06.06.2008  
(43) 17.03.2010  
(45) 31.07.2013  
(31) 929010 P (32) 08.06.2007 (33) US  
(86) PCT/IB2008/002544 06.06.2008  
(87) WO2008/152526 18.12.2008  
(73) Philip Morris Products S.A., Quai Jeanrenaud 3, 2000 Neuchâtel, CH  
(72) KARLES, Georgios, D., US  
NEPOMUCENO, Jose, US  
ZHUANG, Shuzhong, US  
ALLEN, Jeff, US  
JUPE, Richard, US  
(74) Taylor, Gillian Claire, Reddie & Grose LLP, 16 Theobalds Road, London WC1X 8PL, GB  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **SMĒKĒŠANAS IZSTRĀDĀJUMS AR REGULĒJAMU AROMĀTA IZDALĪŠANU SMOKING ARTICLE WITH CONTROLLED FLAVOR RELEASE**  
(57) 1. Smēķēšanas izstrādājums (10) ar regulējamu aromāta izdalīšanu, kas satur: tabakas stienīti (20), iemuša galu (14), regulējamu aromāta izdalīšanas produktu (16), kas ietver: pirmo izdalāmo aromatizētāju (24), kuru pirmajā reizē atbrīvo pirmais mehānisms; un otro izdalāmo aromatizētāju (26), kuru otrajā reizē atbrīvo otrais mehānisms, kur otrais atbrīvošanas laiks atšķiras no pirmā, kurā regulējamais aromāta izdalīšanas produkts (16) ir saskarē ar minētā smēķēšanas izstrādājuma (10) iemuša galu (14).  
2. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minēto pirmo izdalāmo aromatizētāju (24) un minēto otro izdalāmo aromatizētāju (26) atbrīvo pirmais un otrais mehānisms, kas izvēlēti no virknes, kas ietver mitruma pievienošanu, pH izmaiņu, temperatūras pieaugumu un to kombinācijas.  
3. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais pirmais izdalāmais aromatizētājs un minētais otrais izdalāmais aromatizētājs ir ievietoti vismaz vienā mikrokapsulā.  
4. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais regulējamais aromāta izdalīšanas produkts (16) ir plēve (30).  
5. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 4. pretenziju, kurā minētā plēve (30) ir šķīstoša, sairstoša vai gan viena, gan otra.  
6. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais regulējamais aromāta izdalīšanas produkts (16) ir lūpu balzama veida (15) kompozīcija.  
7. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais regulējamais aromāta izdalīšanas produkts ir uzklāts uz minētā smēķēšanas izstrādājuma (10) iemuša gala (14) ārējās virsmas.  
8. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais pirmais izdalāmais aromatizētājs (24) un otrais izdalāmais aromatizētājs (26) ir izvēlēti

no virknes: mentols, piparmētra, šokolāde, lakrica, augļu aromāti, mandarīna, citrusu, ķiršu, gammaoktalaktona, vaniļas, etilvaniļina, elpas atsvaidzinātāja aromāti, garšvielu aromāti, kanēlis, metilsalicilāts, linalols, bergamotes eļļa, ņērāniju eļļa, citronu eļļa, ingvera eļļa, tabakas aromāti, aktīvas vielas, kas aromātu padara maigāku vai atsvaidzinošu, rūgtas vielas un to kombinācijas.

9. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais pirmais izdalāmais aromatizētājs (24) un minētais otrais izdalāmais aromatizētājs (26) satur vienādu aromatizētāju.

10. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais pirmais izdalāmais aromatizētājs (24) un minētais otrais izdalāmais aromatizētājs (26) satur atšķirīgus aromatizētājus.

11. Smēķēšanas izstrādājums ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais pirmais izdalāmais aromatizētājs (24) un minētais otrais izdalāmais aromatizētājs (26) ietver ķīmiskus savienojumus, kas aktivizē sajūtu receptoru mehānismus.

12. Paņēmiens smēķēšanas izstrādājuma (10) ar regulējamu aromāta izdalīšanu saskaņā ar 1. pretenziju ražošanai, kur minētais paņēmiens ietver smēķēšanas izstrādājuma (10) iemutņa gala (14) savienošanu ar regulējamu aromāta izdalīšanas produktu (16), kurā minētais regulējama aromāta izdalīšanas produkts (16) sastāv no pirmā izdalāmā aromatizētāja (24) un otrā izdalāmā aromatizētāja (26).

13. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kurā minētais pirmais izdalāmais aromatizētājs (24) ietver atšķirīgu aromatizētāju vai aromatizētājus nekā minētais otrais izdalāmais aromatizētājs (26).

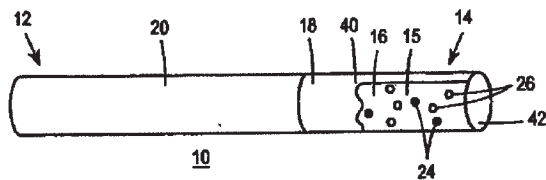


FIG 1

vadīt, izmantojot vadības elementus (31), kas nosaka mainīgos kontaktspiediena parametrus (K) nesējierīču (A, A') zonā.

3. Lentēs transportieris saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka attiecīgie vadības elementi (31) nesējierīču (A, A') zonā ir savienoti ar automātisku regulatoru.

4. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka kontaktspiediena parametrus (K), kurus var noteikt ar vadības elementiem (31) vai kuri tiek mērīti automātiski ar atgrīzeniskās saites palīdzību, var pārnest uz izpildmehānismu (33), kuru var savienot ar attiecīgajiem kontaktspiediena elementiem (9, 10) vai attiecīgo nesējierīči (A, A').

5. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka nesējierīcēm (A, A') visos gadījumos ir šķērssijs (50), kas stiepjas būtībā horizontāli starp rāmja vertikālajiem statņiem (29, 30, 29', 30'), kas kopā ar kontaktspiediena elementu (9, 10) visos gadījumos veido bloku grozāma balsta veidā, un to savukārt var pārvietot, izmantojot vadības elementu (31).

6. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka nesējierīces (A, A'), kas attiecībā pret transportiera plakni (E) ir uzstādītas būtībā spoguļattēla veidā, ar grozāmo balstu kā bloku, kas nes kontaktspiediena elementu (9, 10), ir uzstādītas abās transportiera renes (F) malās.

7. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka visas nesējierīces (A, A'), kas ir uzstādītas transportiera renes (F) zonā, visos gadījumos ir apgādātas ar vismaz vienu vadības elementu (31), kas iedarbojas uz minētajām nesējierīcēm grozāmā balsta vai kontaktspiediena elementa (9, 10) zonā.

8. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka visi nesējierīču (A, A') vadības elementi (31) var tikt savienoti ar centrālo vadības un/vai regulatora bloku (32).

9. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka kontaktspiediena parametrus (K) var koriģēt/regulēt vienlaicīgi visos kontaktspiediena elementos (9, 10).

10. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka visas nesējierīces (A, A') un kontaktspiediena elementus (9, 10) vismaz transportiera renē (F) var regulēt ar atsevišķu vadības elementu (31), kas darbojas kopā ar attiecīgajiem izpildmehānismiem (33).

11. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka vadības elements (31) ir izgatavots caurules ķermeņa (36) veidā, kurai vismaz vietām ir elastīgas caurules sienīgas (34) un iekšpuse (35) var tikt piepildīta ar šķidrumu.

12. Lentēs transportieris saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka caurules ķermenis (36), kas var tikt piepildīts, īpaši ar saspīestu gaisu, un kurai caurules sienīgu (34) zonā piemīt elastīgas atsperes daba (bulta W), kas atkarīga no uzpildes tilpuma vai spiediena, var tikt novietota tieši pret izpildmehānismiem (33) nesējierīču (A, A') zonā.

13. Lentēs transportieris saskaņā ar 11. vai 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka kontaktspiediena elementi (9, 10) var tikt regulēti ar atsperes pārvietošanu (38), kas var tikt noteikts, lai caurules sienīgu (34) zonā veidotos saskare ar izpildmehānismu (33).

14. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka, lai izpildmehānisms (33) savienotos ar kontaktspiediena elementu (9, 10), viens vai vairāki caurules ķermeņi (36) veido skaitlītāja atbalsta virsmu, kas pastāvīgi pielāgojas to mainīgajam ārējam apveidam un/vai kontaktspiediena parametriem (K) transportiera renes (F) zonā.

15. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 14. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka visas nesējierīces (A, A') vai to izpildmehānismi (33), kas ir izvietoti transportiera renes (F) zonā, var tikt regulēti ar caurules ķermeni (36), kas ir ietverts rāmī kā viengabala elements.

16. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 15. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka nesējierīces (A, A') katras šķērssijs (50) abos galos visos gadījumos ir nodrošinātas ar atsevišķi vai vienlaikus regulējamām caurules ķermeņa vai ķermeņu (36) apakšsekcijām.

17. Lentēs transportieris saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 16. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka nesējierīces (A, A') abās transportiera renes (F) malās darbojas kopā ar caurules ķermeni

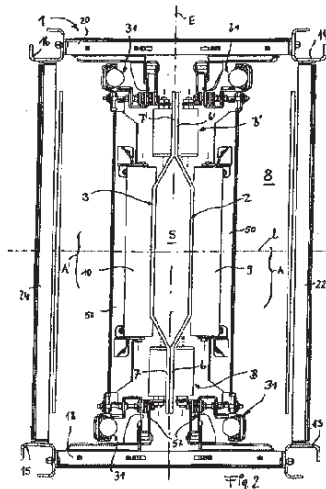
- (51) **B65G 15/14**<sup>(200601)</sup> (11) **2210829**
- B65G 15/18**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10000630.3 (22) 22.01.2010
- (43) 28.07.2010
- (45) 10.07.2013
- (31) 102009006136 (32) 26.01.2009 (33) DE
- (73) VHV Anlagenbau GmbH, Dornierstrasse 9, 48477 Hörstel, DE
- (72) Verlage, Bernhard, DE
- (74) Pott, Ulrich, 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) **SLĪPS LENTES TRANSPORTIERIS**  
**INCLINED BELT CONVEYER**
- (57) 1. Lentēs transportieris, īpaši slīpa lentēs transportiera veidā, kam ir divas transportiera lentes (2, 3), kuras transportiera plaknē (E) vismaz atsevišķos posmos virzās paralēli viena otrai kā transportiera renes (F) malās un šajā transportiera posmā veido uztverošo telpu (5) berama materiāla (4) vertikālai pārvietošanai, kur attiecīgie kontaktspiediena un/vai slēdzējelementi (9, 10; 11, 12) veļtnīšu pāru vai tamlīdzīgu skaitlītājelementu veidā var tikt spiesti pie minētās transportiera lentes ārējām aizmugures malām virzienā uz transportiera centrālo plakni (E), izmantojot nesējierīči (A, A'), kas balstās uz attiecīgām nesošajām daļām (29, 30, 29', 30'), kas raksturīgs ar to, ka vismaz kontaktspiediena elementi (9, 10, 11, 12, 11', 12'), kuri reaģē uz uztverošās telpas (5) apjoma izmaiņām transportiera renes (F) vienā pusē, visos gadījumos ir atsevišķi regulējami attiecībā pret to novietojumu pret transportiera plakni (E), kas iespaido attiecīgos kontaktspiediena parametrus (bulta K).
- 2. Lentēs transportieris saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka kontaktspiediena elementus (9, 10), kas iedarbojas uz transportiera reni (F) kā atsevišķas daļas, visos gadījumos var

vai ķermeņiem (36), kuriem ir kopīgs regulators (32) kā vadības ierīce (31).

18. Lentas transportieris saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 17. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka kontaktpiediena elementi (9, 10) un izpildmehānisms (33) ir cieši savienoti ar grozāmo balstu ar šķērssiiju (50) nesējierīču (A, A') zonā tādā veidā, ka kontaktpiediena elements (9, 10) var tikt regulēts uz izliekuma (39).

19. Lentas transportieris saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka šķērssiijas (50) zona visos gadījumos ir nodrošināta ar papildu atspere elementiem, lai balstītu kontaktpiediena elementus (9, 10) un tie kopā ar elastīgo caurules ķermeni (36) darbotos kā vadības elements.

20. Lentas transportieris, kam ir vadības elements saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 19. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka slēdzējelementi (11, 12, 11', 12'), kas visos gadījumos saslēdzas ar transportiera renes (F) malas zonu, var tikt regulēti ar vismaz vienu vadības elementu, kas izveidots caurules ķermeņa (36) veidā.



- (51) **A61K 39/395**<sup>(200601)</sup> (11) **2229956**  
**C12P 21/04**<sup>(200601)</sup>  
**C12P 21/06**<sup>(200601)</sup>  
**C12N 5/00**<sup>(200601)</sup>  
**C07K 14/715**<sup>(200601)</sup>  
**C07H 21/04**<sup>(200601)</sup>  
**C12N 15/62**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10165159.4 (22) 13.09.2005  
(43) 22.09.2010  
(45) 24.04.2013  
(31) 608887 P (32) 13.09.2004 (33) US  
658209 P 04.03.2005 US
- (62) EP05810409.2 / EP1804835  
(73) Genzyme Corporation, 500 Kendall Street, Cambridge, MA 02142, US  
(72) SCARIA, Abraham, US  
PECHAN, Peter, US  
WADSWORTH, Samuel, US  
(74) Adams, Harvey Vaughan John, et al, Mathys & Squire LLP, 120 Holborn, London EC1N 2SQ, GB  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **MULTIMĒRU KONSTRUKTI**  
**MULTIMERIC CONSTRUCTS**

(57) 1. Saplūšanas proteīns ar formulu X-Y-Z, kur:  
X ietver VEGF receptora daļu;  
Y ir linkera fragments; un  
Z ir multimerizācijas domēns,  
kur linkera fragments Y ir polipeptīds ar 5 līdz 50 aminoskābju atlikumiem, linkera Y lokanība ir lielāka par vidējo, kā noteikts ar lokanības prognozēšanas paņēmieni pēc Karpus un Schultz, 1985, *Naturwiss*, 72: 212-213, un kur minētais saplūšanas proteīns, ja multimerizēts, piesaista VEGF.

2. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 1. pretenziju, kur linkera fragments Y ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- Gly<sub>9</sub> (SEQ ID NO: 27),  
Glu<sub>9</sub> (SEQ ID NO: 28),  
Ser<sub>9</sub> (SEQ ID NO: 29),  
Gly<sub>5</sub>CysPro<sub>2</sub>Cys (SEQ ID NO: 30),  
(Gly<sub>5</sub>Ser)<sub>3</sub> (SEQ ID NO: 31),  
SerCysValProLeuMetArgCysGlyGlyCysCysAsn (SEQ ID NO: 32),  
ProSerCysValProLeuMetArgCysGlyGlyCysCysAsn (SEQ ID NO: 13),  
GlyAspLeuTyrArgAsnGlnLys (SEQ ID NO: 26), un  
Gly<sub>5</sub>ProSerCysValProLeuMetArgCysGlyGlyCysCysAsn (SEQ ID NO: 34).

3. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur multimerizācijas domēns Z veicina vismaz 50 % monomēru saplūšanas proteīnu pārneši uz nedēnatūrējoša poliakrilamīda gēla ar ātrumu, kas piemērots saplūšanas proteīna multimēram.

4. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur multimerizācijas domēns Z ir IgG smagās ķēdes fragments.

5. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 4. pretenziju, kur multimerizācijas domēnam Z ir sekvenca no IgG1 vai IgG2 smagās ķēdes Fc daļas.

6. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur multimerizācijas domēns Z ir IgG smagās ķēdes CH3 posms vai ir antielas molekulas Fc daļa.

7. Saplūšanas proteīns saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur X ietver VEGF-R1 Ig-līdzīgu domēnu 2.

8. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 7. pretenziju, kur X ietver VEGF-R1 Ig-līdzīgu domēnu 2 un neietver VEGF-R1 Ig-līdzīgu domēnu 1 un 3.

9. Saplūšanas proteīns saskaņā ar 8. pretenziju, kur X ir VEGF-R1 Ig-līdzīgs domēns 2.

10. Kompozīcija, kas satur saplūšanas proteīnu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai un vienu vai vairākus farmaceitiski pieņemamus nesējus.

11. Polipeptīda X multimerizācijas paņēmieni, kurā ietilpst polipeptīda X piesaistīšana polipeptīdam Z ar polipeptīdu Y tā, lai veidotu polipeptīdu X-Y-Z, kur:  
X ietver VEGF receptora daļu;  
Y ir linkera fragments; un  
Z ir multimerizācijas domēns,

kur linkera fragments Y ir polipeptīds ar 5 līdz 50 aminoskābju atlikumiem, linkera Y lokanība ir lielāka par vidējo, kā noteikts ar lokanības prognozēšanas paņēmieni pēc Karpus, Schultz, 1985, *Naturwiss*, 72: 212-213, un kur minētais saplūšanas proteīns, ja multimerizēts, piesaista VEGF.

12. Paņēmieni saskaņā ar 11. pretenziju, kur piesaistīšanas stadijā ietilpst nukleīnskābes molekulas, kas kodē X, Y un Z polipeptīdus kā vienu atvērtu nolasīšanas rāmi, konstruēšana, kur minētais polipeptīds X-Y-Z ir ekspressēts no minētās nukleīnskābes molekulas saimniekšūnā.

13. Nukleīnskābes molekula, kas kodē saplūšanas proteīnu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai.

14. Nukleīnskābes molekula saskaņā ar 13. pretenziju, kas kodē saplūšanas proteīnu saskaņā ar 1. pretenziju, kur saplūšanas proteīns ietver sekveni, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no SEQ ID NO: 2, 8, 21, 23 un 25.

15. Vektors, kas ietver nukleīnskābes molekulu saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju.

16. Vektors saskaņā ar 15. pretenziju, kur vektors ir adenoasociētais vīrusa vektors.

17. Zīdītāju šūna, kas ietver nukleīnskābes molekulu saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju vai vektoru saskaņā ar 15. vai 16. pretenziju.

18. Paņēmieni *in vitro*, kurā ietilpst nukleīnskābes saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju vai vektora saskaņā ar 15. vai 16. pretenziju piegāde zīdītāju šūnai tā, lai veidotu šūnu, kas ekspresē minēto saplūšanas proteīnu.

19. Saplūšanas proteīns saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, nukleīnskābes molekula saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, vektors saskaņā ar 15. vai 16. pretenziju vai zīdītāju šūna saskaņā ar 17. pretenziju, kuru izmanto zīdītāju ārstēšanā.

20. Saplūšanas proteīns, nukleīnskābes molekula, vektors vai zīdītāju šūna, kuru izmanto saskaņā ar 19. pretenziju, kur zīdītājam ir mitra ar vecumu saistīta makulas deģenerācija, proliferatīva diabētiska retinopātija, vēzis, reimatoīdais artrīts, astma vai osteoartrīts.



- (51) **B66F 9/00**<sup>(200601)</sup> (11) **2231500**  
**B60P 1/02**<sup>(200601)</sup>  
**B60P 3/022**<sup>(200601)</sup>  
**B62B 3/065**<sup>(200601)</sup>  
**B66F 9/06**<sup>(200601)</sup>  
**B66D 1/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09725676.2 (22) 22.01.2009  
(43) 29.09.2010  
(45) 26.06.2013  
(31) 2008901428 (32) 25.03.2008 (33) AU  
(86) PCT/AU2009/000068 22.01.2009  
(87) WO2009/117760 01.10.2009  
(73) Carr, Andrew Laurence, 269 Bay Street, Pagewood, NSW 2035, AU  
Carr, Symond Anthony, Post Office Box 1099, Mudgee, NSW 2850, AU  
(72) CARR, Andrew Laurence, AU  
CARR, Symond Anthony, AU  
(74) Manitz, Finsterwald & Partner GbR, Martin-Greif-Strasse 1, 80336 München, DE  
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV

(54) **MOBILA PACELŠANAS IEKĀRTA**  
**MOBILE LIFTING ASSEMBLY**

- (57) 1. Mobila pacelšanas iekārta, kas satur:  
- korpasa rāmi (2) ar vienu vai vairākiem riteņiem (4) transportēšanas vajadzībām,  
- strukturālu elementu (24),  
- vismaz divas individuāli vadāmas pacelšanas ierīces (6), kas ir savienotas ar korpasa rāmi (2), lai izmainītu strukturālā elementa (24) pozīciju,  
kas raksturīga ar kravas platformu (28), kas balstās uz balstvirsmas (30) zem korpasa rāmja (2) un ir uzstādīta tā, ka kontaktē ar korpasa rāmi, lai sadalītu spēkus, ko pārnes strukturālais elements (24) uz korpasa rāmi (2) cauri balstvirsmām (30).  
2. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 1. pretenzijā, pie kam katra no pacelšanas ierīcēm (6) ietver hidraulisku cilindru (26).  
3. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 1. vai 2. pretenzijā, pie kam daudzās pacelšanas ierīces (6) ir uzmontētas kā divi pacelšanas ierīču (6) pāri (8, 10), kas longitudināli ir distancēti viens no otra pa korpasa rāmja (2), kurš parasti ir taisnstūra formas, garumu.  
4. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 3. pretenzijā, pie kam tā papildus satur divus balsteņus (12), kas ir savienoti ar atbilstošu no diviem pacelšanas ierīču (6) pāriem (8, 10).  
5. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 4. pretenzijā, pie kam minētie divi balsteņi (12) katrs ir darbaspējīgi savienoti ar pacelšanas ierīču (6) atbilstošā pāra (8, 10) hidrauliskajiem cilindriem (26).  
6. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, pie kam vismaz viena no daudzajām pacelšanas ierīcēm (6) ietver kravas monitoringa ierīci.  
7. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, pie kam korpasa rāmis (2) ietver pirmo riteņu (4) pāri un otro riteņu (4) pāri, un korpasa rāmis (2) ir treilera formā.  
8. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 7. pretenzijā, pie kam vismaz viens riteņu (4) pāris ir savienots ar pagriežamu platformu (18).  
9. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, pie kam tā papildus satur tukšgaitas rullīti (20), lai veicinātu strukturālā elementa (24) slīdēšanu pāri mobilajai pacelšanas iekārtai.  
10. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, pie kam kravas platforma (28) ietver vienu vai vairākus hidrauliskos cilindrus, lai regulētu kravas platformas (28) augstumu kontaktēšanai ar korpasa rāmi.  
11. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 10. pretenzijā, pie kam viens vai vairāki hidrauliskie cilindri ir uzmontēti, lai regulētu kravas platformas (28) augšējā rāmja (32) sagāzuma leņķi tā, ka slodze, ko uzņem mobilās pacelšanas iekārtas balstvirsmas (30), tiek regulējami izkliedēta.  
12. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, pie kam korpasa rāmis (2) ietver balstelementus.

13. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 12. pretenzijā, pie kam korpasa rāmis (2) ir izveidots treilera formā.  
14. Mobila pacelšanas iekārta, kā tā ir definēta 10. pretenzijā, pie kam kravas platforma (28) ietver slodzes monitoringa ierīci.

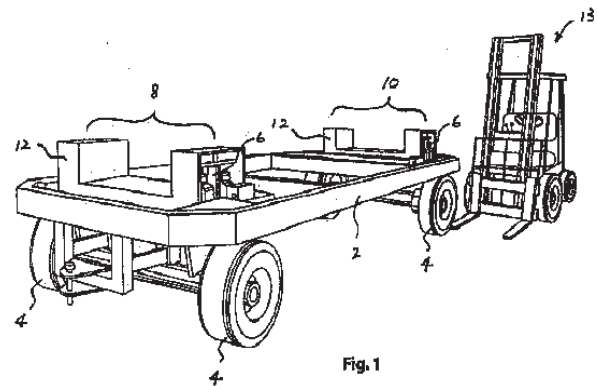
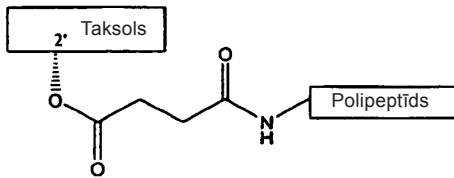


Fig. 1

- (51) **A61K 47/48**<sup>(200601)</sup> (11) **2233156**  
**A61K 38/55**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/475**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/196**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/704**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 38/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 35/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10006638.0 (22) 14.07.2006  
(43) 29.09.2010  
(45) 01.05.2013  
(31) 699375 P (32) 15.07.2005 (33) US  
758532 P 13.01.2006 US  
(73) Angiochem Inc., 201 President Kennedy Avenue Suite PK-R220, Montreal, QC H2X 3Y7, CA  
(72) BELIVEAU, Richard, CA  
DEMEULE, Michel, CA  
CHE, Christian, CA  
REGINA, Anthony, CA  
(74) Lahrtz, Fritz, Isenbruck Bösl Hörschler LLP, Patentanwälte, Prinzregentenstrasse 68, 81675 München, DE  
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **APROTINĪNA POLIPEPTĪDU IZMANTOŠANA PAR NESĒJIEM FARMACEITISKOS KONJUGĀTOS**  
**USE OF APROTININ POLYPEPTIDES AS CARRIERS IN PHARMACEUTICAL CONJUGATES**
- (57) 1. Konjugāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas satur:  
(a) polipeptīdu, kas satur Angiopep-2 (SEQ ID NO: 97); un  
(b) savienojumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no zāļu līdzekļa, proteīna, marķiera un peptīda, kur minētais savienojums ir sajūgts ar minēto polipeptīdu, ar nosacījumu, ka minētais konjugāts ir cits nekā šāds konjugāts:  
(a) polipeptīds, kas satur SEQ ID NO: 97 vai SEQ ID NO: 74; un  
(b) <sup>125</sup>Jods.  
2. Konjugāts saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā polipeptīda garums ir no 19 līdz 50 aminoskābēm.  
3. Konjugāts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur minētais polipeptīds sastāv no Angiopep-2 (SEQ ID NO: 97).  
4. Konjugāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas satur:  
(a) polipeptīdu, kas satur Angiopep-2 (SEQ ID NO: 97); un  
(b) pretvēža zāļu līdzekli, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no taksola, vinblastīna, vinkristīna, etopozīda, doksorubicīna, ciklofosfamīda, taksotera, melfalāna un hlorambucila vai antivielas, antivielas fragmenta vai zāļu līdzekļa uz peptīdu vai proteīnu bāzes, kur minētais pretvēža zāļu līdzeklis, minētā anti-viela, minētais antivielas fragments vai minētais zāļu līdzeklis uz peptīdu vai proteīnu bāzes ir sajūgts ar minēto polipeptīdu.  
5. Konjugāts saskaņā ar 4. pretenziju, kur 1, 2 vai 3 taksola molekulas ir sajūgtas ar minēto polipeptīdu.

6. Konjugāts saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētās taksola molekulas ir sajūgtas caur N-gala amīna grupu un caur lizīnu amīna grupām Angiopep-2 sekvenču 10. un 15. pozīcijā.

7. Konjugāts saskaņā ar 4. pretenziju, kur minētās taksola molekulas ir sajūgtas ar minēto polipeptīdu saskaņā ar zemāk attēloto shēmu:



8. Konjugāts saskaņā ar 7. pretenziju, kur:  
(a) minētais polipeptīds sastāv no Angiopep-2 (SEQ ID NO: 97);  
(b) trīs (3) taksola molekulas ir sajūgtas ar minēto polipeptīdu; un  
(c) katra no minētajām taksola molekulām ir sajūgta caur N-gala amīna grupu un caur lizīnu amīna grupām Angiopep-2 sekvenču 10. un 15. pozīcijā.

9. Kompozīcija, kas satur konjugātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai.

10. Kompozīcija, kurā ietilpst:

(a) konjugāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, minētais konjugāts satur:

(A) polipeptīdu, kas satur Angiopep-2 (SEQ ID NO: 97); un  
(B) savienojumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no zāļu līdzekļa, proteīna, marķiera un peptīda, kur minētais savienojums ir sajūgts ar minēto polipeptīdu, vai

(ii) konjugāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai; un  
(b) taukskābes polioksietilēna esteris.

11. Kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur polioksietilēna esteris ir Tween 20 vai Tween 80.

12. Kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur polioksietilēna esteris ir Solutol®HS-15.

13. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru 9., 10. vai 12. pretenziju, kas papildus satur mannitolu vai buferi.

14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur konjugātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai kompozīciju saskaņā ar jebkuru 9., 10. vai 12. pretenziju un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

15. Konjugāts satur:

(a) polipeptīdu, kas satur Angiopep-2 (SEQ ID NO: 97); un  
(b) savienojumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no zāļu līdzekļa, proteīna, marķiera un peptīda, kur minētais savienojums ir sajūgts ar polipeptīdu,

vai konjugātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai;

vai kompozīciju saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 13. pretenzijai izmantošanai vēža vai metastāžu vēža ārstēšanas metodē.

16. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 15. pretenziju, kur minētais vēzis ir rezistents pret daudzām zālēm.

17. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 15. vai 16. pretenziju, kur minētais vēzis ir smadzeņu vēzis, labāk glioblastoma vai glioma.

18. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 15. vai 16. pretenziju, kur minētais vēzis ir smadzeņu ārpuse.

19. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 18. pretenziju, kur minētais vēzis ir plaušu vēzis, krūts vēzis, nieru vēzis, acu vēzis, aknu vēzis, kolorektāls audzējs vai urīnsistēmas orgāna audzējs.

20. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 19. pretenzijai, kur minētais vēzis ir metastāžu vēzis no krūts vēža, plaušu vēža, melanomas vai smadzeņu vēža.

21. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 20. pretenzijai, kur minētais polipeptīds veicina proteīna vai pretvēža līdzekļa akumulāciju minētajā vēža šūnā.

22. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 21. pretenzijai, kur minētais vēzis satur šūnu, kas ekspresē zema blīvuma lipoproteīnu saistītu receptoru (LRP), P-glikoproteīnu (P-gp) vai abus.

23. Konjugāts vai kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 22. pretenzijai, kur minētā vēža ārstēšanas metode ietver

intraarteriālu, intranazālu, intraperitoneālu, intravenozu, intramuskulāru, subkutānu, transdermālu vai *per os* (perorālu) ievadīšanu.

(51) **C07D 213/12**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 213/14**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 401/14**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/33**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 25/06**<sup>(200601)</sup>

(11) **2234976**

(21) 08863325.0

(22) 08.12.2008

(43) 06.10.2010

(45) 10.04.2013

(31) 7960

(32) 17.12.2007 (33) US

(86) PCT/EP2008/066989

08.12.2008

(87) WO2009/077367

25.06.2009

(73) F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH

(72) CHEN, Li, CN

DILLON, Michael Patrick, US

FENG, Lichun, CN

HAWLEY, Ronald Charles, US

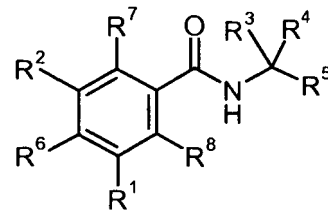
YANG, Minmin, CN

(74) Sauer, Frank, F. Hoffmann-La Roche AG, Patent Department, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH

Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **JAUNI PIRAZOLA AIZVIETOTI ARILAMĪDI  
NOVEL PYRAZOLE-SUBSTITUTED ARYLAMIDES**

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



(I)

vai farmaceitiski pieņemami tā sāļi,

kurā:

R<sup>1</sup> ir neobligāti aizvietota pirazolilgrupa;

R<sup>2</sup> ir neobligāti aizvietota fenilgrupa, neobligāti aizvietota piridinilgrupa, neobligāti aizvietota pirimidinilgrupa, neobligāti aizvietota piridazinilgrupa vai neobligāti aizvietota tiofenilgrupa;

R<sup>3</sup> ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai ciāngrupa;

R<sup>4</sup> ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa;

vai R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> kopā ar atomu, pie kura tie ir piesaistīti, var veidot C<sub>3-6</sub>karbocikliskas grupas gredzenu;

R<sup>5</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, N-C<sub>1-6</sub>alkil-aminogrupa, N,N-di-(C<sub>1-6</sub>alkil)-aminogrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, heterociklilgrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heteroaril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heterociklil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, aril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, ariloksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, -(CR<sup>3</sup>R<sup>5</sup>)<sub>m</sub>-C(O)-R<sup>8</sup>, kurā: m ir 0 vai 1;

R<sup>a</sup> un R<sup>b</sup> katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; un R<sup>8</sup> ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, heterociklilgrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, aril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heteroaril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heterociklil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkiloksi-grupa, ariloksi-grupa, heteroariloksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, ariloksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heteroariloksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; heterocikliloksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai -NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, kurā

R<sup>9</sup> ir ūdeņraža atoms vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; un

R<sup>10</sup> ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, heterociklilgrupa, C<sub>3-7</sub>cikloalkil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, aril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heteroaril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai heterociklil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa; vai R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> kopā ar atomu, pie kura ir piesaistīti, var veidot C<sub>3-6</sub>karbocikliskas grupas gredzenu, kas neobligāti ir aizvietots ar hidroksilgrupu;

vai R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> kopā ar atomu, pie kura ir piesaistīti, var veidot C<sub>4-6</sub>heterociklisku gredzenu, kas satur vienu vai divus heteroatomus, kas katrs neatkarīgi izvēlēts no O, N un S;

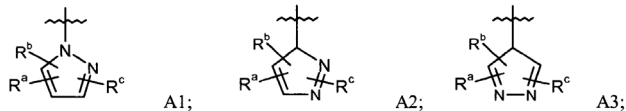
vai R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> kopā ar atomu, pie kura tie ir piesaistīti, var veidot sešu locekļu heteroarilgrupu, kas satur vienu vai divus slāpekļa atomus un kura ir neobligāti aizvietota ar halogēna atomu, aminogrupu vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupu; un R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> un R<sup>8</sup> katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkil-oksigrupa, halogēna atoms, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa vai ciāngrupa; un kurā neobligāti aizvietota, kā lietots R<sup>1</sup> un R<sup>2</sup> definīcijā, nozīmē pirazolilgrupa, fenilgrupa, piridinilgrupa, pirimidinilgrupa, pirazidinilgrupa vai tiofenilgrupa, kura ir neobligāti aizvietota neatkarīgi ar vienu līdz četriem aizvietotājiem, izvēlētiem no alkilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkilalkilgrupas, heteroalkilgrupas, hidroksilalkilgrupas, halogēna atoma, nitrogrupas, ciāngrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, aminogrupas, acilaminogrupas, mono-alkilaminogrupas, di-alkilaminogrupas, halogēnalkilgrupas, halogēn-alkoksigrupas, heteroalkilgrupas, -COR, -SO<sub>2</sub>R (kur R ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, fenilgrupa vai fenilalkilgrupa), -(CR'R'')<sub>n</sub>-COOR (kur n ir vesels skaitlis no 0 līdz 5, R' un R'' neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa un R ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, fenilgrupa vai fenilalkilgrupa) vai -(CR'R'')<sub>n</sub>-CONR<a>R<b> (kur n ir vesels skaitlis no 0 līdz 5, R' un R'' neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa un R<a> un R<b> ir, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atoms, alkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, fenilgrupa vai fenilalkilgrupa).

2. Savienojums pēc 1. pretenzijas, kurā R<sup>1</sup> ir pirazolilgrupa, neobligāti aizvietota vienreiz ar C<sub>1-6</sub>alkilgrupu vai halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupu.

3. Savienojums pēc 1. pretenzijas, kurā R<sup>2</sup> ir 4-metil-fenilgrupa, 2-fluor-4-metil-fenilgrupa, 2-hlor-4-fluor-fenilgrupa, 4-hlor-2-fluor-fenilgrupa, 2,4-dihlor-fenilgrupa, 2,4-difluor-fenilgrupa vai 2-hlor-4-metil-fenilgrupa.

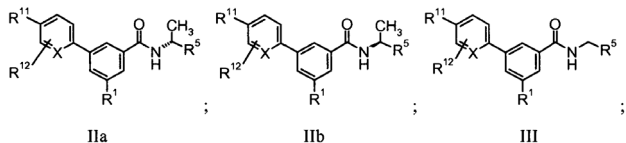
4. Savienojums pēc 1. pretenzijas, kurā R<sup>2</sup> ir 5-metil-piridin-2-ilgrupa, 5-hlor-piridin-2-ilgrupa, 5-fluor-piridin-2-ilgrupa, 5-metil-3-fluor-piridin-2-ilgrupa, 5-metil-3-hlor-piridin-2-ilgrupa, 3,5-difluor-piridin-2-ilgrupa vai 3,5-dihlor-piridin-2-ilgrupa.

5. Savienojums pēc 1. pretenzijas, kurā R<sup>1</sup> ir grupa ar formulu A1, A2 vai A3:



kurā R<sup>a</sup> un R<sup>b</sup> katrs neatkarīgi ir: ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksi-grupa, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonilgrupa, fenilgrupa, aminogrupa, N-C<sub>1-6</sub>alkilaminogrupa, N,N-di-C<sub>1-6</sub>alkil-amino-halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, halogēn-C<sub>1-6</sub>alkoksigrupa, hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>3-6</sub>cikloalkilgrupa, C<sub>3-6</sub>cikloalkil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, aminokarbonilgrupa, heterociklilkarbonilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksikarbonilgrupa vai ciāngrupa; vai R<sup>a</sup> un R<sup>b</sup> kopā ar atomiem, pie kuriem tie ir piesaistīti, var veidot fenilgrupu, piridinilgrupu vai pirimidinilgrupu, katra neobligāti aizvietota; un kurā R<sup>c</sup> ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa.

6. Savienojums pēc 1. pretenzijas, kurā minētais savienojums ir ar formulu IIa, IIb vai III:



vai farmaceitiski pieņemams tā sāls, kurā:

X ir C vai N;

R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkiloksigrupa, halogēna atoms, halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, halogēn-C<sub>1-6</sub>alkoksigrupa, hetero-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonilgrupa vai ciāngrupa; un

R<sup>1</sup> un R<sup>5</sup> ir, kā izklāstīts 1. pretenzijā.

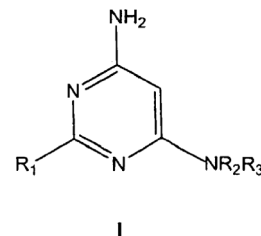
7. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceitiski pieņemamu nesēju un savienojumu pēc 1. pretenzijas.

8. Savienojums ar formulu I, saskaņā ar 1. pretenziju, izmantošanai paņēmienā, lai ārstētu sāpju stāvokli, kas izvēlētas no iekaisuma sāpēm, ķirurģiskām sāpēm, iekšējo orgānu sāpēm, zobu sāpēm, menstruālām sāpēm, centrālām sāpēm, sāpēm, kas radušās apdegumu rezultātā, migrēnas vai klastera galvassāpēm, nervu bojājuma, neirīta, neiralģijas, saindēšanās, išēmiska bojājuma,

starpmezglu cistīta, vēža, vīrusa, parazītu vai bakteriālas infekcijas, pēctraumatiska bojājuma rezultātā, vai sāpēm, saistītām ar iekaisīgo zarnu sindromu, vai elpošanas traucējuma, kas izvēlēts no hroniska obstruktīva plaušu traucējuma (COPD), astmas un bronhu spazmām, kur minētais paņēmienis, ietver savienojuma, pēc 1. pretenzijas, iedarbīga daudzuma ievadīšanu cilvēkam pēc vajadzības.

9. Savienojuma ar formulu I, saskaņā ar 1. pretenziju, izmantošana medikamenta pagatavošanai iekaisuma un/vai autoimūna stāvokļa ārstēšanai.

- (51) **C07D 471/04**<sup>(200601)</sup> (11) **2235012**  
**A61K 31/4439**<sup>(200601)</sup>
- (21) 08865603.8 (22) 18.12.2008
- (43) 06.10.2010
- (45) 17.07.2013
- (31) 07382006 (32) 21.12.2007 (33) EP  
31534 26.02.2008 US
- (86) PCT/EP2008/067950 18.12.2008
- (87) WO2009/080721 02.07.2009
- (73) Palau Pharma, S.A., Av. Cami Reial 51-57, 08184 Palau-solità i Plegamans, Barcelona, ES
- (72) CARCELLER GONZÁLEZ, Elena, ES  
MEDINA FUENTES, Eva María, ES  
SOLIVA SOLIVA, Robert, ES  
VIRGILI BERNADÓ, Marina, ES  
MARTÍ VIA, Josep, ES
- (74) HOFFMANN EITLÉ, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **4-AMINOPYRIMIDĪNA ATVASINĀJUMI KĀ HISTAMĪNA H4 RECEPTORA ANTAGONISTI**  
**4-AMINOPYRIMIDINE DERIVATIVES AS HISTAMINE H4 RECEPTOR ANTAGONISTS**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I)

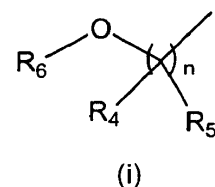


kurā:

R<sub>1</sub> apzīmē:

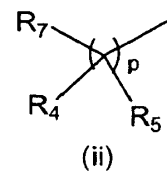
- (1) C<sub>1-8</sub>alkilgrupu;
- (2) C<sub>3-8</sub>cikloalkil-C<sub>0-6</sub>alkilgrupu;
- (3) aril-C<sub>1-6</sub>alkilgrupu;

kur (1) līdz (3) grupā katra alkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem un C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no C<sub>1-4</sub>alkilgrupas, halogēna atoma un arilgrupas; (4) grupu ar formulu (i)



vai

(5) grupu ar formulu (ii):



$R_2$  un  $R_3$  kopā ar N atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido piesātinātu heterociklisku grupu, kas var būt 4- līdz 7-locekļu monocikliska, 7- līdz 8-locekļu ar tiltiņu saistīta bicikliska vai 8- līdz 12-locekļu kondensēta bicikliska grupa, kur minētā heterocikliskā grupa var saturēt līdz diviem N atomiem un nesatur citus heteroatomus, un neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no  $C_{1-4}$ alkilgrupas un  $NR_aR_b$ , ar nosacījumu, ka heterocikliskā grupa vai nu satur 2 N atomus un nav aizvietota ar  $NR_aR_b$  grupu, vai satur 1 N atomu un ir aizvietota ar vienu  $NR_aR_b$  grupu;

vai  $R_2$  apzīmē H vai  $C_{1-4}$ alkilgrupu, un  $R_3$  apzīmē azetidīnigrupu, pīrolidīnigrupu, piperidīnigrupu vai azepanīlgrupu, kura neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākām  $C_{1-4}$ alkilgrupām;

$R_a$  apzīmē H vai  $C_{1-4}$ alkilgrupu;

$R_b$  apzīmē H vai  $C_{1-4}$ alkilgrupu;

vai  $R_a$  un  $R_b$  kopā ar N atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido azetidīnigrupu, pīrolidīnigrupu, piperidīnigrupu vai azepanīlgrupu, kura neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākām  $C_{1-4}$ alkilgrupām;

$R_4$  un  $R_5$  neatkarīgi ir izvēlēti no H un  $C_{1-4}$ alkilgrupas, un papildus viena no  $R_4$  vai  $R_5$  grupām var būt arilgrupa vai  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-6}$ alkilgrupa, un papildus divas no  $R_4$  un  $R_5$  grupām kopā var būt saistītas pie tā paša C atoma, veidojot ar minētā C atomu  $C_{3-8}$ cikloalkilgrupu;

$R_6$  apzīmē grupu, kas izvēlēta no  $C_{1-8}$ alkilgrupas,  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-6}$ alkilgrupas un aril- $C_{0-4}$ alkilgrupas, kur katra alkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem un  $C_{3-8}$ cikloalkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no  $C_{1-4}$ alkilgrupas, halogēna atoma un arilgrupas;

$R_7$  apzīmē piesātinātu monociklisku 4- līdz 7-locekļu heterociklisku gredzenu, kas satur vienu skābekļa atomu un nesatur citus papildu heteroatomus, kur minētais gredzens var būt saistīts pie molekulas atlikuma caur brīvu oglekļa atomu, un kur  $R_7$  neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākām grupām, kas neatkarīgi izvēlētas no  $C_{1-4}$ alkilgrupas un halogēna atoma;

n apzīmē 1, 2 vai 3;

p apzīmē 0, 1 vai 2; un

arilgrupa apzīmē fenilgrupu, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām grupām, kas neatkarīgi izvēlēta no  $C_{1-4}$ alkilgrupas, halogēna atoma,  $C_{1-4}$ alkoksigrupas,  $C_{1-4}$ halogēnalkilgrupas,  $C_{1-4}$ halogēnalkoksigrupas, ciāngrupas un aminogrupas; vai tā sāls.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē:

(1)  $C_{4-6}$ alkilgrupu;

(2)  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-1}$ alkilgrupu; vai

(3) aril- $C_{1-2}$ alkilgrupu.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē  $C_{1-8}$ alkilgrupu vai  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-6}$ alkilgrupu, kur katra alkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem un  $C_{3-8}$ cikloalkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no  $C_{1-4}$ alkilgrupas, halogēna atoma un arilgrupas; labāk, ja  $R_1$  apzīmē  $C_{1-8}$ alkilgrupu vai  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-6}$ alkilgrupu; vēl labāk, ja  $R_1$  apzīmē  $C_{4-6}$ alkilgrupu vai  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-1}$ alkilgrupu; bet vēl labāk, ja  $R_1$  apzīmē izobutīlgrupu, 2,2-dimetilpropilgrupu, ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu, cikloheksilgrupu, cikloheksilmetilgrupu vai ciklopropilmetilgrupu.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē  $C_{1-8}$ alkilgrupu, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē  $C_{4-6}$ alkilgrupu.

6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē izobutīlgrupu vai 2,2-dimetilpropilgrupu.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē izobutīlgrupu.

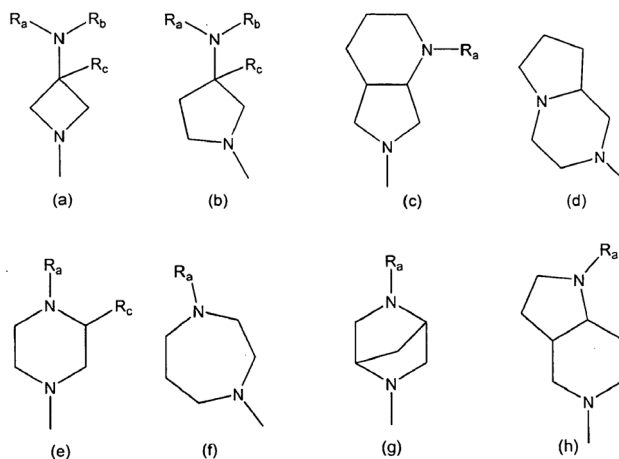
8. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē 2,2-dimetilpropilgrupu.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_{0-6}$ alkilgrupu, kur alkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem un  $C_{3-8}$ cikloalkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no  $C_{1-4}$ alkilgrupas, halogēna atoma un arilgrupas; labāk, ja  $R_1$  apzīmē  $C_{3-8}$ cikloalkil- $C_1$ alkilgrupu; vēl labāk, ja  $R_1$  nozīmē ciklopropilmetilgrupu vai cikloheksilmetilgrupu.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē  $C_{3-8}$ cikloalkilgrupu, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no  $C_{1-4}$ alkilgrupas, halogēna atoma un arilgrupas.

11. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, kur  $R_1$  apzīmē ciklobutilgrupu, ciklopentilgrupu vai cikloheksilgrupu.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kur  $R_2$  un  $R_3$  kopā ar N atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido piesātinātu heterociklisku grupu, kas izvēlēta no:



kur  $R_c$  apzīmē H vai  $C_{1-4}$ alkilgrupu, labāk, ja  $R_c$  apzīmē H.

13. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kur  $R_2$  un  $R_3$  kopā ar N atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido piesātinātu heterociklisku grupu, kas izvēlēta no (a) un (b).

14. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kur  $R_2$  un  $R_3$  kopā ar N atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido piesātinātu heterociklisku grupu ar formulu (a).

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, kur  $R_a$  un  $R_b$  neatkarīgi apzīmē H vai  $C_{1-4}$ alkilgrupu; labāk, ja  $R_a$  un  $R_b$  neatkarīgi apzīmē H vai metilgrupu; bet vēl labāk, ja  $R_a$  apzīmē H un  $R_b$  apzīmē H vai metilgrupu.

16. Savienojums saskaņā ar 15. pretenziju, kur  $R_a$  apzīmē H un  $R_b$  apzīmē metilgrupu.

17. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un vienu vai vairākas farmaceutiski pieņemamas palīgvielas.

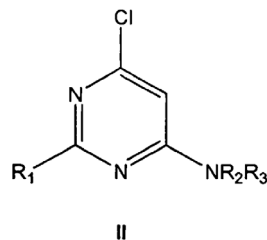
18. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana terapijā.

19. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana histamīna  $H_4$  receptora izraisītu slimību ārstēšanai.

20. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana alerģisku, imunoloģisku vai iekaisuma slimību, vai sāpju ārstēšanai.

21. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

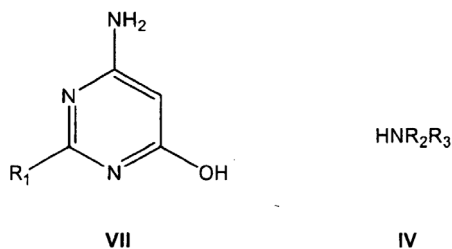
(a) savienojuma ar formulu (II)



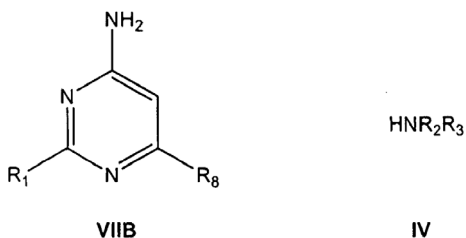
kurā  $R_1$ ,  $R_2$  un  $R_3$  nozīme ir tāda kā 1. pretenzijā, reakciju ar amoniju vai amonija ekvivalentu; vai

(b) savienojuma ar formulu (VII) reakciju ar savienojumu ar formulu (IV) (vai tā aminogrupas aizsargātu formu)

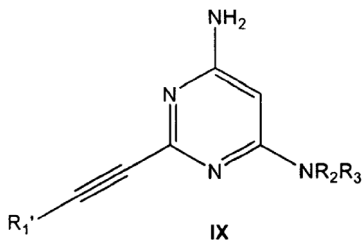




kurā R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> un R<sub>3</sub> nozīme ir tāda kā 1. pretenzijā, kam seko, ja nepieciešams, jebkuras aizsarggrupas, kas tajā var būt, aizvākšana; vai (c) savienojuma ar formulu (VIIb) reakciju ar savienojumu ar formulu (IV) (vai tā aminogrupas aizsargātu formu)



kurā R<sub>8</sub> apzīmē aizejošu grupu un R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> un R<sub>3</sub> nozīme ir tāda kā 1. pretenzijā, kam seko, ja nepieciešams, jebkuras aizsarggrupas, kas tajā var būt, aizvākšana; vai (d) kad savienojumā ar formulu (I) R<sub>1</sub> apzīmē R<sub>1</sub>'-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, savienojuma ar formulu (IX) apstrādi ar reducējošo līdzekli



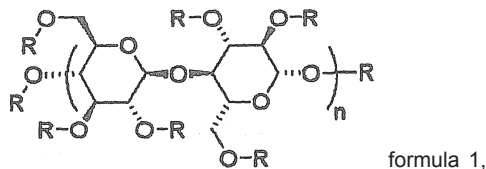
kurā R<sub>1</sub>' apzīmē C<sub>1-6</sub>alkilgrupu vai C<sub>3-8</sub>cikloalkil-C<sub>0-4</sub>alkilgrupu vai aril-C<sub>0-4</sub>alkilgrupu, kur katra alkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem un C<sub>3-8</sub>cikloalkilgrupa neobligāti var būt aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi izvēlēti no C<sub>1-4</sub>alkilgrupas, halogēna atoma un arilgrupas, vai R<sub>1</sub> apzīmē grupu ar formulu (i), kurā n nozīmē 2 un R<sub>4</sub> un R<sub>5</sub> apzīmē H, vai grupu ar formulu (ii) kurā p nozīmē 2 un R<sub>4</sub> un R<sub>5</sub> apzīmē H; un R<sub>2</sub> un R<sub>3</sub> nozīme ir tāda kā 1. pretenzijā; vai (e) vienā vai vairākās stadijās savienojuma ar formulu (I) pārvēršanu citā savienojumā ar formulu (I).

(51) **C12N 5/02**<sup>(200601)</sup> (11) **2235160**  
**C12N 5/073**<sup>(201001)</sup>  
**C12N 5/075**<sup>(201001)</sup>  
**C12N 5/076**<sup>(201001)</sup>  
(21) 08866081.6 (22) 19.12.2008  
(43) 06.10.2010  
(45) 10.04.2013  
(31) 15764 (32) 21.12.2007 (33) US  
20076604 21.12.2007 NO  
(86) PCT/US2008/087818 19.12.2008  
(87) WO2009/086191 09.07.2009  
(73) Ali Bin M. Abdullah, Jaffar, A4-3 Kondo Danau Murni Taman Danau Desa, 58100 Kuala Lumpur, MY  
(72) ALI BIN M. ABDULLAH, Jaffar, MY  
(74) Zwicker, Jörk, Dr. Volker Vossius, Patent- und Rechtsanwaltskanzlei, Geibelstrasse 6, 81679 München, DE  
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
(54) **PROTEĪNU NESATUROŠI DZIMUMŠŪNU UN EMBRIJU APSTRĀDES UN KULTŪRU BAROTŅU PRODUKTI**  
**PROTEIN-FREE GAMETE AND EMBRYO HANDLING AND CULTURE MEDIA PRODUCTS**

(57) 1. Proteīnu praktiski nesaturoša šūnu kultūru barotne cilvēka reproduktīvajām šūnām, piemērota izmantošanai to cilvēka reproduktīvo šūnu *in vitro* apstrādei, kuras tiks izmantotas *in vitro* fertilizācijā un citās reproduktīvajās palīgtechnoloģijās; satur minerālāļus, aminoskābes, antioksidantus, vitamīnus, barības vielas, antibiotikas, D-manitolu un metilcelulozi; molekulas masa ir 14 000 daltoni.

2. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētajai metilcelulozei ir raksturīgs tas, ka 2 % šķīduma viskozitāte 25°C temperatūrā ir 15 centipauzi.

3. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā metilceluloze ir ar šādu formulu 1:



kur katrs R neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai CH<sub>3</sub> grupa un n ir vesels skaitlis, kura vērtība ir no 34 līdz 43, un kur metoksigrupas aizvietošana ir no 27,5 līdz 31,5 % pēc masas.

4. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 3. pretenziju, kur katrai formulas 1 savienojuma cukura daļai pievienoto CH<sub>3</sub> aizvietotāju vidējais skaits ir 1,5 līdz 1,9.

5. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kur minētās metilcelulozes koncentrācija šķīdumā ir no 0,01 g/l (0,71 mikromolāri) līdz 0,5 g/l (0,036 mikromolāri).

6. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kur aminoskābes ir L-arginīns, L-cistīns, L-histidīns, L-izoleicīns, L-leicīns, L-lizīns, L-metionīns, L-fenilalanīns, L-treonīns, L-triptofāns, L-tirozīns, L-valīns, L-alanīns, L-aurīns, L-glutamīnskābe, L-glutamīns vai glicīns, vai jebkāda to kombinācija.

7. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kur barotnē ietilpstošie minerālāļi ir kalcija hlorīds, magnija sulfāts, kālija hlorīds, nātrija hlorīds un nātrija fosfāts.

8. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kur barotni veidojošie vitamīni ir holīna hlorīds, mioinozīts, niacīnamīds, D-pantotēnskābe, piridoksīna HCl, riboflavīns, tiamīna HCl, folijskābe, vitamīns B12, vitamīns E vai jebkāda to kombinācija.

9. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kur barotni veidojošās barības vielas ir D-gliukoze, piruvāts, fruktoze, pienskābe vai jebkāda to kombinācija.

10. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī gentamicīna sulfātu, kur gentamicīna sulfāta koncentrācija šķīdumā ir no 1,5 līdz 4 mg/l.

11. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī EDTA.

12. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī HEPES.

13. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur fenolsarkano vai citu pH indikatoru.

14. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī gentamicīna sulfātu, kur gentamicīna sulfāta koncentrācija šķīdumā ir no 1,5 līdz 4 mg/l.

15. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī penicilīnu G, kur penicilīna G koncentrācija ir 75 mg/l.

16. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī D-mannitolu.

17. Proteīnu praktiski nesaturoša barotne saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas satur arī nātrija bikarbonātu.

18. Barotne saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai pie reproduktīvās palīgtechnoloģiju metodes, kas ietver cilvēka reproduktīvo šūnu apstrādi ar proteīnu praktiski nesaturošu kultūru barotni.

19. Barotne izmantošanai saskaņā ar 18. pretenziju, kur cilvēka reproduktīvā šūna ir neapauglota olšūna, liels daudzums spermatozoīdu, vai apauglota olšūna un, kur barotne ir specifiski piemērota intrauterīnai apaugļošanai.

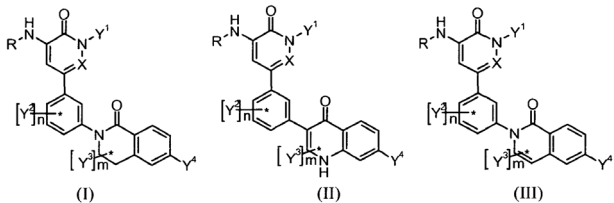
20. Process proteīnu praktiski nesaturošas šūnu kultūru barotnes pagatavošanai cilvēka reproduktīvajām šūnām saskaņā ar 1. pretenziju, kur barotne tiek sagatavota no vismaz viena vai

daudziem minerālsāju, aminoskābju, antioksidantu, vitamīnu, barības vielu, antibiotiku, D-mannitola un metilcelulozes atsāļņiem ar molekulasmasu 14 000 daltoni, kur minētie atsāļņi tiek atšķaidīti ar ūdeni, lai veidotu proteīnu praktiski nesaturošu šūnu kultūru barotni.

- (51) **C07D 401/10**<sup>(200601)</sup> (11) **2242749**  
**C07D 401/14**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/4725**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 19/02**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09709135.9 (22) 27.01.2009  
(43) 27.10.2010  
(45) 10.04.2013
- (31) 26204 (32) 05.02.2008 (33) US  
122510 15.12.2008 US
- (86) PCT/EP2009/050875 27.01.2009  
(87) WO2009/098144 13.08.2009
- (73) F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
- (72) DEWDNEY, Nolan James, US  
KENNEDY-SMITH, Joshua, US  
KONDRU, Rama K., US  
LOE, Bradley E., US  
LOU, Yan, US  
MCINTOSH, Joel, US  
OWENS, Timothy D., US  
SOTH, Michael, US  
SWEENEY, Zachary Kevin, US  
TAYGERLY, Joshua Paul Gergely, US
- (74) Sauer, Frank, F. Hoffmann-La Roche AG, Patent Department, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH  
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **JAUNI PIRIDINONI UN PIRIDAZINONI  
NOVEL PYRIDINONES AND PYRIDAZINONES**

- (57) 1. Savienojums ar formulu (I), (II) vai (III)



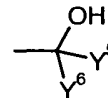
kur:  
R ir H, -R<sup>1</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> vai -R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>;  
R<sup>1</sup> ir arilgrupa, heteroarilgrupa, cikloalkilgrupa vai heterocikloalkilgrupa, un pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, hidroksilgrupām, hidroksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupām, halogēna atomiem, nitrogrupām, aminogrupām, amidogrupām, ciāngrupām, oksogrupām vai halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupām;  
R<sup>2</sup> ir -C(=O), -C(=O)O, -C(=O)NR<sup>2</sup>, -NHC(=O)O, -C(=NH)NR<sup>2</sup> vai -S(=O)<sub>2</sub>; kur R<sup>2</sup> ir H vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupa;  
R<sup>3</sup> ir H vai R<sup>4</sup>; kur R<sup>4</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, aminogrupa, arilgrupa, arilalkilgrupa, alkilarilgrupa, heteroarilgrupa, alkilheteroarilgrupa, heteroarilalkilgrupa, cikloalkilgrupa, alkilcikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa, heterocikloalkilgrupa, alkilheterocikloalkilgrupa vai heterocikloalkilalkilgrupa, un pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, hidroksilgrupām, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupām, hidroksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, hidroksi-C<sub>1-6</sub>alkoksigrupām, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonilgrupām, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonamidogrupām, karbamātgrupām, karboksilgrupām, estera grupām, amidogrupām, acilgrupām, halogēna atomiem, nitrogrupām, aminogrupām, ciāngrupām, oksogrupām vai halogēn-C<sub>1-6</sub>alkilgrupām;  
X ir CH vai N;  
Y<sup>1</sup> ir H, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa;  
katrs Y<sup>2</sup> neatkarīgi ir halogēna atoms, oksigrupa vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupa pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēloties no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, C<sub>1-6</sub>halogēnalkoksigrupas, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, karboksilgrupas, aminogrupas un halogēna atomiem;  
n ir 0, 1, 2 vai 3;

Y<sup>3</sup> ir H, halogēna atoms vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupa pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēloties no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, aminogrupas un halogēna atoma;

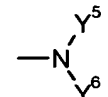
- m ir 0 vai 1;  
Y<sup>4</sup> ir Y<sup>4a</sup>, Y<sup>4b</sup>, Y<sup>4c</sup> vai Y<sup>4d</sup>; kur Y<sup>4a</sup> ir H vai halogēna atoms; Y<sup>4b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, kas pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēloties no rindas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas, ciāngrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas; Y<sup>4c</sup> ir C<sub>1-6</sub>cikloalkilgrupa, kas pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēloties no rindas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna, hidroksilgrupas, aminogrupas, ciāngrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas; un Y<sup>4d</sup> ir aminogrupa, kas pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, alkoksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupām vai hidroksi-C<sub>1-6</sub>alkilgrupām; vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu I.
  - Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu II.
  - Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu III.
  - Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur Y<sup>1</sup> ir metilgrupa.
  - Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur X ir CH.
  - Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur n ir 1, un m ir 0.
  - Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur Y<sup>3</sup> ir H.
  - Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur Y<sup>2</sup> ir metilgrupa, hidroksimetilgrupa, hidroksietilgrupa vai halogēna atoms.
  - Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur Y<sup>4</sup> ir



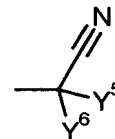
kur Y<sup>5</sup> ir halogēna atoms, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa;



kur Y<sup>5</sup> un Y<sup>6</sup> neatkarīgi ir H, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa,



kur Y<sup>5</sup> un Y<sup>6</sup> neatkarīgi ir H vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, vai

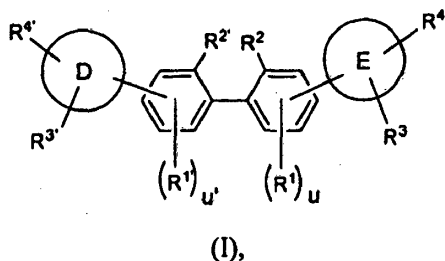


kur Y<sup>5</sup> un Y<sup>6</sup> neatkarīgi ir H, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa.

- Savienojums saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kur R ir -R<sup>1</sup>-R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>; kur R<sup>1</sup> ir fenilgrupa vai pirdilgrupa; R<sup>2</sup> ir -C(=O); R<sup>3</sup> ir R<sup>4</sup>; un R<sup>4</sup> ir morfolīngrupa vai piperazīngrupa, un pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām.
- Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kas izmantojams, ārstējot iekaisuma un/vai autoimūnu stāvokli, piemēram, artrītu, vai inhibējot B šūnu proliferāciju.
- Farmaceutiska kompozīcija, kas satur Btk inhibitoru savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, samaisot ar vismaz vienu farmaceitiski pieņemamu nesēju, pildvielu vai atšķaidītāju.
- Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai izmantošana, medikamentu pagatavošanai iekaisuma un/vai autoimūna stāvokļa ārstēšanai.

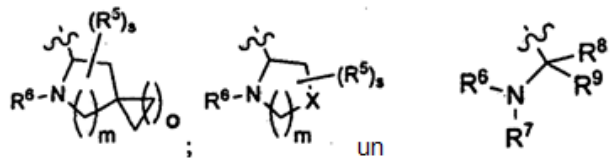
- (51) **C07D 403/14**<sup>(200601)</sup> (11) **2242750**  
**C07D 405/14**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/4178**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 31/14**<sup>(200601)</sup>

- (21) 09710934.2 (22) 02.02.2009  
 (43) 27.10.2010  
 (45) 24.04.2013  
 (31) 28266 (32) 13.02.2008 (33) US  
 (86) PCT/US2009/032830 02.02.2009  
 (87) WO2009/102568 20.08.2009  
 (73) Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 05843-4000, US  
 (72) BACHAND, Carol, CA  
 BELEMA, Makonen, US  
 DEON, Daniel, H., CA  
 GOOD, Andrew, C., US  
 GOODRICH, Jason, US  
 JAMES, Clint, A., CA  
 LAVOIE, Rico, US  
 LOPEZ, Omar, D., US  
 MARTEL, Alain, CA  
 MEANWELL, Nicholas, A., US  
 NGUYEN, Van, N., US  
 ROMINE, Jeffrey, Lee, US  
 RUEDIGER, Edward, H., CA  
 SNYDER, Lawrence, B., US  
 ST. LAURENT, Denis, R., US  
 YANG, Fukang, US  
 LANGLEY, David, R., US  
 WANG, Gan, US  
 HAMANN, Lawrence, G., US  
 (74) Reitsstötter - Kinzbech, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE  
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
 (54) **KONFORMACIONĀLI IEROBEŽOTI BIFENILGRUPAS ATVASINĀJUMI IZMANTOŠANAI PAR C HEPATĪTA VĪRUSA INHIBITORIEM**  
**CONFORMATIONALLY RESTRICTED BIPHENYL DERIVATIVES FOR USE AS HEPATITIS C VIRUS INHIBITORS**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu (I)



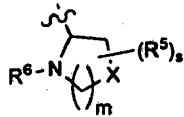
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur u un u' neatkarīgi ir 0, 1, 2 vai 3; D un E katrs ir piecu locekļu aromātisks gredzens, kas satur vienu, divus vai trīs heteroatomus, neatkarīgi izvēloties no slāpekļa, skābekļa un sēra atoma; katru R<sup>1</sup> un R<sup>1'</sup> neatkarīgi izvēlas no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas un (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas; R<sup>2</sup> un R<sup>2'</sup> kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido piecu līdz astoņu locekļu nepiesātinātu gredzenu, kas neobligāti satur vienu vai divus heteroatomus, neatkarīgi izvēloties no slāpekļa, skābekļa un sēra atoma; kur piecu līdz astoņu locekļu nepiesātināto gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu, diviem vai trīs aizvietotājiem, neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, arilsulfonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas, oksogrupas un spirocikla; R<sup>3</sup> un R<sup>3'</sup> katru neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkoksikarbonilalkilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, karboksilgrupas, halogēnalkilgrupas, heterociklilalkilgrupas, hidroksialkilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas un trialkilsililalkoksialkilgrupas;

R<sup>4</sup> un R<sup>4'</sup> katru neatkarīgi izvēlas no



kur katrs m neatkarīgi ir 0, 1 vai 2; katrs o neatkarīgi ir 1, 2 vai 3; katrs s neatkarīgi ir 0, 1, 2, 3 vai 4; katru X neatkarīgi izvēlas no O, S, S(O), SO<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>, CHR<sup>5</sup> un C(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>; ar nosacījumu, ka, ja n ir 0, X izvēlas no CH<sub>2</sub>, CHR<sup>5</sup> un C(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>; katru R<sup>5</sup> neatkarīgi izvēlas no alkoksigrupas, alkilgrupas, arilgrupas, halogēna, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas un -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, kur alkilgrupa neobligāti var veidot kondensētu trīs līdz sešu locekļu gredzenu ar blakus esošu oglekļa atomu, kur šo trīs līdz sešu locekļu gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu vai divām alkilgrupām; katru R<sup>6</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un R<sup>10</sup>-C(S)-; R<sup>7</sup> izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas; R<sup>8</sup> un R<sup>9</sup> katru neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkenilgrupas, alkoksialkilgrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas un (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas; vai R<sup>9</sup> kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido piecu vai sešu locekļu piesātinātu gredzenu, kas neobligāti satur vienu vai divus heteroatomus, izvēloties no NR<sup>2</sup>, O un S; kur R<sup>2</sup> izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas; un katru R<sup>10</sup> neatkarīgi izvēlas no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkoksikarbonilalkilgrupas, alkilgrupas, alkilkarbonilalkilgrupas, arilgrupas, arilalkoksigrupas, arilalkilgrupas, ariloksialkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkenilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, cikloalkiloksialkilgrupas, halogēnalkilgrupas, heterociklilgrupas, heterociklilalkenilgrupas, heterociklilalkoksigrupas, heterociklilalkilgrupas, heterocikliloksialkilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkenilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas un (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas; R<sup>a</sup> un R<sup>b</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkenilgrupas un alkilgrupas; R<sup>c</sup> un R<sup>d</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkeniloksikarbonilgrupas, alkoksialkilkarbonilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilkarbonilgrupas, alkilsulfonilgrupas, arilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkilkarbonilgrupas, arilkarbonilgrupas, ariloksikarbonilgrupas, arilsulfonilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkilsulfonilgrupas, formilgrupas, halogēnalkoksikarbonilgrupas, heterociklilgrupas, heterociklilalkoksikarbonilgrupas, heterociklilalkilgrupas, heterociklilalkilkarbonilgrupas, heterociklilkarbonilgrupas, heterocikliloksikarbonilgrupas, hidroksialkilkarbonilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilkarbonilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)sulfonilgrupas, -C(NCN)OR' un -C(NCN)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, kur R' izvēlas no alkilgrupas un neaizvietotas fenilgrupas, un kur alkilgrupu šajā arilalkilgrupā, arilalkilkarbonilgrupā, heterociklilalkilgrupā un heterociklilalkilkarbonilgrupā neobligāti papildus aizvieto ar vienu -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> grupu; un kur arilgrupu un arilgrupu šajā arilalkoksikarbonilgrupā, arilalkilgrupā, arilalkilkarbonilgrupā, arilkarbonilgrupā, ariloksikarbonilgrupā un arilsulfonilgrupā, heterociklilgrupu un heterociklilgrupu šajā heterociklilalkoksikarbonilgrupā, heterociklilalkilgrupā, heterociklilalkilkarbonilgrupā, heterociklilkarbonilgrupā un heterocikliloksikarbonilgrupā neobligāti papildus aizvieto ar vienu, diviem vai trīs aizvietotājiem, neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkilgrupas, ciāngrupas, halogēna, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas un nitrogrupas; R<sup>c</sup> un R<sup>d</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, neaizvietotas arilgrupas, neaizvietotas arilalkilgrupas, neaizvietotas cikloalkilgrupas, neaizvietotas (cikloalkil)alkilgrupas, neaizvietotas heterociklilgrupas, neaizvietotas heterociklilalkilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas un (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas; un R<sup>x</sup> un R<sup>y</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilkarbonilgrupas, neaizvietotas arilgrupas, neaizvietotas arilalkoksikarbonilgrupas, neaizvietotas arilalkilgrupas, neaizvietotas cikloalkilgrupas, neaizvietotas heterociklilgrupas un (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas, kur R<sup>x</sup> un R<sup>y</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R<sup>4</sup> un R<sup>5</sup> katrs ir



3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur katrs m ir 1.

4. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur katrs X ir CH<sub>2</sub>.

5. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur s ir 0.

6. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur katrs R<sup>6</sup> ir R<sup>10</sup>-C(O)-.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur katru R<sup>10</sup> neatkarīgi izvēlas no arilalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas un (NR<sup>a</sup>R<sup>d</sup>)alkilgrupas.

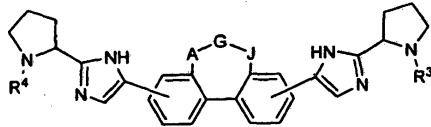
8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur u un u' katrs ir 0.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R<sup>3</sup> un R<sup>3'</sup> katrs ir ūdeņraža atoms.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>2</sup> un R<sup>2'</sup> kopā ar atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido piecu locekļu gredzenu, kas neobligāti satur skābekļa vai slāpekļa atomu, kur minēto gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu vai diviem aizvietotājiem, neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilsulfonilgrupas, arilgrupas, arilalkilgrupas, arilsulfonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna atoms, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas un oksogrupas.

11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>2</sup> un R<sup>2'</sup> kopā ar atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido septiņu locekļu gredzenu, kas satur heteroatomu, izvēloties no skābekļa un slāpekļa atoma, kur minēto gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu, diviem vai trīs aizvietotājiem, neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilsulfonilgrupas, arilgrupas, arilalkilgrupas, arilsulfonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupas, (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)karbonilgrupas un oksogrupas.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (II)



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur

A ir promesošs vai ir CR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>;

G izvēlas no CR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, O un NR<sup>13</sup>;

J ir promesošs vai ir CR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>;

R<sup>3</sup> un R<sup>4</sup> katru neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un R<sup>10</sup>-C(O)-; katrs R<sup>10</sup> ir neatkarīgi izvēlēta arilalkilgrupa, (cikloalkil)alkilgrupa un (NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)alkilgrupa;

katru R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkilgrupas un -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>; vai R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> kopā veido oksogrupu; vai R<sup>11</sup> un R<sup>12</sup> kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido trīs līdz astoņu locekļu spirociklu; un katru R<sup>13</sup> neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkoksialkilgrupas, alkilgrupas un arilsulfonilgrupas.

13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, ko izvēlas no:  
 metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(9-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-6-metil-6,7-dihidro-5H-dibenzo[c,e]azepin-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;  
 metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-oks-9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;  
 metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(9-hidroksi-7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-

9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(9-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-5,7-dihidro-dibenzo[c,e]oksepin-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(9-(dimetilamino)-7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-metil-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-metil-9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(9-(dimetilamino)-7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-metil-9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-2-((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-metil-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;

metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-metil-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-metil-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(fenilsulfonil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

(1S,1'S)-2,2'-(6-metil-6,7-dihidro-5H-dibenzo[c,e]azepin-3,9-diil)bis(1H-imidazol-4,2-diil(2S)-2,1-pirolidindil)bis(N,N-dietyl-2-okso-1-feniletānamīna);

metil ((1S)-2-((2S)-2-(4-(9-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-5,7-dihidro-dibenzo[c,e]oksepin-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;

metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(fenilsulfonil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil rac-((1R,2S)-2-metoksi-1-(((2R)-2-(5-(7-(2-((2R)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-D-treonil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(fenilsulfonil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil ((1S)-2-((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(fenilsulfonil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;

metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil ((1S)-2-((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9,9-dimetil-9H-fluoren-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

dimetil ((9,9-dimetil-9H-fluoren-2,7-diil)bis(1H-imidazol-5,2-diil(2S)-2,1-pirolidindil((1S)-1-ciklopropil-2-okso-2,1-etāndil)))biskarbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)spiro[ciklobutān-1,9'-fluoren]-2'-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-2-((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)spiro[ciklobutān-1,9'-fluoren]-2'-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;

dimetil (5,7-dihidro-dibenzo[c,e]oksepin-3,9-diil)bis(1H-imidazol-4,2-diil(2S)-2,1-pirolidindil((1S)-2-okso-1-(tetrahydro-2H-piran-4-il)-2,1-etāndil)))biskarbamāta;



dimetil (5,7-dihydrodibenzo[c,e]oksepin-3,9-diilbis(1H-imidazol-4,2-diil(2S)-2,1-pirolidinediil(2-okso-1-(tetrahydro-2H-piran-4-il)-2,1-etāndiil)))biskarbamāta;

metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(9-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-5,7-dihydrodibenzo[c,e]oksepin-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

(1S,1'S)-2,2'-(5,7-dihydrodibenzo[c,e]oksepin-3,9-diilbis(1H-imidazol-4,2-diil(2S)-2,1-pirolidindiil))bis(N,N-dietil-2-okso-1-feniletānamīna);

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(2-metoksietil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

metil ((1S)-2-((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(2-metoksietil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;

metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(5-(7-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-9-(2-metoksietil)-9H-karbazol-2-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(4-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)di-benzo[b,d]furan-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta;

dimetil (dibenzo[b,d]furan-3,7-diilbis(1H-imidazol-4,2-diil(2S)-2,1-pirolidindiil(1S)-1-ciklopropil-2-okso-2,1-etāndiil)))biskarbamāta;

metil ((1S)-1-(((2S)-2-(4-(7-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3,3-dimetilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)di-benzo[b,d]furan-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2,2-dimetilpropil)karbamāta; un

metil ((1S)-2-hidroksi-1-(((2S)-2-(4-(7-(2-((2S)-1-((2S)-3-hidroksi-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)di-benzo[b,d]furan-3-il)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamāta.

14. Kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, un farmaceutiski pieņemamu nesēju, neobligāti papildus saturot vienu vai divus papildu savienojumus, kuriem ir pret CHV aktivitāte.

15. Kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir interferons, ko izvēlas labāk no interferona alfa 2B, pegilēta interferona alfa, konsensusa interferona, interferona alfa 2A un limfoblastoīdu interferona *tau*, vai ribavīrīna.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kas izmantojams, ārstējot CHV infekciju pacientā, neobligāti saturot vienu vai divu papildu savienojumu, kuriem ir pret CHV aktivitāte, izmantošanu pirms, pēc vai vienlaikus ar savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

17. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 16. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir interferons, ko izvēlas labāk no interferona alfa 2B, pegilēta interferona alfa, konsensusa interferona, interferona alfa 2A un limfoblastoīdu interferona *tau* vai ribavīrīna.

(74) Hilden, Børge André, et al, ACAPO AS, Strandgaten 198, 5004 Bergen, NO  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **DUBLĒJOŠĀ DZINEKĻA SISTĒMA REDUNDANT THRUSTER SYSTEM**

(57) 1. Dublējoša dzinekļa sistēma ūdens transporta līdzekļa dinamiskai pozicionēšanai, kas satur vismaz trīs dzinekļus, lai radītu transversālu aksiālo slodzi, kas savienots ar sadales paneli galvenajai energoapgādei, kur minētais sadales panelis ir sadalīts divās daļās ar savienotājkopni, kurai ir elektriski izolētas enerģijas sadales sistēmas, kur minētās vismaz divas sadales paneļa daļas parasti ir aktīvas un katra daļa ir izveidota vismaz divu dzinekļu barošanai, kur vismaz viens dzinekļis, proti, dublējošais dzinekļis ir savienots ar abām galvenā sadales paneļa daļām, nodrošinot ūdens transporta līdzeklim divkāršu barošanas sistēmu un trīspusīga dzinekļa dublēšanu.

2. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētā dublējošā dzinekļa enerģijas sadales sistēma satur kompleksu, kurš ietver frekvences pārveidotāju ar divkāršu taisngriezi, barošanas avotu no katras sadales paneļa daļas, vismaz vienu izolējošu transformatoru un dublējošu enerģijas padevi visām palīgsistēmām.

3. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam pirmais un trešais dzinekļis ir savienots ar galvenā sadales paneļa vienu daļu, bet otrais un trešais dzinekļis ir savienots ar galvenā sadales paneļa otru daļu.

4. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur vienas vai vairāku palīgsistēmu dublējošu galvenās barošanas apgādes sadales sistēmu, pie kam vismaz viena no palīgsistēmām saņem enerģiju no divām dažādām sadales paneļa daļām.

5. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur vienas vai vairāku palīgsistēmu dublējošu galvenās barošanas apgādes sadales sistēmu, pie kam vismaz viena no palīgsistēmām saņem enerģiju no atvēlētās nepārtrauktas barošanas padeves avota UPS ar divām barošanas padevēm vai sistēmas ar divām barošanas padevēm ar automātisku pāreju.

6. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 5. pretenzijai, kas satur frekvences pārveidotāja vadības sistēmu, pie kam enerģijas piegāde minētajai vadības sistēmai ir dublējošā visām trešā dublējošā dzinekļa sistēmām.

7. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur dzinekļa vadības sistēmu un frekvences pārveidotāja vadības sistēmu, pie kam minētās vadības sistēmas saņem enerģiju no atsevišķas 24 V DC sistēmas ar uzlādes ierīci, kas savienota ar dublējošu enerģijas piegādes sistēmu.

8. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinekļa sistēma satur dzinekļa mezglu ar diviem hidraulisku sūkņu agregātiem (dežūrējošo/rezerves), un abi sūkņi saņem enerģiju no dažādām sadales paneļa pusēm.

9. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinekļa sistēma satur dzinekļa vienību ar hidraulisku sūkņa agregātu, un sūknis saņem enerģiju no atvēlētās nepārtrauktas barošanas padeves avota UPS ar divām barošanas padevēm vai sistēmas ar divām barošanas padevēm ar automātisku pāreju.

10. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinekļa sistēma satur vienu vai vairākas jūras ūdens un/vai saldūdens veida ūdens dzesēšanas sistēmas, katra dzesēšanas sistēma satur divus dzesēšanas sūkņus (dežūrējošo/rezerves), un abi sūkņi saņem enerģiju no dažādām sadales paneļa pusēm.

11. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinekļa sistēma satur vienu vai vairākas jūras ūdens un/vai saldūdens veida ūdens dzesēšanas sistēmas, katra dzesēšanas sistēma satur vienu dzesēšanas sūknī, un minētais sūknis saņem enerģiju no atvēlētās nepārtrauktas barošanas padeves avota UPS ar divām barošanas padevēm vai sistēmas ar divām barošanas padevēm ar automātisku pāreju.

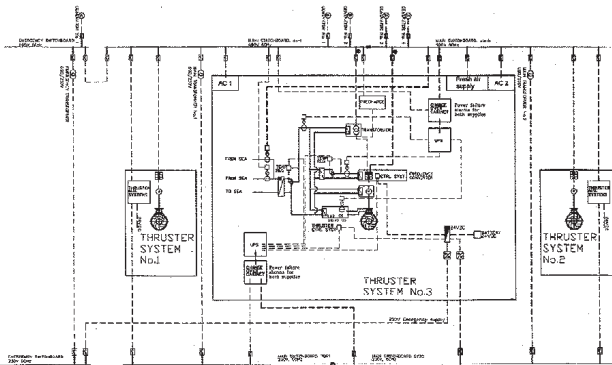
12. Dublējoša dzinekļa sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinekļa sistēma satur vienu vai vairākus atsevišķus palīgsūkņus, kas saņem enerģiju no UPS

- (51) **B63H 23/24**<sup>(200601)</sup> (11) **2243700**  
**B63H 25/42**<sup>(200601)</sup>  
**B63H 25/46**<sup>(200601)</sup>  
**B63H 21/17**<sup>(200601)</sup>  
**B63H 21/22**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10161060.8 (22) 26.04.2010  
(43) 27.10.2010  
(45) 19.06.2013  
(31) 20091640 (32) 24.04.2009 (33) NO  
(73) Rolls-Royce Marine AS, dept. Ship Technology - Offshore, P.O.Box 160, 6067 Ulsteinvik, NO  
(72) KLEPPE, Robert, NO

ar divām enerģijas padevēm un automātisku pāreju vai divkāršas enerģijas padeves vairākdzinēju elektropiedziņu ar līdzīgu izkārtojumu kā galvenajai piedziņai.

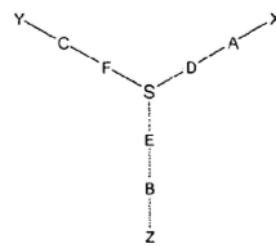
13. Dublējoša dzinēja sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinēja sistēma satur divus palīgsūkņus, viens no sūkņiem katrā divu sūkņu komplektā saņem enerģiju no galvenā sadales paneļa vienas puses, bet otrs sūknis – no otras puses.

14. Dublējoša dzinēja sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam dublējošā dzinēja sistēma satur temperatūras vadības ierīci, kuru baro papildu barošanas avots.



- (51) **A01N 43/40**<sup>(200601)</sup> (11) **2257164**  
**A01N 43/90**<sup>(200601)</sup>  
**A01P 13/02**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09715931.3 (22) 19.02.2009  
(43) 08.12.2010  
(45) 01.05.2013  
(31) 08003526 (32) 27.02.2008 (33) EP  
(86) PCT/EP2009/001182 19.02.2009  
(87) WO2009/106259 03.09.2009  
(73) Bayer CropScience AG, Alfred-Nobel-Straße 50, 40789 Monheim, DE  
(72) HACKER, Erwin, DE  
BRINK, Arne, DE  
BICKERS, Udo, DE  
HILLS, Martin, Jeffrey, DE  
(74) Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **DIFLUFENIKĀNU SATUROŠAS HERBICĪDU KOMBINĀCIJAS**  
**DIFLUFENICAN-CONTAINING HERBICIDAL COMBINATIONS**
- (57) 1. Herbicīdu kombinācijas, kas satur:  
A) diflufenikānu (komponentu A); un  
B) piroksulamu (komponentu B).  
2. Herbicīdu kombinācijas saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur kā vienīgās herbicīdu aktīvās vielas diflufenikānu un piroksulamu.  
3. Herbicīdu kombinācijas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā komponentu A un B masu attiecība vienam pret otru ir no 2 : 1 līdz 100 : 1.  
4. Herbicīdu kombinācijas saskaņā ar 3. pretenziju, kurā komponentu A un B masu attiecība vienam pret otru ir no 2 : 1 līdz 20 : 1.  
5. Herbicīdu kombinācijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas papildus satur augu aizsardzībā parasti lietojamas piedevas un/vai kompozīcijas palīgvielas.  
6. Herbicīdu kombinācijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas papildus satur vienu vai vairākus papildu komponentus no agroķīmisku aktīvo vielu grupas, kas sastāv no insekticīdiem, fungicīdiem un antidotiem.  
7. Herbicīdu kombinācijas saskaņā ar 6. pretenziju, kas satur antidotu.  
8. Herbicīdu kombināciju saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošana kaitīgu augu apkarošanai.

- (51) **C12N 15/10**<sup>(200601)</sup> (11) **2258870**  
**C12Q 1/68**<sup>(200601)</sup>  
**C07H 21/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10075295.5 (22) 09.06.2006  
(43) 08.12.2010  
(45) 02.01.2013  
(31) 689466 P (32) 09.06.2005 (33) US  
731041 P 28.10.2005 US  
(62) EP06784718.6 / EP1910538  
(73) GlaxoSmithKline LLC, One Franklin Plaza, 200, North 16th Street, Philadelphia, PA 19102, US  
(72) MORGAN, Barry, US  
HALE, Stephen, US  
ARICO-MUENDEL, Christopher C., US  
CLARK, MATTHEW, US  
WAGNER, Richard, US  
KAVARANA, Malcolm J., US  
CREASER, Steffen Phillip, US  
FRANKLIN, George J., US  
CENTRELLA, Paolo A., US  
ISRAEL, David I., US  
GEFTER, Malcolm L., US  
BENJAMIN, Dennis, US  
HANSEN, Nils Jakob Vest, US  
ACHARYA, Raksha A., US  
(74) Lock, Graham James, et al, Fry Heath & Spence LLP, The Gables Massetts Road, Horley Surrey RH6 7DQ, GB  
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **SAVIOJUMA, KAS SAISTĀS PIE BIOLĒGISKAS MĒRĶMOLEKULAS, IDENTIFICĒŠANAS PAŅĒMIENS**  
**METHOD FOR IDENTIFYING COMPOUNDS WHICH BIND TO BIOLOGICAL TARGET MOLECULE**
- (57) 1. Savienojumu, kuri saistās ar bioloģisko mērķi, identifikācijas metode, kura sastāv no etapiem:  
(a) bioloģiskā mērķa kontaktēšanās ar savienojumu bibliotēku, kura ietver vismaz 10<sup>2</sup> dažādu savienojumu, un minētie savienojumi satur funkcionālas grupas, ko veido divi vai vairāki bloki, kuri ir funkcionāli saistīti pie oligonukleotīda, kurš identificē funkcionālās grupas struktūru apstākļos, kuri piemēroti vismaz viena savienojumu bibliotēkas locekļa piesaistīšanai pie mērķa, kur savienojumu bibliotēka pamatā sastāv no daudziem savienojumiem ar formulu (I):



- kur:  
X ir funkcionāla grupa, kas ietver vienu vai vairākus veidojošus blokus;  
Z ir oligonukleotīds, kas ar savu 3' galu pievienots pie B;  
Y ir oligonukleotīds, kas ar savu 5' galu pievienots pie C;  
A ir funkcionāla grupa, kas veido kovalentu saiti ar X;  
B ir funkcionāla grupa, kas veido saiti ar Z 3' galu;  
C ir funkcionāla grupa, kas veido saiti ar Y 5' galu;  
D, F un E ir katra neatkarīgi bifunkcionāla savienojoša grupa, un  
S ir atoms vai molekulārais režģis, kur Y un Z ir kovalenti saistīti, un  
kur Y un Z viens vai abi satur ierobežojošu sekvenci, un minētā ierobežojošā sekvence satur nukleotīdu sekvenci, kas satur deģenerētus nukleotīdus;  
(b) bibliotēkas locekļu, kuri nepiesaistās pie mērķa, aizvākšana;  
(c) kodēto oligonukleotīdu pavairošana ar vismaz vienu savienojumu bibliotēkas locekli, kas piesaistās pie mērķa;  
(d) etapā (c) kodēto oligonukleotīdu sekvences veidošana, un  
(e) etapā (d) noteikto sekvenču izmantošana, lai noteiktu savienojumu bibliotēkas locekļu funkcionālo grupu struktūru, kuras piesaistās pie bioloģiskā mērķa;

ar to identificējot vienu vai vairākus savienojumus, kuri piesaistās pie bioloģiskā mērķa.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur bibliotēka satur vismaz apmēram  $10^5$  katra dažādā savienojuma kopijas; neobligāti vismaz apmēram  $10^6$  katra dažādā savienojuma kopijas.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur bibliotēka satur vismaz apmēram  $10^4$  dažādus savienojumus vai vismaz apmēram  $10^6$  dažādus savienojumus vai vismaz apmēram  $10^{10}$  dažādus savienojumus vai vismaz apmēram  $10^{12}$  dažādus savienojumus.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur A, B, C, D, E, F un S katram ir tā pati identitāte kā katram formulas I savienojumam.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

A ir aminogrupa,

B ir fosfātgrupa,

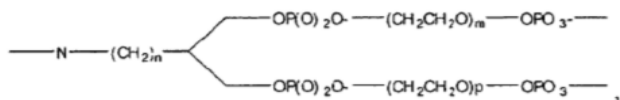
C ir fosfātgrupa.

6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur D, E un F ir neatkarīgi viena no otras alkilēnķēde vai oligo(etilēnglikol)ķēde.

7. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur (i) Y un Z ir būtiski komplementāri un savienojumā orientēti tā, lai varētu ietilpt Vatsona-Kriķa bāzu pārošanā un dubultspirāles veidošanā piemērotos apstākļos, vai (ii) Y un Z ir vienāda garuma vai dažādu garumu, neobligāti kur Y un Z ir vienāda garuma, vai (iii) Y un Z ir katrs 10 vai vairāk bāzu garumā un tiem ir komplementāri reģioni no desmit vai vairāk bāzu pāriem.

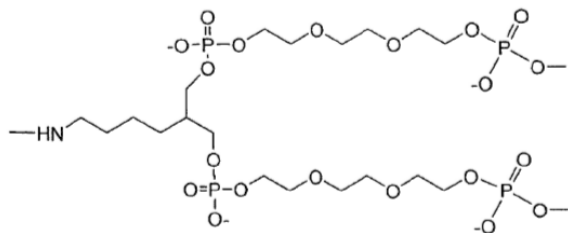
8. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur S ir oglekļa atoms, bora atoms, slāpekļa atoms, fosfora atoms vai daudzatomu režģis, vai daudzatomu režģis, kur S neobligāti ir fosfātgrupa vai cikliska grupa, kur S neobligāti ir cikloalkilgrupa, cikloalkenilgrupa, heterocikloalkilgrupa, heterocikloalkenilgrupa, arilgrupa vai heteroarilgrupa.

9. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojošā grupa ir ar struktūru



kur n, m un p, neatkarīgi viens no otra ir vesels skaitlis no 1 līdz apmēram 20, neobligāti kur n, m un p, neatkarīgi viens no otra ir vesels skaitlis no 2 līdz astoņi, neobligāti kur n, m un p, neatkarīgi viens no otra ir vesels skaitlis no 3 līdz 6.

10. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kur savienojošajai grupai ir struktūra



11. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur X un Z satur PCR praimera sekvenci.

12. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā ierobežojošā sekvence satur sekojošu sekvenci: 3'-AA GTCGCAAGCT NNNNN GTCTGTTCGAAGTGGACG - 5', kur N ir jebkurš no A, T, G vai C.

13. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā ierobežojošā sekvence satur sekojošu sekvenci: 3'- AA GTCGCAAGCTACG ABBBABBABBBA GACTACGGGCTC-CCTCCG - 5', kur B ir jebkurš no T, G vai C.

(51) <b>A61K 9/19</b> <sup>(200601)</sup>	(11) <b>2260835</b>		
<b>A61K 31/336</b> <sup>(200601)</sup>			
<b>A61K 31/396</b> <sup>(200601)</sup>			
<b>A61K 47/40</b> <sup>(200601)</sup>			
<b>A61K 9/00</b> <sup>(200601)</sup>			
(21) 10178998.0	(22) 07.12.2005		
(43) 15.12.2010			
(45) 06.03.2013			
(31) 634366 P	(32) 07.12.2004	(33) US	
655930 P	23.02.2005	US	

(62) EP05853385.2 / EP1819353

(73) Onyx Therapeutics, Inc., 249 East Grand Avenue, South San Francisco, CA 94080, US

(72) LEWIS, Evan R., US

HO, Mark Nguyen, US

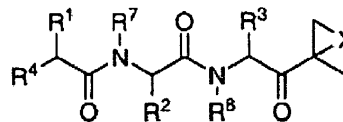
FONSECA, Fabiana N., US

(74) Carlisle, Julie, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB

Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **KOMPOZĪCIJA PROTEASOMAS INHIBĒŠANAI**  
**COMPOSITION FOR PROTEASOME INHIBITION**

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver proteasomas inhibitoru un ciklodekstrīnu, kur proteasomas inhibitors ir attēlots ar struktūrformulu (XIII), vai tā farmaceutiski pieņemams sāls:



(XIII)

kur:

katrs Ar neatkarīgi ir 5 vai 6 locekļu heteroaromātiska grupa, kas neobligāti aizvietota ar 1 līdz 4 aizvietotājiem;

L ir izvēlēts no C=O un SO<sub>2</sub>;

X ir O;

Y ir promesošs;

Z ir promesošs;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> un R<sup>3</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēti no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksialkilgrupas, arilgrupas, C<sub>1-6</sub>aralkilgrupas, heteroarilgrupas, C<sub>1-6</sub>heteroaralkilgrupas, heterociklilgrupas un C<sub>1-6</sub>heterocikloalkilgrupas;

R<sup>4</sup> ir N(R<sup>5</sup>)L-Z-R<sup>6</sup>;

R<sup>5</sup> ir ūdeņraža atoms;

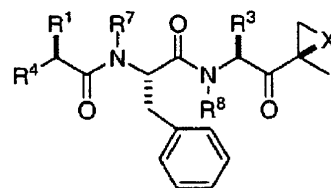
R<sup>6</sup> ir izvēlēts no Ar-Y- un heterociklilgrupas; un

R<sup>7</sup> un R<sup>8</sup> ir ūdeņraža atoms,

kur ciklodekstrīns ir izvēlēts no hidroksipropil-beta-ciklodekstrīna (HPBCD) un beta-ciklodekstrīna sulfobutilētera (SBECD).

2. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>6</sup> ir Ar-Y-.

3. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur proteasomas inhibitors ir attēlots ar struktūrformulu (XV), vai tā farmaceutiski pieņemams sāls:



(XV)

kur:

R<sup>1</sup> un R<sup>3</sup> katrs neatkarīgi ir izvēlēti no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksialkilgrupas, arilgrupas un C<sub>1-6</sub>aralkilgrupas.

4. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas papildus satur bufervielu.

5. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur ciklodekstrīns ir SBECD.

6. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur bufervielu ir nātrija citrāts/citronskābe.

7. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 6. pretenzijai, kura satur 1 līdz 5 mg/ml proteasomas inhibitora, 5 līdz 25 % (masa/tilpums) ciklodekstrīna un 5 līdz 20 mM bufervielas, kas dod pH diapazonā no 3 līdz 6.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai iekaisumu ārstēšanas paņēmienā.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai HIV infekcijas inhibēšanas vai samazināšanas, hroniskas infekcijas slimības ārstēšanas vai vīrusu gēna ekspresijas līmeņa ietekmēšanas paņēmienā pacientam.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai neirodeģeneratīvas slimības, denervācijas vai nerva bojājuma ārstēšanas paņēmienā.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai muskuļu atrofijas slimības ārstēšanas paņēmienā.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai vēža ārstēšanas paņēmienā.

13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai drudža ārstēšanas paņēmienā.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai ar imūnsistēmu saistīta stāvokļa ārstēšanas paņēmienā.

15. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izmantošanai paņēmienā, lai izmainītu proteasomas producēto antigēno peptīdu daudzumu organismā.

- (51) **C10L 3/06**<sup>(200601)</sup> (11) **2261308**  
**C10L 3/08**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 10003727.4 (22) 07.04.2010  
 (43) 15.12.2010  
 (45) 19.06.2013  
 (31) 200900590 (32) 07.05.2009 (33) DK  
 (73) Haldor Topsøe A/S, Nymøllevej 55, 2800 Kgs. Lyngby, DK  
 (72) Wix, Christian, DK  
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **PROCESS DABASGĀZES RAŽOŠANAI**  
**PROCESS FOR THE PRODUCTION OF NATURAL GAS**

(57) 1. Process dabasgāzes aizvietotāja (SNG) ražošanai, veicot sintēzes gāzes, kas iegūta no oglekli saturoša materiāla gazifikācijas, metanizāciju, pie kam process satur šādus posmus:

(a) oglekli saturošu materiālu pakļauj gazifikācijas posmam un atdala gāzi, kas satur oglekļa monoksīdu, oglekļa dioksīdu un ūdeņradi;

(b) vismaz daļu no gazifikācijas posmā iegūtās gāzes pakļauj ūdens gāzes iegūšanas posmam un atdala ar ūdeņradi bagātinātu gāzi;

(c) posmā (b) iegūto gāzi pakļauj skābas gāzes atdalīšanas posmam, atdalot oglekļa dioksīda plūsmu un atdalot sintēzes gāzes plūsmu, kura satur ūdeņradi, oglekļa dioksīdu un oglekļa monoksīdu un kuras molārā attiecība  $M=(H_2-CO_2)/(CO+CO_2)$  ir lielāka par 3,00 un mazāka par 3,30;

(d) posmā (c) atdalīto sintēzes gāzi ievada metanizācijas iekārtā, kas satur vismaz vienu metanizācijas reaktoru, un no metanizācijas iekārtas atdala metānu saturošu gāzes produktu;

(e) posmā (d) metanizācijas iekārtā ievada plūsmu ar molāro attiecību  $M=(H_2-CO_2)/(CO+CO_2)$ , mazāku par 3,00, kas ir izvēlēta no posmā (a) atdalītās gāzes plūsmas, posmā (b) atdalītās gāzes plūsmas, plūsmas, kas vismaz daļēji ir iegūta no posmā (c) atdalītā oglekļa dioksīda plūsmas, atsevišķas plūsmas, kas satur vismaz 80 tilpuma %  $CO_2$ , un to kombinācijām.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam plūsma ar molāro attiecību  $M=(H_2-CO_2)/(CO+CO_2)$ , zemāku par 3,00, ir pilnā posmā (c) atdalītā oglekļa dioksīda plūsma.

3. Process saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam plūsmu ar molāro attiecību  $M=(H_2-CO_2)/(CO+CO_2)$ , zemāku par 3,00, pakļauj desulfurizācijai pirms plūsmas ievades metanizācijas iekārtā.

4. Process saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam sintēzes gāzi posmā (d) metanizācijas iekārtā ievada vismaz divos metanizācijas reaktoros, kas satur metanizācijā aktīvu katalizatoru.

5. Process saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam posmā (c) iegūto sintēzes gāzi samaisa ar tvaiku un pēc tam ievada pirmajā un otrajā metanizācijas reaktorā, daļu no sintēzes gāzes samaisot ar recirkulācijas plūsmu, ko iegūst no pirmā metanizācijas reaktora izejošās plūsmas, līdz ar to izejvielu gāzi ievadot pirmajā metanizācijas reaktorā un samaisot citu daļu no minētās sintēzes gāzes ar daļu no pirmā metanizācijas reaktora izejošās plūsmas, līdz ar to pievadot izejvielu gāzi otrajā metanizācijas reaktorā, pie tam otrā un tam sekojošo metanizācijas reaktoru izejošās plūsmas tiek ievadītas katrā nākamajā metanizācijas reaktorā to secīgā izkārtojumā.

6. Process saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, pie kam recirkulācijas plūsmu iegūst no pēdējā metanizācijas reaktora un šo recirkulācijas plūsmu samaisa ar izejošo plūsmu, kas tiek ievadīta minētajā pēdējā metanizācijas reaktorā.

7. Process saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam plūsmu, kuru pievada metanizācijas iekārtā un kuras molārā attiecība  $(H_2-CO_2)/(CO+CO_2)$  ir mazāka par 3,00, savieno ar minētā pēdējā metanizācijas reaktora recirkulācijas plūsmu.

8. Process saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam oglekli saturošo materiālu izvēlas no rindas, kas sastāv no oglēm, naftas koka, biomasas, naftas, melnā sārma, dzīvnieku taukiem un to kombinācijām.

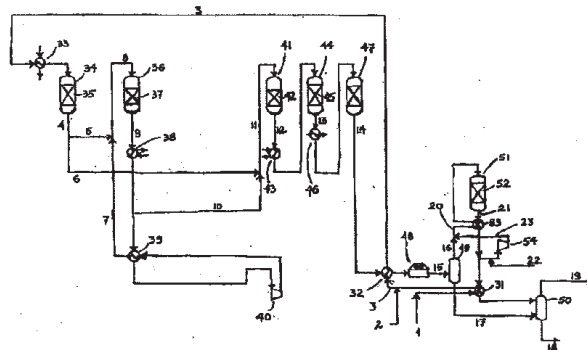


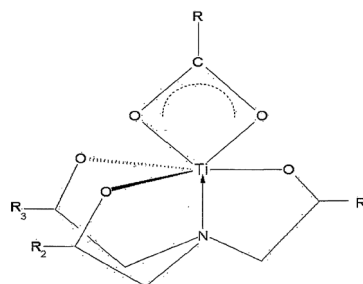
FIG. 3

- (51) **C08G 63/85**<sup>(200601)</sup> (11) **2262846**  
 (21) 09724960.1 (22) 23.03.2009  
 (43) 22.12.2010  
 (45) 15.05.2013  
 (31) 72230 P (32) 28.03.2008 (33) US  
 (86) PCT/IB2009/000574 23.03.2009  
 (87) WO2009/118600 01.10.2009  
 (73) Equipolymers GmbH, Berthastrasse 13, 06258 Schkopau, DE

- (72) WIEGNER, Jens-Peter, DE  
 VOERCKEL, Volkmar, DE  
 RUNKEL, Dietmar, DE  
 ECKERT, Rolf, DE  
 (74) Polypatent, An den Gärten 7, 51491 Overath, DE  
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **JAUNS TITĀNU SATUROŠS KATALIZATORS AR IZCILU AKTIVITĀTI UN SELEKTIVITĀTI POLIKONDENSĀCIJAS REAKCIJĀS**  
**A NEW TITANIUM-BASED CATALYST SHOWING EXCELLENT ACTIVITY AND SELECTIVITY IN POLYCONDENSATION REACTIONS**

(57) 1. Titāna atrānu saturošs katalizators izmantošanai aciklisko esteri polikondensācijā



kur R ir H, (C<sub>1</sub>-C<sub>26</sub>)alkilgrupa, arilgrupa vai hetarilgrupa; R<sup>1</sup> ir H vai metilgrupa, vai etilgrupa, vai etenilarilgrupa, vai hetarilgrupa; R<sup>2</sup> ir H vai metilgrupa, vai etilgrupa, vai etenilarilgrupa, vai hetarilgrupa un R<sup>3</sup> ir H vai metilgrupa, vai etilgrupa, vai etenilarilgrupa, vai hetarilgrupa.

2. Paņēmieni titāna atrāna katalizatora iegūšanai, kas satur: (a) šķīduma, kas satur titāna (IV) alkoksīda savienojumu un pirmo šķīdinātāju, kontaktēšanu ar organisku skābi;



(b) (a) solī iegūtā šķīduma kontaktēšanu ar aizvietotu vai neaizvietotu trialkanolamīnu, lai iegūtu neattīrītu katalizatoru; un  
(c) neattīrītā katalizatora attīrīšanu, lai iegūtu titāna atrāna katalizatoru.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, kur titāna (IV) alkoksīda savienojums ir titāna n-butilāts, titāna izopropilāts, titāna n-propilāts, titāna t-butilāts vai titāna etilāts.

4. Paņēmiens saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kurā pirmais šķīdinātājs ir pirmējais spirts, otrējais spirts vai trešējais spirts.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 4. pretenzijai, kurā organiskā skābe ir karbonskābe.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kurā organiskā skābe ir etiķskābe vai propionskābe.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai, kurā trialkanolamīns ir trietanolamīns, triizopropanolamīns vai aizvietots trietanolamīns.

8. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, kurā (c) solis papildus satur:

c1) pirmā šķīdinātāja iztvaicēšanu no neattīrītā katalizatora, lai aizvāktu nevēlamos blakusproduktus;

c2) (c1) solī iegūtā produkta kontaktēšanu ar otro šķīdinātāju, lai iegūtu suspendētas cietas daļiņas; un

c3) suspendēto cieto daļiņu vārišanu, lai iegūtu attīrītu titāna atrāna katalizatoru.

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kurā (c2) soļa otrais šķīdinātājs ir izvēlēts no šādās virknes: toluols, alkilaizvietoti aromātiskie savienojumi un garās ķēdes alkāni.

- (51) **C08K 3/34<sup>(200601)</sup>** (11) **2264092**  
**C08K 7/00<sup>(200601)</sup>**  
**C08L 95/00<sup>(200601)</sup>**  
(21) 10165657.7 (22) 11.06.2010  
(43) 22.12.2010  
(45) 24.10.2012  
(31) MI20091062 (32) 16.06.2009 (33) IT  
(73) Polyglass S.p.A., Viale Edoardo Jenner, 4, 20159 Milano, IT  
(72) DRIGO, Michele, IT  
PASCONE, Daniele, IT  
ZAFFARONI, Pasquale, 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) **UZ BITUMENA, KAS MODIFICĒTS AR ALUMĪNIJA SILIKĀTU CENOSFĒRAS SATUROŠIEM POLIMĒRIEM, BĀZĒTA ŪDENSNECAURLAIDĪGA MEMBRĀNA WATERPROOFING MEMBRANES BASED ON BITUMEN MODIFIED WITH POLYMERS CONTAINING ALUMINIUM SILICATE CENOSPHERES**  
(57) 1. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas, kas satur pastipriņošu materiālu, kurā impregnēts bitumena maisījums, kas satur industriālo bitumenu, minerālpildvielu, termoplastisko polimēru vai termoplastisko polimēru maisījumu, raksturīgas ar to, ka minerālpildviela satur alumīnija silikātu cenosfēru veidā, kuru blīvums ir robežās no 0,6 līdz 0,85 g/cm<sup>3</sup> un izmērs ir robežās no 5 līdz 300 μm, ieteicamās robežas ir no 5 līdz 106 μm.  
2. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar 1. pretenziju, kur termoplastiskais polimērs ir izvēlēts no sekojošiem materiāliem: zema blīvuma polietilēns, augsta blīvuma polietilēns, izotaktiskais polipropilēns, etilēna/propilēna kopolimērs, etilēna/propilēna/butēna terpolimērs, ataktiskais polipropilēns un stīrolbutadiēna-stīrola blokkopolimērs.  
3. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurās industriālā bitumena daudzums ir robežās no 75 līdz 85 masas procentiem.  
4. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurās termoplastiskā polimēra vai polimēru daudzums ir robežās no 10 līdz 18 %.  
5. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurās minerālpildvielas daudzums ir robežās no 2 līdz 10 masas procentiem, un ieteicamais daudzums ir robežās no 3 līdz 6 masas procentiem.

6. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgas ar to, ka to īpatnējais svars ir mazāks par 1 g/cm<sup>3</sup>.

7. Paņēmiens dažādu kategoriju ūdensnecaurlaidīgu membrānu iegūšanai, kur membrānas kategoriju nosaka lieces vērtības, kas mērītas saskaņā ar standartu EN 1109, 0-25°C temperatūrā, paņēmiens ietver pastipriņošā materiāla ar bitumena sastāvu, kas satur industriālo bitumenu, minerālpildvielu ar alumīnija silikāta cenosfērām, kuru blīvums ir robežās no 0,6 līdz 0,85 g/cm<sup>3</sup> un to izmērs ir robežās no 5 līdz 300 μm, ieteicams, robežās no 5 līdz 106 μm, un termoplastisko polimēru vai termoplastisko polimēru maisījumu, impregnēšanu.

8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, kur pastipriņošais materiāls ir neausts poliesteris.

9. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas, kas iegūstamas atbilstoši 8. pretenzijā minētajam paņēmienam.

- (51) **C08K 7/00<sup>(200601)</sup>** (11) **2264094**  
**C08L 95/00<sup>(200601)</sup>**  
**C08K 7/28<sup>(200601)</sup>**  
(21) 10165659.3 (22) 11.06.2010  
(43) 22.12.2010  
(45) 24.10.2012  
(31) MI20091063 (32) 16.06.2009 (33) IT  
(73) Polyglass S.p.A., Viale Edoardo Jenner, 4, 20159 Milano, IT  
(72) DRIGO, Michele, IT  
PASCONE, Daniele, 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) **UZ BITUMENA BĀZĒTA ŪDENSNECAURLAIDĪGA MEMBRĀNA, KAS MODIFICĒTA AR POLIMĒRIEM, KURI SATUR DOBAS STIKLA MIKROSFĒRAS WATERPROOFING MEMBRANE BASED ON BITUMEN MODIFIED WITH POLYMERS CONTAINING HOLLOW GLASS MICROSPHERES**  
(57) 1. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas, kas satur rūdītu materiālu, kurš impregnēts ar bitumena sastāvu, kas satur industriālo bitumenu, minerālpildvielu, termoplastisko polimēru vai termoplastisko polimēru maisījumu, kas raksturīgas ar to, ka minerālpildviela satur doba stikla mikrosfēras ar blīvumu robežās no 0,10 līdz 0,14 g/cm<sup>3</sup> un to izmērs ir mazāks par 120 μm.  
2. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar 1. pretenziju, kurās termoplastiskais polimērs ir izvēlēts no grupas: zema blīvuma polietilēns, augsta blīvuma polietilēns, izotaktiskais polipropilēns, etilēna/propilēna kopolimērs, etilēna/propilēna/butēna terpolimērs, ataktiskais polipropilēns un stīrola-butadiēna-stīrola blokkopolimērs.  
3. Ūdensnecaurlaidīgas membrānas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurās industriālā bitumena daudzums ir robežās no 70 līdz 80 % pēc masas.  
4. Ūdensnecaurlaidīgās membrānas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurās termoplastiskā polimēra vai polimēru daudzums ir robežās no 15 līdz 25 % pēc masas.  
5. Ūdensnecaurlaidīgās membrānas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurās minerālpildvielas daudzums ir robežās no 2 līdz 7 % pēc masas, un ieteicams daudzums ir robežās no 3 līdz 5 % pēc masas.  
6. Ūdensnecaurlaidīgās membrānas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgas ar īpatnējo svaru zem 1 g/cm<sup>3</sup>.  
7. Paņēmiens dažādu kategoriju ūdensnecaurlaidīgu membrānu iegūšanai, kuras iedala pēc aukstās lieces izturības vērtībām, kas mērītas saskaņā ar standartu EN 1109, 0-25°C temperatūrā, kas ietver rūdītā materiāla impregnēšanu ar bitumena sastāvu, kas satur industriālo bitumenu, minerālpildvielu ar doba stikla mikrosfērām un blīvumu robežās no 0,10 līdz 0,14 g/cm<sup>3</sup> un izmēru, kas mazāks par 120 μm, un termoplastisko polimēru vai termoplastisko polimēru maisījumu.  
8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, kurā rūdītais materiāls ir neausts poliesteris.  
9. Ūdensnecaurlaidīgās membrānas, kas iegūstamas ar paņēmieni, kurš ir saskaņā ar 8. pretenziju.

- (51) **F16H 33/10**<sup>(200601)</sup> (11) **2265843**  
 (21) 08735274.6 (22) 17.04.2008  
 (43) 29.12.2010  
 (45) 17.04.2013  
 (86) PCT/EP2008/003028 17.04.2008  
 (87) WO2009/127228 22.10.2009  
 (73) Erke Erke Arastirmalari Ve Mühendislik A.S., Halkali Merkez Mah. Basin Ekspres Yolu No. 5/A, 34303 Kucukcekmece/Istanbul, TR  
 (72) OZTÜRK, Mustafa, Naci, TR  
 (74) Köhler, Walter, Louis, Pöhlau, Lohrentz, Patentanwälte, P.O. Box 30 55, 90014 Nürnberg, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **PIEDZIŅAS IERĪCE UN PAŅĒMIENS ROTĀCIJAS KUSTĪBAS RADĪŠANAI**  
**GEAR DEVICE AND METHOD FOR PROVIDING A ROTARY MOTION**

(57) 1. A) Piedziņas ierīce, vēlams motors, rotācijas radīšanai ap vismaz vienu izejas asi, pie kam minētā ierīce satur:

B) ķermeni (2), kas iestiprināts tā, ka var griezties ap pirmo asi (4), griezties ap otro asi (11) un griezties ap trešo asi (16), turklāt pirmā ass (4) attiecībā pret otro asi (11) ir orientēta slīpuma leņķī ( $\theta$ ), otrā ass (11) un/vai trešā ass (16) veido vismaz vienu minētās ierīces izejas asi, un ķermeņa (2) griešana ap trešo asi (16) izsauc slīpuma leņķa ( $\theta$ ) izmaiņu,

C) līdzekļus (15) griezes momenta (21) pielikšanai ķermenim (2) ap trešo asi (16) slīpuma leņķī ( $\theta$ ) palielinošā griešanas virzienā, kad pirmā ass (4) attiecībā pret otro asi (11) atrodas izvēlēta slīpuma leņķī ( $\theta$ ), kurš ir lielāks par 0 grādiem un mazāks par 90 grādiem, un

D) līdzekļus (210) ķermeņa (2) griešanās ap trešo asi (16) ierobežošanai slīpuma leņķī ( $\theta$ ) samazinošā griešanas virzienā tā, ka pirmās ass (4) slīpuma leņķis ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11) paliek lielāks par 0 grādiem un mazāks par 90 grādiem, pie tam:

E) minētā ierīce ir strukturēta tā, ka ir iespējams piedziņas spēka avotu savienot ar ķermeni (2), lai izraisītu ķermeņa (2) griešanos ap pirmo asi (4), un

F) ķermeņa (2) griešanās ap pirmo asi (4) notiek ar leņķisko ātrumu ( $\omega_{\text{spin}}$ ), kas ir lielāks par kritisko leņķisko ātrumu ( $\omega_c$ ), pie kam tiek sasniegti konstants vai dilstošs slīpuma leņķis ( $\theta$ ), tādējādi izraisot vai palielinot izejas leņķisko ātrumu ( $\omega_{\text{out}}$ ) un/vai ķermeņa (2) griešanās izejas griezes momentu ap otro asi (11) un/vai ap trešo asi (16), kas iepriekš minēta kā vismaz viena izejas ass,

G) ķermenim (2) ir specifisks kritiskais leņķiskais ātrums ( $\omega_{c, \text{spec}}$ ), kas mazāks par 20000 apgriezieniem minūtē, vēlams tādējādi palielinot izejas jaudu ap vismaz vienu izejas asi, turklāt minētais specifiskais kritiskais ķermeņa (2) leņķiskais ātrums ( $\omega_{c, \text{spec}}$ ) ir kritiskais leņķiskais ātrums ( $\omega_c$ ):

kad pirmās ass (4) slīpuma leņķis ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11) ir 45 grādi,

kad pirmā ass (4) būtībā iet caur ķermeņa (2) masas centru (CM), kad ķermenis (2) ir orientēts tā, ka ķermeņa (2) inerces moments būtībā ir maksimāls,

kad, ja ķermenis (2) nav novietots simetriski ap plakni, kas iet caur ķermeņa (2) masas centru (CM) un kas ir ortogonāla pret pirmo asi (4), no iespējamajiem montāžas stāvokļiem ķermeņa (2) piestiprināšanai pie pirmās ass (4) tiek izvēlēts tāds stāvoklis, kurš rezultātā dod mazāko attālumu starp ķermeņa (2) masas centru (CM) un trešo asi (16), un

kad savienošanas sviras garums ( $l_c$ ) ir: 5 mm, ja ķermeņa (2) masa ir mazāka par 0,1 kg; 25 mm, ja ķermeņa (2) masa ir vienāda ar vai lielāka par 0,1 kg un mazāka par 100 kg; 50 mm, ja ķermeņa (2) masa ir vienāda ar vai lielāka par 100 kg un mazāka par 1000 kg; 100 mm, ja ķermeņa (2) masa ir vienāda ar vai lielāka par 1000 kg,

turklāt minētais savienošanas sviras garums ( $l_c$ ) ir attālums no savienošanas plaknes ( $P_c$ ) un pirmās ass (4) krustpunkta līdz trešajai asij (16), un minētā savienošanas plakne ( $P_c$ ) ir plakne, kura ir ortogonāla pret pirmo asi (4) un šķēļ ķermeni (2) un kurai ir mazākais attālums līdz slīpuma asij (16).

2. Ierīce atbilstoši 1. pretenzijai, kas papildus satur piedziņas spēka avotu, kurš ir savienots ar ķermeni (2), lai liktu ķermenim (2) griezties ap pirmo asi (4) ar minēto leņķisko ātrumu ( $\omega_{\text{spin}}$ ), kas ir lielāks par minēto kritisko leņķisko ātrumu ( $\omega_c$ ).

3. Ierīce atbilstoši 2. pretenzijai, kas papildus satur atgriezeniskās saites līdzekļus (17, 18, 19, 20), lai pārnestu piedziņas spēku no ķermeņa (2) griešanās ap vismaz vienu izejas asi uz piedziņas spēka avotu.

4. Ierīce atbilstoši 3. pretenzijai, turklāt atgriezeniskās saites līdzekļi (17, 18, 19, 20) ir ierīkoti tā, lai pietiekoši daudz piedziņas spēka pārnestu uz piedziņas spēka avotu nolūkā pārvarēt enerģijas zudumus, kas rodas berzes dēļ, ķermenim (2) griežoties ap pirmo asi (4), kad slīpuma leņķis ( $\theta$ ), trešajai asij (16) pieliktā griezes momenta lielums un izejas leņķiskais ātrums ( $\omega_{\text{out}}$ ) ap vismaz vienu izejas asi ir nemainīgs.

5. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur līdzekļus piedziņas spēka avota vadīšanai, lai liktu ķermenim (2) griezties ap pirmo asi (4) ar minēto leņķisko ātrumu ( $\omega_{\text{spin}}$ ), kas ir lielāks par minēto kritisko leņķisko ātrumu ( $\omega_c$ ).

6. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ir ierīkoti griezes momenta pielikšanas līdzekļi (15), lai pieliktu griezes momentu (21) ķermenim (2) ap trešo asi (16), kad izvēlētais slīpuma leņķis ( $\theta$ ) ir lielāks par 10 grādiem un mazāks par 80 grādiem.

7. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur līdzekļus pieliktā griezes momenta (21) lieluma vadīšanai ar griezes momenta pielikšanas līdzekļu (15) palīdzību.

8. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ir ierīkoti ierobežošanas līdzekļi (210), lai ierobežotu ķermeņa (2) griešanos ap trešo asi (16) tā, ka pirmās ass (4) slīpuma leņķis ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11) ir lielāks par 10 grādiem un mazāks par 80 grādiem.

9. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur līdzekļus slīpuma leņķa ( $\theta$ ) regulēšanai.

10. Ierīce atbilstoši 9. pretenzijai, kas papildus satur līdzekļus, lai izvēlētos vēlamo izejas leņķisko ātrumu ( $\omega_{\text{out}}$ ) ap vismaz vienu izejas asi un liktu regulēšanas līdzekļiem regulēt slīpuma leņķi ( $\theta$ ) atkarībā no izvēlēta izejas leņķiskā ātruma ( $\omega_{\text{out}}$ ).

11. Ierīce atbilstoši 9. vai 10. pretenzijai, kas papildus satur līdzekļus, lai izvēlētos vēlamo ierīces izejas griezes momentu un regulētu slīpuma leņķi ( $\theta$ ) atkarībā no izvēlēta izejas griezes momenta.

12. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt līdzekļi (15) griezes momenta (21) pielikšanai pie trešās ass (16) satur atspēri.

13. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt līdzekļi (15) griezes momenta (21) pielikšanai pie trešās ass (16) satur vienu vai vairākus virzuļus, tādus kā hidraulisks virzulis, pneimatiskais virzulis, elektromagnētiskais virzulis.

14. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ierobežošanas līdzekļi (210) ir izveidoti tā, lai novērstu jebkādu ķermeņa (2) griešanos ap trešo asi (16) slīpuma leņķa ( $\theta$ ) samazināšanās virzienā.

15. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt līdzekļi (15) griezes momenta (21) pielikšanai pie trešās ass (16) papildus kalpo kā ierobežošanas līdzekļi (210).

16. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ierobežošanas līdzekļi (210) satur attūri.

17. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt pirmā ass (4) būtībā iet caur ķermeņa (2) masas centru (CM).

18. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt otrā ass (11) būtībā iet caur ķermeņa (2) masas centru (CM).

19. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt pirmā ass (4) un otrā ass (11) krustojas.

20. Ierīce atbilstoši jebkurai no 1. līdz 18. pretenzijai, turklāt pirmā ass (4) un otrā ass (11) nekrustojas un slīpuma leņķis ( $\theta$ ) tiek definēts kā šaurais leņķis starp pirmo asi (4) un otro asi (11), skatoties tsākās līnijas virzienā, kura savieno pirmo asi (4) un otro asi (11).

21. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ķermenim (2) piemīt būtībā cilindriska simetrija attiecībā pret pirmo asi (4).

22. Ierīce atbilstoši jebkurai no 1. līdz 21. pretenzijai, turklāt ķermenim (2) satur rumbu, kloķa disku un gredzenveidīgu rumbas slīpu.

23. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ķermenim (2) ir izgatavots no materiāla, kura elastības modulis ir lielāks par 70 GPa, vēlams lielāks par 100 GPa.

24. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur līdzekļus minētās ierīces piestiprināšanai.

25. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur vienu vai vairākas balansēšanas masas, kas piestiprinātas tā, lai grieztos ap otro asi.

26. Ierīce atbilstoši 1. pretenzijas sadaļām no A) līdz F), vēlams atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt leņķis starp pie ķermeņa (2) ap trešo asi (16) pieliktā griezes momenta (21) vektoru un izejas leņķiskā ātruma ( $\omega_{out}$ ) ap otro asi (11) vektoru ir robežās no 85 līdz 93 grādiem, vēlams tuvu 90 grādiem.

27. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ķermenis (2) ir uzmontēts uz vārpstas (3, 30), kas izgatavota no materiāla, kura elastības modulis ir lielāks par 70 GPa, vēlams lielāks par 100 GPa.

28. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt izejas vārpsta (11) vismaz vienas izejas ass visā garumā ir izgatavota no materiāla ar elastības moduli, kas lielāks par 70 GPa, vēlams lielāks par 100 GPa.

29. Ierīce atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, turklāt ierīces daļas, uz kurām iedarbojas mainīgi spēki, ir izgatavotas no viena vai vairākiem materiāliem ar elastības moduli, kas lielāks par 70 GPa, vēlams lielāks par 100 GPa.

30. Ierīce atbilstoši 1. pretenzijas sadaļām no A) līdz F), vēlams atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kura papildus satur vienu vai vairākus sensorus, lai izmērītu vērtības vienam vai vairākiem šādiem parametriem: pagrieziena leņķim ap pirmo asi (4) un/vai ap otro asi (11), un/vai ap trešo asi (16); griešanās leņķiskajam ātrumam ap pirmo asi (4) un/vai ap otro asi (11), un/vai ap trešo asi (16); ķermeņa (2) un/vai pirmās ass (4), un/vai otrās ass (11), un/vai trešās ass (16) pozīcijai; griešanās ap pirmo asi (4) un/vai ap otro asi (11), un/vai ap trešo asi (16) griezes momentam, spēkam.

31. Ierīce atbilstoši 1. pretenzijas sadaļām no A) līdz F), vēlams atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kura papildus satur līdzekļus ķermeņa (2) griešanās mehāniskai ierobežošanai ap slīpuma asi (16) abos griešanās virzienos starp leņķa apakšējo robežvērtību un leņķa augšējo robežvērtību un līdzekļus šo leņķa robežvērtību regulēšanai minētās ierīces darbības laikā tā, ka tās ir vienādas ar leņķa izvēlēto apakšējo robežvērtību, kas lielāka par 0 grādiem un mazāka par 90 grādiem, un leņķa augšējo robežvērtību, kas lielāka par leņķa apakšējo izvēlēto robežvērtību un mazāka par 90 grādiem.

32. Ierīce atbilstoši 31. pretenzijai, turklāt līdzekļi ķermeņa (2) griešanās mehāniskai ierobežošanai ir viens vai vairāki atturi.

33. Mezgls, kas sastāv no divām vai vairākām piedziņas ierīcēm, vēlams motoriem, katru no kurām satur jebkurai no iepriekšējām pretenzijām atbilstošu ierīci kombinācijā ar līdzekļiem, kas izraisa katras no minētajām ierīcēm griešanos ar būtībā vienādu griešanās ātrumu, bet atšķirīgiem attiecīgajiem fāzes leņķiem, un ar līdzekļiem minēto ierīču izejas leņķisko ātrumu ( $\omega_{out}$ ) un/vai izejas griezes momentu kombinēšanai.

34. Transportlīdzeklis, kuru piedzen vienai no 1. līdz 32. pretenzijai atbilstoša ierīce vai 33. pretenzijai atbilstošs mezgls.

35. Transportlīdzeklis atbilstoši 34. pretenzijai ceļa transportlīdzekļa veidā.

36. Transportlīdzeklis atbilstoši 34. pretenzijai lidaparāta veidā.

37. Transportlīdzeklis atbilstoši 34. pretenzijai ūdens transportlīdzekļa veidā.

38. Elektroģenerators, kas satur jebkurai no 1. līdz 32. pretenzijai atbilstošu ierīci vai 33. pretenzijai atbilstošu mezglu.

39. a) Paņēmiens griezes kustības radīšanai ap vismaz vienu izejas asi, turklāt šis paņēmiens satur:

b) ķermeņa (2) montāžu, lai tas grieztos ap pirmo asi (4), grieztos ap otro asi (11) un grieztos ap trešo asi (16), turklāt pirmā ass (4) attiecībā pret otro asi (11) ir orientēta slīpuma leņķī ( $\theta$ ), otrā ass (11) un/vai trešā ass (16) veido vismaz vienu izejas asi, un ķermeņa (2) griešana ap trešo asi (16) izsauc slīpuma leņķa ( $\theta$ ) izmaiņu,

c) ķermeņa (2) griešanu ap pirmo asi (4) ar leņķisko ātrumu ( $\omega_{spin}$ ), kas ir lielāks par kritisko leņķisko ātrumu ( $\omega_c$ ),

d) griezes momenta (21) pielikšanu ķermenim (2) ap trešo asi (16) slīpuma leņķa ( $\theta$ ) palielināšanas virzienā, kad pirmā ass (4) atrodas izvēlēta slīpuma leņķī ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11), kurš ir lielāks par 0 grādiem un mazāks par 90 grādiem, un

e) ķermeņa (2) griešanās ap trešo asi (16) ierobežošanu slīpuma leņķa ( $\theta$ ) samazināšanas virzienā tā, ka pirmās ass (4) slīpuma leņķis ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11) paliek lielāks par 0 grādiem un mazāks par 90 grādiem,

f) konstanta vai dilstoša slīpuma leņķis ( $\theta$ ) sasniegšanu, lai tādējādi izraisītu vai palielinātu izejas leņķisko ātrumu ( $\omega_{out}$ ) un/vai ķermeņa (2) griešanās izejas griezes momentu ap otro asi (11) un/vai ap trešo asi (16), kas iepriekš minēta kā vismaz viena izejas ass;

g) turklāt paņēmiens papildus satur ķermeņa (2) izmantošanu ar specifisku kritisko leņķisko ātrumu ( $\omega_{c, spec}$ ), kas mazāks par 20000 apgriezieniem minūtē, lai, vēlams, tādējādi palielinātu izejas jaudu ap vismaz vienu izejas asi, turklāt minētais specifiskais kritiskais leņķiskais ātrums ( $\omega_{c, spec}$ ) ir ķermeņa (2) kritiskais leņķiskais ātrums ( $\omega_c$ ):

kad pirmās ass (4) slīpuma leņķis ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11) ir 45 grādi,

kad pirmā ass (4) būtībā iet caur ķermeņa (2) masas centru (CM), kad ķermenis (2) ir orientēts tā, ka ķermeņa (2) inerces moments būtībā ir maksimāls,

kad, ja ķermenis (2) nav novietots simetriski ap plakni, kas iet caur ķermeņa (2) masas centru (CM) un kas ir ortogonāla pret pirmo asi (4), no iespējamajiem montāžas stāvokļiem ķermeņa (2) piestiprināšanai pie pirmās ass (4) tiek izvēlēts tāds, kurš rezultātā dod mazāko attālumu starp ķermeņa (2) masas centru (CM) un trešo asi (16),

kad savienošanas sviras garums ( $l_c$ ) ir: a) 5 mm, ja ķermeņa (2) masa ir mazāka par 0,1 kg, b) 25 mm, ja ķermeņa (2) masa ir vienāda ar vai lielāka par 0,1 kg un mazāka par 100 kg, c) 50 mm, ja ķermeņa (2) masa ir vienāda ar vai lielāka par 100 kg un mazāka par 1000 kg, d) 100 mm, ja ķermeņa (2) masa ir vienāda ar vai lielāka par 1000 kg;

turklāt minētais savienošanas sviras garums ( $l_c$ ) ir attālums no savienošanas plaknes ( $P_c$ ) un pirmās ass (4) krustpunkta līdz trešajai asij (16), un minētā savienošanas plakne ( $P_c$ ) ir plakne, kas ir ortogonāla pret pirmo asi (4) un šķēļ ķermeni (2) un kurai ir mazākais attālums līdz slīpuma asij (16).

40. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijai, kas papildus satur papildu ārēja griezes momenta pielikšanu ķermenim (2) ap otro asi, lai radītu sākuma paātrinājumu.

41. Paņēmiens atbilstoši 39. vai 40. pretenzijai, kas papildus satur piedziņas spēka avota vadīšanu, lai liktu ķermenim (2) griezties ap pirmo asi (4) ar minēto leņķisko ātrumu ( $\omega_{spin}$ ), kas lielāks par kritisko leņķisko ātrumu ( $\omega_c$ ).

42. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 41. pretenzijai, kas papildus satur tāda izvēlēta slīpuma leņķa ( $\theta$ ) izvēlēšanas, kas lielāks par 10 grādiem un mazāks par 80 grādiem.

43. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 42. pretenzijai, kas papildus satur ķermenim (2) ap trešo asi (16) pieliktā griezes momenta (21) lieluma vadīšanu.

44. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 43. pretenzijai, kas papildus satur ķermeņa (2) griešanās ap trešo asi (16) ierobežošanu tā, ka pirmās ass (4) slīpuma leņķis ( $\theta$ ) attiecībā pret otro asi (11) ir lielāks par 10 grādiem un mazāks par 80 grādiem.

45. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 44. pretenzijai, kas papildus satur slīpuma leņķa ( $\theta$ ) regulēšanu.

46. Paņēmiens atbilstoši 45. pretenzijai, kas papildus satur vēlamā izejas leņķiskā ātruma ( $\omega_{out}$ ) ap vismaz vienu izejas asi radīšanu ar slīpuma leņķa ( $\theta$ ) regulēšanas palīdzību.

47. Paņēmiens atbilstoši 45. pretenzijai, kas papildus satur vēlamā griezes momenta ap vismaz vienu izejas asi radīšanu ar slīpuma leņķa ( $\theta$ ) regulēšanas palīdzību.

48. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 47. pretenzijai, kas papildus satur ķermeņa (2) leņķiskā ātruma ( $\omega_{spin}$ ) ap pirmo asi (4) regulēšanu.

49. Paņēmiens atbilstoši 48. pretenzijai, kas papildus satur vēlamā izejas leņķiskā ātruma ( $\omega_{out}$ ) ap vismaz vienu izejas asi radīšanu ar ķermeņa (2) leņķiskā ātruma ( $\omega_{spin}$ ) ap pirmo asi (4) regulēšanas palīdzību.

50. Paņēmiens atbilstoši 48. pretenzijai, kas papildus satur vēlamā izejas griezes momenta ap vismaz vienu izejas asi radīšanu ar ķermeņa (2) leņķiskā ātruma ( $\omega_{spin}$ ) ap pirmo asi (4) regulēšanas palīdzību.



51. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 50. pretenzijai, kas papildus satur ķermeņim (2) ap trešo asi (16) pieliktā griezes momenta (21) regulēšanu.

52. Paņēmiens atbilstoši 51. pretenzijai, kas papildus satur vēlamā izejas leņķiskā ātruma ( $\omega_{out}$ ) ap vismaz vienu izejas asi radīšanu ar pie ķermeņa (2) ap trešo asi (16) pieliktā griezes momenta (21) regulēšanas palīdzību.

53. Paņēmiens atbilstoši 51. pretenzijai, kas papildus satur vēlamā izejas griezes momenta ap vismaz vienu izejas asi radīšanu ar pie ķermeņa (2) ap trešo asi (16) pieliktā griezes momenta regulēšanas palīdzību.

54. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 53. pretenzijai, pie kam ķermeņa (2) griešanas ap trešo asi (16) ierobežošana papildus satur jebkādas ķermeņa (2) griešanās novēršanu ap trešo asi (16) slīpuma leņķa ( $\theta$ ) samazināšanās virzienā.

55. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 39. līdz 54. pretenzijai, kas papildus satur daļas no griezes enerģijas, kas tiek pievadīta vismaz vienai izejas asij, izmantošanu, lai veiktu ķermeņa (2) griešanu ap pirmo asi (4), kad slīpuma leņķis ( $\theta$ ), pieliktā griezes momenta (21) ap trešo asi (16) lielums un izejas leņķiskais ātrums ( $\omega_{out}$ ) ap vismaz vienu izejas asi ir konstants.

56. Paņēmiens atbilstoši 55. pretenzijai, pie kam tādā veidā izlietotās griezes enerģijas daudzums ir pietiekams, lai kompensētu enerģijas zudumus, kas rodas no berzes, ķermeņim (2) griežoties ap pirmo asi (4).

57. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 56. pretenzijai, kurš papildus satur griezes momenta (21) pielikšanu ķermeņim (2) ap trešo asi (16), pieliekot griezes momentu tikai ar ķermeņa (2) svāra palīdzību vai pieliekot griezes momentu ar ārēju līdzekļu palīdzību un papildus ar ķermeņa (2) svāra palīdzību.

58. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 57. pretenzijai, kurš papildus satur vērtību mērīšanu vienam vai vairākiem sekojošiem parametriem: pagriešanās leņķis ap pirmo asi (4) un/vai ap otro asi (11), un/vai ap trešo asi (16); leņķiskais griešanās ātrums ap pirmo asi (4) un/vai ap otro asi (11), un/vai ap trešo asi (16); ķermeņa (2) un/vai pirmās ass (4), un/vai otrās ass (11), un/vai trešās ass (16) pozīcija; griešanās ap pirmo asi (4) un/vai ap otro asi (11), un/vai ap trešo asi (16) griezes moments, spēks.

59. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 58. pretenzijai, kurš papildus satur ķermeņa (2) griešanās ap slīpuma asi (16) mehānisku ierobežošānu abos griešanās virzienos starp apakšējo leņķa robežvērtību un augšējo leņķa robežvērtību un šo leņķa robežvērtību iestatīšanu atbilstoši izvēlētajai apakšējai leņķa robežvērtībai, kas lielāka par 0 grādiem un mazāka par 90 grādiem, un atbilstoši augšējai leņķa robežvērtībai, kas lielāka par izvēlēto apakšējo leņķa robežvērtību un mazāka par 90 grādiem, realizējot griešanu ar piedziņas ierīces, vēlams motora, palīdzību.

60. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 59. pretenzijai, kurš papildus satur vismaz vienai izejas asij pievadītās izejas jaudas palielināšanu, samazinot attālumu starp ķermeņa (2) masas centru (CM) un otro asi (11).

61. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 60. pretenzijai, kurš papildus satur vismaz vienai izejas asij pievadītās izejas jaudas palielināšanu, samazinot leņķa variāciju starp pirmās rāmja plaknes normālvektoru un otrās rāmja plaknes normālvektoru, pie kam rāmja plakne tiek definēta kā plakne, kas iet cauri rāmja, kurā ir iemontēta piedziņas ierīce, vēlams motors, trim punktiem, kas neatrodas uz vienas taisnes.

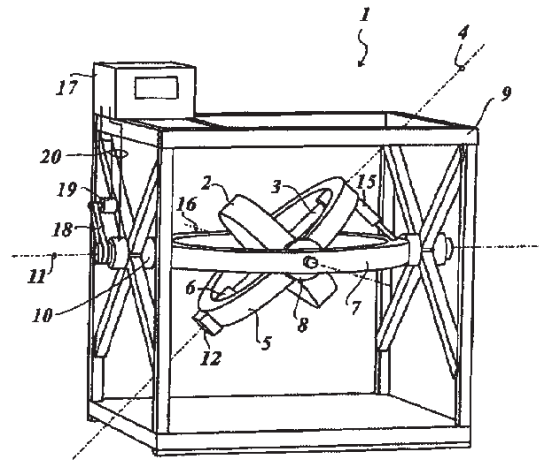
62. Paņēmiens atbilstoši 61. pretenzijai, kas papildus satur minētās variācijas noturēšanu, mazāku par 5 grādiem.

63. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 62. pretenzijai, kurš papildus satur vismaz vienai izejas asij pievadītās izejas jaudas palielināšanu, samazinot variāciju leņķim starp izejas leņķiskā ātruma ( $\omega_{out}$ ) ap vismaz vienu izejas asi vektoru un rāmja plaknes normālvektoru, pie kam rāmja plakne tiek definēta kā plakne, kas iet cauri rāmja, kurā ir iemontēta piedziņas ierīce, vēlams motors, trim punktiem, kas neatrodas uz vienas taisnes.

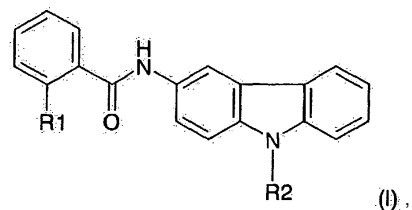
64. Paņēmiens atbilstoši 63. pretenzijai, kas papildus satur minētās variācijas noturēšanu, mazāku par 5 grādiem.

65. Paņēmiens atbilstoši 39. pretenzijas sadaļām no a) līdz f), vēlams atbilstoši jebkurai no 39. līdz 64. pretenzijai, kurš papildus satur vismaz vienai izejas asij pievadītās izejas jaudas palielināšanu, samazinot variāciju leņķim starp ķermeņa (2) leņķiskās kustības ap pirmo asi (4) leņķiskā ātruma vektoru un ķermeņa plaknes normālvektoru, pie kam ķermeņa plakne ir definēta kā plakne, kas iet cauri ķermeņa (2) trijiem punktiem, kuri neatrodas vienā plaknē.

66. Paņēmiens atbilstoši 65. pretenzijai, kas papildus satur minētās variācijas noturēšanu, mazāku par 5 grādiem.



- (51) **C07D 209/88**<sup>(200601)</sup> (11) **2282994**  
**A61K 31/403**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 29/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09745708.9 (22) 11.05.2009  
(43) 16.02.2011  
(45) 03.07.2013  
(31) 08425336 (32) 14.05.2008 (33) EP  
(86) PCT/EP2009/055652 11.05.2009  
(87) WO2009/138376 19.11.2009
- (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  
COLETTA, Isabella, IT  
DRAGONE, Patrizia, IT  
FURLOTTI, Guido, IT  
GAROFALO, Barbara, IT  
GUGLIELMOTTI, Angelo, IT  
MANGANO, Giorgina, IT  
MAUGERI, Caterina, IT
- (74) Allaix, Roberto, et al, Marchi & Partners S.r.l. Via Pirelli, 19, 20124 Milano, IT  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **3-AMINOKARBAZOLA SAVIENOJUMS, TO SATUROŠA FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA UN PAŅĒMIENS TĀ IEGŪŠANAI**  
**3-AMINOCARBAZOLE COMPOUND, PHARMACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING IT AND PREPARATION METHOD THEREFOR**
- (57) 1. 3-Aminokarbazols ar vispārīgo formulu (I):



kur  
R1 ir halogēna atoms, metilgrupa vai trihalogēnmetilgrupa, nitrogrupa, ciāngrupa vai triflātgrupa, un R2 ir hidroksialkilgrupa ar



taisnu vai sazarotu ķēdi, kas satur no 1 līdz 8 oglekļa atomiem, vai karbonilalkilgrupa ar taisnu vai sazarotu ķēdi, kas satur no 1 līdz 8 oglekļa atomiem, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, polimorfa kristāliska forma, stereozomērs, enantiomērs vai estera priekštečviela.

2. 3-Aminokarbazols saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka R1 ir fluora vai hlora atoms, vai trifluorometilgrupa vai trihlormetilgrupa, un R2 ir hidroksilalkilgrupa ar taisnu vai sazarotu ķēdi, kas satur no 1 līdz 6 oglekļa atomiem, vai karbonilalkilgrupa ar taisnu vai sazarotu ķēdi, kas satur no 1 līdz 4 oglekļa atomiem.

3. 3-Aminokarbazols saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka R1 un R2 nozīmes ir tādas, kā norādīts 1. tabulā

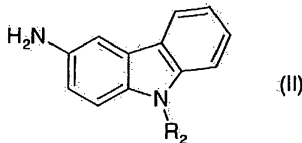
1. TABULA

Savienojums	R1	R2
1	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH
2	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OH
3	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OH
4	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>
5	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH
6	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OH

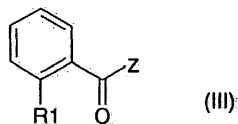
4. Farmaceutiska kompozīcija, kas raksturīga ar to, ka tā satur 3-aminokarbazola saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai terapeitiski efektīvu devu, tā farmaceutiski pieņemamu sāli, polimorfu kristālisku formu, stereozomēru, enantiomēru vai estera priekštečvielu, kopā ar vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu inerti nesēju.

5. Paņēmiens 3-aminokarbazola saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka tas satur šādas stadijas:

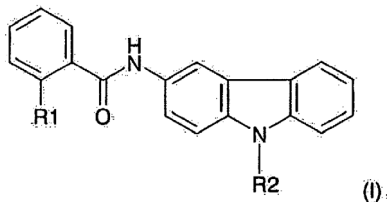
a) amīna ar formulu (II)



kur R2 nozīme ir, kā norādīts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, pakļaušana reakcijai ar savienojumu ar formulu (III)



kur R1 nozīme ir, kā norādīts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, un Z ir izvēlēts no grupas, kas satur Cl, Br, OH, OR un OC(O)R, kur R ir alkilgrupa ar taisnu vai sazarotu ķēdi, kas satur no 1 līdz 6 oglekļa atomiem, iegūstot 3-aminokarbazolu ar formulu (I)



kur R1 un R2 nozīme ir, kā norādīts iepriekš, un b) neobligāti, šādā veidā iegūta savienojuma ar formulu (I), farmaceutiski pieņemama sāls, polimorfās kristāliskas formas, stereozomēra vai enantiomēra veidošana.

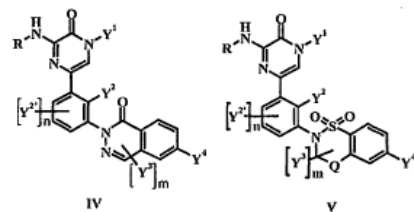
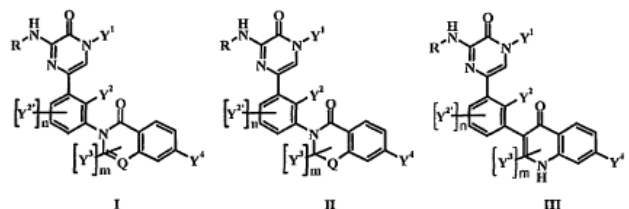
6. 3-Aminokarbazola saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, tā farmaceutiski pieņemama sāls, polimorfās kristāliskas formas, stereozomēra, enantiomēra vai estera priekštečvielas izmantošana medikamenta ražošanai traucējumu, kas izvēlēti no rindas, kas sastāv no: iekaisuma procesiem, sāpēm, drudža, audzējiem, Alzheimerā slimības un aterosklerozes, ārstēšanai vai profilaksei.

7. 3-Aminokarbazola saskaņā ar 6. pretenziju izmantošana, kas raksturīga ar to, ka minētais iekaisuma process ir izvēlēts no rindas, kas satāv no: tūskas, apsārtuma, locītavu iekaisuma, reimatoīdā artrīta un artrozes.

8. 3-Aminokarbazola saskaņā ar 6. pretenziju izmantošana, kas raksturīga ar to, ka minētie audzēji ir izvēlēti no rindas: taisnās zarnas un plaušu karcinoma un adenokarcinoma.

9. 3-Aminokarbazols saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, tā farmaceutiski pieņemams sāls, polimorfa kristāliska forma, stereozomērs, enantiomērs vai estera priekštečviela izmantošanai iekaisuma procesus, sāpju, drudža, audzēju, Alzheimerā slimības un aterosklerozes ārstēšanā vai profilaksē.

- (51) **C07D 403/10**<sup>(200601)</sup> (11) **2300459**  
**C07D 403/14**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/4725**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 37/00**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 401/14**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 413/14**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 417/14**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09772333.2 (22) 22.06.2009  
(43) 30.03.2011  
(45) 29.05.2013  
(31) 77510 (32) 02.07.2008 (33) US  
(86) PCT/EP2009/057707 22.06.2009  
(87) WO2010/000633 07.01.2010  
(73) F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH  
(72) DEWDNEY, Nolan James, US  
LOU, Yan, US  
SJOGREN, Eric Brian, US  
SOTH, Michael, US  
SWEENEY, Zachary Kevin, US  
(74) Sauer, Frank, F. Hoffmann-La Roche AG, Patent Department, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
(54) **JAUNI FENILPIRAZINONI KĀ KINĀZES INHIBITORI NOVEL PHENILPYRAZINONES AS KINASE INHIBITORS**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (I), (II), (III), (IV) vai (V)



kur R ir H, -R<sup>1</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> vai -R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>;  
R<sup>1</sup> ir arilgrupa, heteroarilgrupa, cikloalkilgrupa vai heterocikloalkilgrupa un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem R<sup>1'</sup>; kur katrs R<sup>1'</sup> neatkarīgi ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, hidroksilgrupa, C<sub>1-6</sub>hidroksilalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupa, halogēna atoms, nitrogrupa, aminogrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, heterocikloalkilgrupa, ciāngrupa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa;  
R<sup>2</sup> ir -C(=O), -C(=O)O, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>C(=O)O, -C(=O)N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>, -CH<sub>2</sub>C(=O), -CH<sub>2</sub>C(=O)N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub> vai -S(=O)<sub>2</sub>; kur katrs R<sup>2</sup> neatkarīgi ir H, C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupa vai C<sub>1-6</sub>hidroksilalkilgrupa; un q ir 1, 2 vai 3;

R<sup>3</sup> ir H vai R<sup>4</sup>; kur R<sup>4</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupa, C<sub>1-6</sub>heteroalkilgrupa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupa, aminogrupsa, arilgrupsa, arilalkilgrupsa, alkilarilgrupsa, heteroarilgrupsa, alkilheteroarilgrupsa, heteroarilalkilgrupsa, cikloalkilgrupsa, alkilcikloalkilgrupsa, cikloalkilalkilgrupsa, heterocikloalkilgrupsa, alkilheterocikloalkilgrupsa vai heterocikloalkilalkilgrupsa un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, hidroksilgrupām, oksogrupām, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupām, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupām, halogēna atomiem, nitrogrupām, aminogrupām, ciāngrupām, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonilgrupām vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupām;

Q ir viens no CH, N, CH<sub>2</sub>, CH(Y) vai NH; kur Y ir halogēna atoms, hidroksilgrupsa vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, aminogrupas un halogēna atoma;

Y<sup>1</sup> ir H vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa;

Y<sup>2</sup> ir Y<sup>2a</sup> vai Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2a</sup> ir H vai halogēna atoms; Y<sup>2b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2b</sup> ir hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa vai halogēna atoms;

katrs Y<sup>2</sup> neatkarīgi ir Y<sup>2a</sup> vai Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2a</sup> ir halogēna atoms; Y<sup>2b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2b</sup> ir hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa vai halogēna atoms; n ir 0, 1, 2 vai 3;

Y<sup>3</sup> ir halogēna atoms vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, aminogrupas un halogēna atoma;

m ir 0 vai 1;

Y<sup>4</sup> ir Y<sup>4a</sup>, Y<sup>4b</sup>, Y<sup>4c</sup> vai Y<sup>4d</sup>; kur Y<sup>4a</sup> ir H vai halogēna atoms;

Y<sup>4b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas;

Y<sup>4c</sup> ir C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas; un

Y<sup>4d</sup> ir aminogrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

R ir H, -R<sup>1</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> vai -R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>;

R<sup>1</sup> ir arilgrupsa, heteroarilgrupsa, cikloalkilgrupsa vai heterocikloalkilgrupsa un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem R<sup>1</sup>; kur katrs R<sup>1</sup> neatkarīgi ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa, halogēna atoms, nitrogrupsa, aminogrupsa, cikloalkilgrupsa, heterocikloalkilgrupsa, ciāngrupsa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupsa;

R<sup>2</sup> ir -C(=O), -C(=O)O, -C(=O)N(R<sup>2</sup>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>C(=O)O, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>C(=O)N(R<sup>2</sup>), -CH<sub>2</sub>C(=O)N(R<sup>2</sup>) vai -S(=O)<sub>2</sub>;

kur R<sup>2</sup> ir H vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa; un q ir 1, 2 vai 3;

R<sup>3</sup> ir H vai R<sup>4</sup>; kur R<sup>4</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa, aminogrupsa, arilgrupsa, arilalkilgrupsa, alkilarilgrupsa, heteroarilgrupsa, alkilheteroarilgrupsa, heteroarilalkilgrupsa, cikloalkilgrupsa, alkilcikloalkilgrupsa, cikloalkilalkilgrupsa, heterocikloalkilgrupsa, alkilheterocikloalkilgrupsa vai heterocikloalkilalkilgrupsa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, hidroksilgrupām, oksogrupām, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupām, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupām, halogēna atomiem, nitrogrupām, aminogrupām, ciāngrupām, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonilgrupām vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupām;

Q ir CH vai N;

Y<sup>1</sup> ir H vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa;

Y<sup>2</sup> ir Y<sup>2a</sup> vai Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2a</sup> ir H vai halogēna atoms; Y<sup>2b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2b</sup> ir hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa vai halogēna atoms;

katrs Y<sup>2</sup> neatkarīgi ir Y<sup>2a</sup> vai Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2a</sup> ir halogēna atoms; Y<sup>2b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2b</sup> ir hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa vai halogēna atoms; n ir 0, 1, 2 vai 3;

Y<sup>3</sup> ir halogēna atoms vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, aminogrupas un halogēna atoma;

m ir 0 vai 1;

Y<sup>4</sup> ir Y<sup>4a</sup>, Y<sup>4b</sup>, Y<sup>4c</sup> vai Y<sup>4d</sup>; kur

Y<sup>4a</sup> ir H vai halogēna atoms;

Y<sup>4b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas;

Y<sup>4c</sup> ir C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas; un

Y<sup>4d</sup> ir aminogrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

3. Savienojums ar formulu (II) saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

R ir H, -R<sup>1</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>, -R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> vai -R<sup>2</sup>-R<sup>3</sup>;

R<sup>1</sup> ir arilgrupsa, heteroarilgrupsa, cikloalkilgrupsa vai heterocikloalkilgrupsa un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem R<sup>1</sup>;

katrs R<sup>1</sup> neatkarīgi ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa, halogēna atoms, nitrogrupsa, aminogrupsa, cikloalkilgrupsa, cikloalkil-C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, heterocikloalkilgrupsa, ciāngrupsa vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupsa;

R<sup>2</sup> ir -C(=O), -C(=O)O, -C(=O)N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>, -CH<sub>2</sub>C(=O), -CH<sub>2</sub>C(=O)N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub> vai -S(=O)<sub>2</sub>; kur katrs R<sup>2</sup> neatkarīgi ir H, C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupsa vai C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupsa;

un q ir 1, 2 vai 3;

R<sup>3</sup> ir H vai R<sup>4</sup>; kur R<sup>4</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa, aminogrupsa, arilgrupsa, arilalkilgrupsa, alkilarilgrupsa, heteroarilgrupsa, alkilheteroarilgrupsa, heteroarilalkilgrupsa, cikloalkilgrupsa, alkilcikloalkilgrupsa, cikloalkilalkilgrupsa, heterocikloalkilgrupsa, alkilheterocikloalkilgrupsa vai heterocikloalkilalkilgrupsa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām, hidroksilgrupām, oksogrupām, C<sub>1-6</sub>hidroksialkilgrupām, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupām, halogēna atomiem, nitrogrupām, aminogrupām, ciāngrupām, C<sub>1-6</sub>alkilsulfonilgrupām vai C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupām;

Q ir CH<sub>2</sub>, CH(Y) vai NH;

Y ir halogēna atoms, hidroksilgrupsa vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, aminogrupas un halogēna atoma;

Y<sup>1</sup> ir H vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa;

Y<sup>2</sup> ir Y<sup>2a</sup> vai Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2a</sup> ir H vai halogēna atoms; Y<sup>2b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem Y<sup>2b</sup>;

kur Y<sup>2b</sup> ir hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa vai halogēna atoms; katrs Y<sup>2</sup> neatkarīgi ir Y<sup>2a</sup> vai Y<sup>2b</sup>; kur Y<sup>2a</sup> ir halogēna atoms; Y<sup>2b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem Y<sup>2b</sup>;

kur Y<sup>2b</sup> ir hidroksilgrupsa, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupsa vai halogēna atoms; n ir 0, 1, 2 vai 3;

Y<sup>3</sup> ir halogēna atoms vai C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, kur C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas, aminogrupas un halogēna atoma;

m ir 0 vai 1;

Y<sup>4</sup> ir Y<sup>4a</sup>, Y<sup>4b</sup>, Y<sup>4c</sup> vai Y<sup>4d</sup>; kur

Y<sup>4a</sup> ir H vai halogēna atoms;

Y<sup>4b</sup> ir C<sub>1-6</sub>alkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas;

Y<sup>4c</sup> ir C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no C<sub>1-6</sub>alkilgrupas, C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, aminogrupas un C<sub>1-6</sub>alkoksigrupas; un

Y<sup>4d</sup> ir aminogrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

4. Savienojums ar formulu (I) vai (II) saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur Y<sup>1</sup> ir metilgrupsa, Y<sup>2</sup> ir hidroksimetilgrupsa, n ir 0 un m ir 0.

5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 2. pretenziju, kur Q ir CH.

6. Savienojums ar formulu (I) vai (II) saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur Y<sup>4</sup> ir Y<sup>4c</sup> vai Y<sup>4d</sup>; kur Y<sup>4c</sup> ir C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C<sub>1-6</sub>alkilgrupas un C<sub>1-6</sub>halogēnalkilgrupas; un Y<sup>4d</sup> ir aminogrupsa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C<sub>1-6</sub>alkilgrupām.

7. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur Btk inhibitora savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas sajaukts ar vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu nesēju, palīgvielu vai šķīdinātāju.

8. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai izmantošanai iekaisuma un/vai autoimūna stāvokļa ārstēšanā vai B-šūnu proliferācijas inhibēšanai.

- (51) **C07D 295/13**<sup>(200601)</sup> (11) **2307393**  
**C07D 295/155**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 09767695.1 (22) 18.06.2009  
 (43) 13.04.2011  
 (45) 10.04.2013  
 (31) 74390 P (32) 20.06.2008 (33) US  
 486361 17.06.2009 US  
 (86) PCT/US2009/047723 18.06.2009  
 (87) WO2009/155386 23.12.2009  
 (73) Abbott Laboratories, 100 Abbott Park Road, Abbott Park, Illinois 60064, US  
 (72) FRANCZYK, Thaddeus, S., II., US  
 HILL, David, R., US  
 HAIGHT, Anthony, R., US  
 MCLAUGHLIN, Maureen, Ann, US  
 SHEKHAR, Shashank, US  
 YU, Su, US  
 MEI, Jianzhang, US  
 WANG, Lei, US

(74) Modiano, Micaela Nadia, Modiano & Partners, Thierschstrasse 11, 80538 München, DE  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **APOPTOZES PROMOTERA ABT-263 IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**  
**A PROCESS FOR THE PREPARATION OF THE APOPTOSIS PROMOTER ABT-263**

(57) 1. Paņēmiens N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoil)-4-(((1R)-3-(morfolin-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda vai tā farmaceutiski pieņemama sāls iegūšanai, kurā ietilpst:

- (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un pirmā reducētāja reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un trešās bāzes ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda un pirmā saistošā reaģenta ar ceturto bāzi vai bez tās un ar papildu saistošu reaģentu vai bez tā savstarpēja reakcija, un N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-4,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoil)-4-(((1R)-3-(morfolin-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:

- (a) 4,4-dimetilcikloheksanona, alkilformiāta un pirmās bāzes reakcija, iegūstot (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (b) (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona, otrās bāzes un pirmā sililētera reaģenta aizsarggrupas reakcija, iegūstot pirmo aizsargāto (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un pirmā aizsargātā (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (c) pirmā aizsargātā (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona un 4-hlorfenilmagnija bromīda reakcija, iegūstot pirmo aizsargāto (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanolu; un pirmā aizsargātā (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (d) pirmā aizsargātā (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanola un pirmās skābes reakcija, iegūstot 2-(4-hlor-

fenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un pirmā reducētāja reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un trešās bāzes ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes atdalīšana vai neatdalīšana; un  
 (g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda, pirmā saistošā reaģenta un, iespējams, pirmā papildu saistošā reaģenta reakcija un N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoil)-4-(((1R)-3-(morfolin-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:

- (a) 4,4-dimetilcikloheksanona, alkilformiāta un pirmās bāzes reakcija, iegūstot (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (b) (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona, otrās bāzes un pirmā sililētera reaģenta aizsarggrupas reakcija, iegūstot pirmo aizsargāto (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un pirmā aizsargātā (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (c) pirmā aizsargātā (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona un 4-hlorfenilmagnija bromīda reakcija, iegūstot pirmo aizsargāto (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanolu; un pirmā aizsargātā (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (d) pirmā aizsargātā (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanola un pirmās skābes reakcija, iegūstot 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un pirmā reducētāja reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un trešās bāzes ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (m) 2-fluorbenzolsulfonilfluorīda un pirmā fluorīda avota reakcija, iegūstot 2-fluorbenzolsulfonilfluorīdu, un 2-fluorbenzolsulfonilfluorīda atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (n) 2-fluorbenzolsulfonilfluorīda, Ruperta (Ruppert's) reaģenta (CH<sub>3</sub>SiCF<sub>3</sub>) un otrā fluorīda avota reakcija, iegūstot 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonil)benzolu, un 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonil)benzola atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (o) 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonil)benzola un hlorsulfonskābes reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonilfluorīdu, un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonilfluorīda atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (p) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonilfluorīda un pirmā NH<sub>3</sub> avota reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīdu, un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana;  
 (q) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda, (1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenil)metil)propilamīna un sestās bāzes reakcija, iegūstot 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīdu, un 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana; un  
 (g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda, pirmā saistošā reaģenta un, iespējams, pirmā papildu saistošā reaģenta reakcija un N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoil)-4-(((1R)-3-(morfolin-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.



4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:
- (a) 4,4-dimetilcikloheksanona, alkilformiāta un pirmās bāzes reakcija, iegūstot (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;
- (b) (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona, otrās bāzes un pirmā sililētera reaģenta aizsarggrupas reakcija, iegūstot pirmo aizsargāto (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un pirmā aizsargātā (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;
- (c) pirmā aizsargātā (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona un 4-hlorfenilmagnija bromīda reakcija, iegūstot pirmo aizsargāto (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanolu; un pirmā aizsargātā (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana; un (d) pirmā aizsargātā (2E)-1-(4-hlorfenil)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanola un pirmās skābes reakcija, iegūstot 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;
- (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un pirmā reducētāja reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;
- (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un trešās bāzes ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes atdalīšana vai neatdalīšana;
- (r) pirmā metāla trifluormetānsulfīnāta, pirmā arilfluorīda avota un pirmā katalizatora reakcija, iegūstot 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonil)benzolu, un 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonil)benzola atdalīšana vai neatdalīšana;
- (o) 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonil)benzola un hlorsulfonskābes reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonilhlorīdu, un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonilhlorīda atdalīšana vai neatdalīšana;
- (p) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonilhlorīda un pirmā NH<sub>3</sub> avota reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīdu, un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana;
- (q) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda, (1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propilamīna un sestās bāzes reakcija, iegūstot 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīdu, un 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana; un (g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda, pirmā saistošā reaģenta un, iespējams, pirmā papildu saistošā reaģenta reakcija, un N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoil)-4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.
5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:
- (a) 4,4-dimetilcikloheksanona, etilformiāta un kālija *terc*-butoksīda reakcija, iegūstot (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;
- (b) (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona, trietilamīna un trimetilhlorsilāna, *terc*-butilhordimetilsilāna vai triizopropilhlor-silāna reakcija, iegūstot (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanonu, (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu; un (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;
- (c) (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona un 4-hlorfenilmagnija bromīda reakcija, iegūstot (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanolu, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanolu vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana;
- (d) (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola un sāļsskābes reakcija, iegūstot 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;
- (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un nātrija triacetoksiborhidrīda reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;
- (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un nātrija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes atdalīšana vai neatdalīšana;
- (m) 2-fluorbenzolsulfonilhlorīda un tetra-*n*-butilamonija fluorīda reakcija, iegūstot 2-fluorbenzolsulfoniifluorīdu, un 2-fluorbenzolsulfoniifluorīda atdalīšana vai neatdalīšana;

- dimetilcikloheksanolu; un (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana;
- (d) (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola un sāļsskābes reakcija, iegūstot 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;
- (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un nātrija triacetoksiborhidrīda reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;
- (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un nātrija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;
- (g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda, 1-etil-3-(3-(dimetilamino)propil)karbodiimīda hidrohlorīda un 4-dimetilamino-piridīna reakcija un N-(4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetil-1-cikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoil)-4-(((1R)-3-(morfolin-4-il)-1-((fenilsulfanil)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonil)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.

6. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:
- (a) 4,4-dimetilcikloheksanona, etilformiāta un kālija *terc*-butoksīda reakcija, iegūstot (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;
- (b) (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona, trietilamīna un trimetilhlorsilāna, *terc*-butilhordimetilsilāna vai triizopropilhlor-silāna reakcija, iegūstot (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanonu, (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu; un (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;
- (c) (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona un 4-hlorfenilmagnija bromīda reakcija, iegūstot (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanolu, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanolu vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana;
- (d) (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((triazopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*terc*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola un sāļsskābes reakcija, iegūstot 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;
- (e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un nātrija triacetoksiborhidrīda reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;
- (f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un nātrija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;
- (m) 2-fluorbenzolsulfonilhlorīda un tetra-*n*-butilamonija fluorīda reakcija, iegūstot 2-fluorbenzolsulfoniifluorīdu, un 2-fluorbenzolsulfoniifluorīda atdalīšana vai neatdalīšana;



(n) 2-fluorbenzolsulfonilfluorīda, Ruperta (Ruppert's) reaģenta ( $\text{CH}_2\text{SiCF}_3$ ) un tris(dimetilamino)sulfonija difluortrimetilsilikāta reakcija, iegūstot 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonyl)benzolu, un 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonyl)benzola atdalīšana vai neatdalīšana;

(o) 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonyl)benzola un hlorsulfonskābes reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonilhlorīdu, un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonilhlorīda atdalīšana vai neatdalīšana;

(p) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonilhlorīda un amonija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana;

(q) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda, (1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propilamīna un trietilamīna reakcija, iegūstot 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīdu, un 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana; un

(g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda, 1-etil-3-(3-dimetilamino)propil)karbodiimīda hidrohlora un 4-dimetilaminopiridīna reakcija un 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-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.

7. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:

(a) 4,4-dimetilcikloheksanona, etilformiāta un kālija *tert*-butoksīda reakcija, iegūstot (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu, un (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;

(b) (2E)-2-(hidroksimetilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona, trietilamīna un trimetilhlorsilāna, *tert*-butilhordimetilsilāna vai triizopropilhlorosilāna reakcija, iegūstot (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanonu, (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanonu vai (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanonu; un (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona atdalīšana vai neatdalīšana;

(c) (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona vai (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona un 4-hlorfenilmagnija bromīda reakcija, iegūstot (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanolu, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanolu vai (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanolu; un (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola atdalīšana vai neatdalīšana;

(d) (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola, (2E)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanola vai (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-1-(4-hlorfenil)-4,4-dimetilcikloheksanola, iegūstot 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīdu, un 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda atdalīšana vai neatdalīšana;

(e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un nātrija triacetoksi-borhidrīda reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;

(f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un nātrija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;

(r) nātrija trifluormetānsulfīnāta, bis-(2-fluorfenil)jodonijs tetrafluorborāta un vara (I) oksīda reakcija, iegūstot 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonyl)benzolu, un 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonyl)benzola atdalīšana vai neatdalīšana;

(o) 1-fluor-2-((trifluormetil)sulfonyl)benzola un hlorsulfonskābes reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonilhlorīdu,

un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonilhlorīda atdalīšana vai neatdalīšana;

(p) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonilhlorīda un amonija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija, iegūstot 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīdu, un 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana;

(q) 4-fluor-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda, (1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propilamīna un trietilamīna reakcija, iegūstot 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīdu, un 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana; un

(g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda, 1-etil-3-(3-dimetilamino)propil)karbodiimīda hidrohlora un 4-dimetilaminopiridīna reakcija un 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-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.

8. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ietilpst:

(e) 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīda, 4-piperazin-1-ilbenzoscābes etilestera un nātrija triacetoksi-borhidrīda reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;

(f) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera un nātrija hidroksīda ūdens šķīduma reakcija un 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes etilestera atdalīšana vai neatdalīšana;

(g) 4-(4-((2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-en-1-il)metil)piperazin-1-il)benzoscābes, 4-(((1R)-3-morfolin-4-il-1-((feniltio)metil)propil)amino)-3-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda, 1-etil-3-(3-dimetilamino)propil)karbodiimīda hidrohlora un 4-dimetilaminopiridīna reakcija un 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-((trifluormetil)sulfonyl)benzolsulfonamīda atdalīšana vai neatdalīšana.

9. Savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona, (2E)-4,4-dimetil-2-(((trizopropilsilil)oksi)metilēn)cikloheksanona un (2E)-2-(((*tert*-butil(dimetil)silil)oksi)metilēn)-4,4-dimetilcikloheksanona.

10. Savienojums - 2-(4-hlorfenil)-5,5-dimetilcikloheks-1-ēn-1-karbaldehīds vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

(51) <b>C12N 15/09</b> <sup>(200601)</sup>	(11) <b>2310501</b>
<b>C12N 15/11</b> <sup>(200601)</sup>	
<b>C12N 15/67</b> <sup>(200601)</sup>	
(21) 09800055.7	(22) 22.07.2009
(43) 20.04.2011	
(45) 03.07.2013	
(31) 08161029	(32) 23.07.2008 (33) EP
(86) PCT/EP2009/059399	22.07.2009
(87) WO2010/010107	28.01.2010
(73) Boehringer Ingelheim Pharma GmbH & Co. KG, Binger Straße 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE	
(72) ENENKEL, Barbara, DE	
(74) Simon, Elke Anna Maria, et al, Boehringer Ingelheim GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE	
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV	
(54) <b>JAUNI REGULĒJOŠI ELEMENTI</b>	
<b>NOVEL REGULATORY ELEMENTS</b>	
(57) 1. Poliadenilācijas signāls, kas satur nukleīnskābi, kas satur sekvenci, kura ir vismaz 75 % identiska SEQ ID NO: 8.	
2. Poliadenilācijas signāls saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur sekvenci, kura ir vismaz 80 %, 85 %, 90 %, 95 % vai 98 % identiska SEQ ID NO: 8.	
3. Poliadenilācijas signāls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas satur SEQ ID NO: 8.	

4. Poliadenilācijas signāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur minētais poliadenilācijas signāls ir funkcionāli saistīts ar heterologu kodējošu sekvenci.
5. Vektors, kas satur jebkuru no minētajiem poliadenilācijas signāliem saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai.
6. Vektors saskaņā ar 5. pretenziju, kas satur interesējošo heterologo gēnu, kas kodē interesējošo heterologo produktu.
7. Vektors saskaņā ar 6. pretenziju, kur interesējošais produkts ir interesējošais polipeptīds un minētais interesējošais polipeptīds ir antivielā, antivielas fragments vai sapludinātais proteīns.
8. Šūna, kas satur vektoru saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 7. pretenzijai.
9. Šūna saskaņā ar 8. pretenziju, kurā minētais poliadenilācijas signāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai ir funkcionāli saistīts ar transkripcijas vienību, kas kodē interesējošo produktu un kur interesējošais produkts ir interesējošā gēna kodētais interesējošais polipeptīds.
10. Šūna saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kur minētā šūna ir kāmjā šūna.
11. Šūna saskaņā ar 10. pretenziju, kur kāmjā šūna ir ķītnas kāmjū olnīcu (CHO) šūna, labāk CHO DG44 šūna.
12. Interesējošā polipeptīda, kas tiek kodēts ar interesējošo gēnu iegūšanas paņēmieni, kas satur:
  - (a) saimniekšūnas, kas satur vektoru saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 7. pretenzijai, nodrošināšanu vai šūnas saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai nodrošināšanu;
  - (b) minēto šūnu kultivēšana apstākļos, kas nodrošina šūnu proliferāciju un interesējošā gēna ekspresiju,
  - (c) interesējošā polipeptīda savākšana;
  - (d) interesējošā polipeptīda attīrīšana.
13. Jebkura poliadenilācijas signāla saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošana par izolatoru.
14. Komplekts, kas satur jebkuru poliadenilācijas signālu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, vektoru, šūnu un šūnu barotni, minēto šūnu kultivēšanai.

darbībām – pārtveres pieprasījums, šūnu maiņu pasūtījums un pieprasījuma pārsūtījums uz mobilo mezglu – nodrošināšanu.

2. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kurā paņēmieni papildus ietver, lietotāja plaknes savienojuma ar tīkla elementu, kas saistīts ar apmeklētāju atrašanās vietu reģistrā, izveidi, izmantojot atlasītās šūnas.

3. Paņēmieni saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas papildus ietver: indeksa uz lokāli noteiktas konfigurācijas (730), lokāli noteiktas konfigurācijas attiecībā uz radio piekļuves tehnoloģiju un frekvenču atlasē prioritātes saņemšanu no mobilitātes vadības mezgla, izmantojot radio resursu vadības elementu (750) bāzes stacijas mezglā; un prioritāšu informācijas iegūšanu, izmantojot radio resursu vadības elementu, lai noteiktu prioritāti vismaz vienai šūnai, kas pieder atrašanās vietai, kura reģistrēta apmeklētāju atrašanās vietu reģistrā, attiecībā pret citām šūnām rezerves sistēmā.

4. Paņēmieni saskaņā ar 3. pretenziju, kur radio resursu vadības elements nodrošina ar prioritātes informāciju, kas iegūta no mobilā mezgla.

5. Paņēmieni saskaņā ar 4. pretenziju, kur prioritātes informācija, kas samazina pārtveres, šūnu maiņu pasūtījuma vai pārsūtījuma uz šūnu, kas nepieder atrašanās vietai, kas reģistrēta apmeklētāju atrašanās vietu reģistra tīkla elementā, caur kuru tiek izveidots lietotāja savienojums, varbūtību.

6. Paņēmieni saskaņā ar 1. vai 3. pretenziju, kur lietotāja plaknes savienojums satur ķēdes komutācijas zvānu un tīkla elementu, kas ir vismaz viens no šādiem elementiem: mobilais komutācijas centrs, mobilais komutācijas centra serveris un 1xRTT MSC.

7. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kurā paņēmieni papildus ietver pārtveres ierobežojumu saraksta iegūšanu, kurā norādīta atrašanās vieta, kas reģistrēta apmeklētāju atrašanās vietu reģistrā kā mobilā mezgla rezerves sistēmas vienīgā atļautā atrašanās vieta.

8. Paņēmieni saskaņā ar 7. pretenziju, kurā paņēmieni papildus ietver: mobilajam mezglam raidīta ienākošā paziņojuma uzņemšanu rezerves sistēmā; vismaz vienas pārraides atlasīšanu no vismaz vienas blakusesošas šūnas mobilajā mezglā; ierobežojumu saraksta atlasīšanu, izmantojot mobilo mezglu, un atrašanās vietas atjaunināšanas izlaišanu, atbildot uz vismaz vienas blakusesošas šūnas, kas atrodas atrašanās vietā, atrašanu ierobežojumu sarakstā.

9. Sistēma, kas ietver: mobilo mezglu (101), kas izveidots, lai veiktu radio mērījumus, pārraidītu mobilā mezgla izvērsta pakešu sistēmas uzraudzības apgabala (506) reģistrāciju bāzes stacijas mezglā (120) un saņemtu vismaz vienu elementu no sekojošajiem: pārtveres pieprasījums, šūnu maiņu pasūtījums un pieprasījuma pārsūtījums; mobilitātes vadības mezglu (130), kas izveidots, lai saņemtu uzraudzības apgabala reģistrāciju un mobilā mezgla uzraudzības apgabala atzīmēšanu atrašanās vietā (516); apmeklētāju atrašanās vietu reģistru (170), kas izveidots, lai saņemtu rezerves sistēmas (112, 110) atrašanās vietas reģistrāciju, turklāt rezerves sistēma ietver vismaz vienu mobilo sakaru globālo sistēmu (*Global System of Mobile Communications*), universālo mobilo telesakaru sistēmu (*Universal Mobile Telecommunication System*) un koddales daudzpiekļuvi (*Code Division Multiple Access 2000*); bāzes stacijas mezglu, kas izveidots, lai mobilitātes vadības mezglā reģistrētu (203) mobilā mezgla uzraudzības apgabalu, saņemtu (205) pieprasījumu veikt lietotāja plaknes nesēja izveidi, izmantojot rezerves sistēmu, iegūtu radiomērījumus (305), kas saistīti ar vismaz divām kandidātu šūnām no mobilā mezgla, atzīmētu vismaz divas kandidātu šūnas vismaz vienai šūnai, kas ir saistīta ar atrašanās vietu no mobilitātes vadības mezgla, atlasītu šūnu starp vismaz vienu šūnu, norādītu atlasīto šūnu mobilajā mezglā un nodrošinātu vismaz vienu no darbībām: pārtveres pieprasījums, šūnu maiņu pasūtījums un pieprasījumu pārsūtījums uz mobilo mezglu, turklāt bāzes stacija papildus satur atmiņu (730) un radio resursu kontroles funkcijas elementu/vienību (750), kas izveidots, lai atzīmētu piemērotas šūnas atrašanās vietas ietvaros, kas reģistrēta apmeklētāju atrašanās vietu reģistrā.

10. Datorprogramma, kas ietver kodu, kurš, ja to izmanto datu apstrādes sistēmā, ir piemērots, lai izraisītu: mobilā mezgla (101) izvērsta pakešu sistēmas uzraudzības apgabala reģistrāciju (202) mobilitātes vadības mezglā, izmantojot bāzes stacijas mezglu (120); rezerves sistēmas (112, 110) atrašanās vietas (516) noteikšanu, kas balstās uz mobilā mezgla atrašanās vietu; mobilā mezgla atrašanās vietu reģistrāciju (203) rezerves sistēmas (112, 110) apmeklētāju

(51) **H04W 36/00**<sup>(200901)</sup> (11) **2312892**  
**H04W 68/12**<sup>(200901)</sup>  
**H04W 60/04**<sup>(200901)</sup>

(21) 09173281.8 (22) 16.10.2009  
 (43) 20.04.2011  
 (45) 05.06.2013

(73) Teliasonera AB, Steep Farm, 106 63 Stockholm, SE  
 (72) DAHLÉN, Anders, SE  
 NILSSON, Ulf, SE  
 (74) Papula Oy, P.O. Box 981, 00101 Helsinki, FI  
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

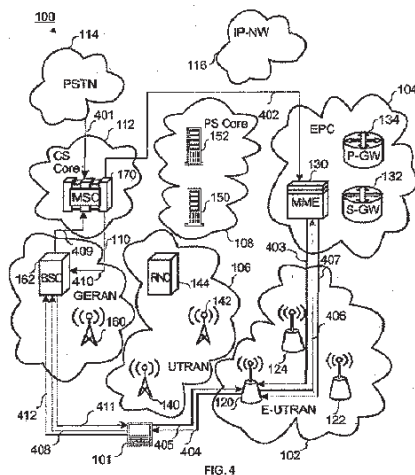
(54) **PĀRTVERES PAŅĒMIENS MOBILAJĀ SAKARU SISTĒMĀ**  
**METHOD FOR PERFORMING A HANDOVER IN A MOBILE COMMUNICATION SYSTEM**

(57) 1. Paņēmieni, kas ietver: mobilā mezgla (101) izvērsta pakešu sistēmas uzraudzības apgabala (506) reģistrāciju (202) mobilitātes vadības mezglā (130), izmantojot bāzes stacijas mezglu (120); rezerves sistēmas (112, 110) atrašanās vietas (516) noteikšanu, kas balstās uz mobilā mezgla atrašanās vietu; mobilā mezgla atrašanās vietas reģistrāciju (203) rezerves sistēmas apmeklētāja atrašanās vietas reģistrā (170), kur rezerves sistēma ietver vismaz vienu mobilo sakaru globālo sistēmu (*Global System of Mobile Communications*), universālo mobilo telesakaru sistēmu (*Universal Mobile Telecommunication System*) un koddales daudzpiekļuvi (*Code Division Multiple Access 2000*); pieprasījuma (403) veikt lietotāja plaknes nesēja izveidi, izmantojot rezerves sistēmu (112, 110), saņemšanu, izmantojot bāzes stacijas mezglu; radiomērījumu (305), kas saistīti vismaz ar divām kandidātu šūnām no mobilā mezgla, iegūšanu, izmantojot bāzes stacijas mezglu; vismaz divu kandidātu šūnu atzīmēšanu, izmantojot bāzes stacijas mezglu, vismaz vienai šūnai, kas ir saistīta ar atrašanās vietu, kas reģistrēta apmeklētāju atrašanās vietu reģistrā; šūnas atlasīšanu no vismaz vienas šūnas, izmantojot bāzes stacijas mezglu; atlasītās šūnas norādi mobilajā mezglā un vismaz vienu no sekojošām

atrašanās vietu reģistrā, kur rezerves sistēma ietver vismaz vienu mobilo sakaru globālo sistēmu (*Global System of Mobile Communications*), universālo mobilo telesakaru sistēmu (*Universal Mobile Telecommunication System*) un koda daļes daudzpiekļuvi (*Code Division Multiple Access 2000*); pieprasījuma veikt lietotāja plaknes nesēja izveidi, izmantojot rezerves sistēmu, saņemšanu, izmantojot bāzes stacijas mezglu; radiomērījumu (305), kas saistīti vismaz ar divu kandidātu šūnu iegūšanu no mobilā mezgla, iegūšanu, izmantojot bāzes stacijas mezglu; vismaz divu kandidātu šūnu atzīmēšanu, izmantojot bāzes stacijas mezglu, vismaz vienai šūnai, kas ir saistīta ar atrašanās vietu, kas ir reģistrēta apmeklētāju atrašanās vietu reģistrā; šūnas atlasī no vismaz vienas šūnas, izmantojot bāzes stacijas mezglu; atlasītās šūnas norādi mobilajā mezglā; un vismaz vienas darbības nodrošināšanu – pārtveres pieprasīšanu, šūnu maiņu pasūtījumu un pieprasījuma pārsūtījumu uz mobilo mezglu.

11. Datorprogramma saskaņā ar 10. pretenziju, kur minētā datorprogramma ir saglabāta datorlasāmā datu nesējā.

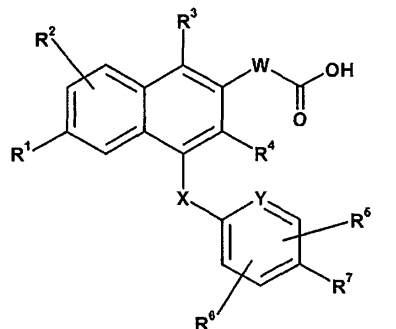
12. Datorprogramma saskaņā ar 10. pretenziju, kur minētais datorlasāmais datu nesējs ir noņemama atmiņas karte, hologrāfiska atmiņa, magnētdisks vai optiskais disks.



Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **NAFĪLETIKSKĀBES**  
**NAPHTHYLACETIC ACIDS**

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



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls vai esters, kur:  
W ir C(H)<sub>2</sub>, C(H)<sub>2</sub>-C(H)<sub>2</sub>, C(H)(CH<sub>3</sub>), CH<sub>2</sub>-C(H)(CH<sub>3</sub>) vai C(H)(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>;  
X ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- (1) O,
- (2) N(H),
- (3) N(CH<sub>3</sub>),
- (4) S,
- (5) S(O) un
- (6) S(O)<sub>2</sub>;

Y ir oglekļa atoms vai slāpekļa atoms;

R<sup>1</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- (1) ūdeņraža atoma,
- (2) halogēna atoma,
- (3) metilgrupas, neobligāti aizvietotas ar fluora atomu,
- (4) C<sub>1-7</sub>alkoksigrupas, neobligāti aizvietotas ar fluora atomu,
- (5) ciāngrupas un
- (6) C<sub>1-7</sub>alkilsulfonilgrupas;

R<sup>2</sup> ir ūdeņraža atoms, fluora atoms, hlora atoms, C<sub>1-7</sub>alkilgrupa vai zemākā alkoksigrupa;

R<sup>3</sup> ir ūdeņraža atoms, fluora atoms, hlora atoms, broms vai metilgrupa;

R<sup>4</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- (1) ūdeņraža atoma,
- (2) halogēna atoma,
- (3) C<sub>1-7</sub>alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar fluora atomu,
- (4) C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupas un
- (5) etenilgrupas;

R<sup>5</sup> un R<sup>6</sup> neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no:

- (1) ūdeņraža atoma,
- (2) halogēna atoma,
- (3) C<sub>1-7</sub>alkilgrupas,
- (4) ciāngrupas un
- (5) C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupas;

R<sup>7</sup> ir ciāngrupa vai S(O)<sub>2</sub>-R<sup>8</sup>, kur R<sup>8</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- (1) C<sub>1-7</sub>alkilgrupas,
- (2) C<sub>3-7</sub>cikloalkilgrupas,
- (4) C<sub>1-7</sub>alkilaminogrupas,
- (5) C<sub>1-7</sub>dialkilaminogrupas,
- (6) zemākās heterocikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar halogēna atomu, C<sub>1-7</sub>alkilgrupu vai C<sub>1-7</sub>alkoksikarbonilgrupu un
- (7) 2-oksā-6-aza-spiro[3.3]hept-6-ilgrupas,

kur „zemākā heterocikloalkilgrupa” attiecas uz piesātinātu vai daļēji nepiesātinātu nearomātiska gredzena daļu ar 3 līdz 7 atomiem, kas saistīti kopā, lai veidotu gredzena struktūru, kur viens, divi vai trīs no gredzena atomiem ir heteroatomi, kamēr atlikušie gredzena atomi ir oglekļa atomi; un farmaceitiski pieņemamie esteri ir skābju ar formulu (I) metil- un etil-esteri, izmantošanai par priekštečzālēm.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur W ir C(H)<sub>2</sub>.

3. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. vai 2. pretenzijas, kur X ir O.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur W ir C(H)<sub>2</sub>, X ir O, Y ir oglekļa atoms un R<sup>7</sup> ir S(O)<sub>2</sub>-R<sup>8</sup>.

- (51) **C07C 317/14**<sup>(200601)</sup> (11) **2346819**  
**C07C 317/22**<sup>(200601)</sup>  
**C07C 317/36**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 213/71**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 295/26**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/435**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/185**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 11/06**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 17/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 37/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 11/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09751894.8 (22) 09.11.2009  
(43) 27.07.2011  
(45) 10.04.2013  
(31) 115133 P (32) 17.11.2008 (33) US  
222182 P 01.07.2009 US  
(86) PCT/EP2009/064810 09.11.2009  
(87) WO2010/055004 20.05.2010  
(73) F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH  
(72) CHEN, Li, CN  
FIROOZANIA, Fariborz, US  
GILLESPIE, Paul, US  
HE, Yun, CN  
LIN, Tai-An, US  
MERTZ, Eric, US  
SO, Sung-Sau, US  
YUN, HongYing, CN  
ZHANG, Zhenshan, CN  
(74) Salud, Carlos E., F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH

5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur W ir C(H)<sub>2</sub>, X ir O, Y ir slāpekļa atoms un R<sup>7</sup> ir S(O)<sub>2</sub>-R<sup>8</sup>.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur R<sup>1</sup> ir fluora atoms un R<sup>2</sup> ir ūdeņraža atoms.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur R<sup>3</sup> ir ūdeņraža atoms, fluora atoms vai metilgrupa, labāk R<sup>3</sup> ir ūdeņraža atoms.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur R<sup>4</sup> ir ūdeņraža atoms, fluora atoms vai metilgrupa, labāk R<sup>4</sup> ir metilgrupa.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur R<sup>5</sup> un R<sup>6</sup> abi ir ūdeņraža atomi.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kur R<sup>7</sup> ir S(O)<sub>2</sub>-R<sup>8</sup> un R<sup>8</sup> ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

(1) metilgrupas, (2) etilgrupas, (3) izopropilgrupas, (4) butilgrupas, (5) dimetilaminogrupas, (6) dietilaminogrupas, (7) pīrolidīn-1-ilgrupas, (8) 4-metilpiperazīn-1-ilgrupas un (9) 2-oksā-6-aza-spiro[3.3]hept-6-ilgrupas.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur R<sup>7</sup> ir S(O)<sub>2</sub>-R<sup>8</sup> un R<sup>8</sup> ir etilgrupa.

12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

[4-(4-etānsulfonil-fenoksi)-6-fluor-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(4-etānsulfonil-fenoksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [6-hlor-4-(4-metānsulfonil-fenoksi)-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [6-fluor-4-(2-fluor-4-metānsulfonil-fenoksi)-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(4-etānsulfonil-3-metil-fenoksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(2-ciān-4-etānsulfonil-fenoksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 {4-[4-(butān-1-sulfonil)-fenoksi]-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [6-fluor-4-(5-metānsulfonil-pīridin-2-iloksi)-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(5-etānsulfonil-pīridin-2-iloksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(3-brom-5-metānsulfonil-pīridin-2-iloksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(4-dimetilsulfamoil-fenoksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 {6-fluor-3-metil-4-[4-(pīrolidīn-1-sulfonil)-fenoksi]-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 [4-(4-dietilsulfamoil-fenoksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 {6-fluor-3-metil-4-[4-(4-metil-piperazīn-1-sulfonil)-fenoksi]-naftalen-2-il]-etiķskābes,  
 {6-fluor-3-metil-4-[4-(2-oksā-6-aza-spiro[3.3]heptān-6-sulfonil)-fenoksi]-naftalen-2-il]-etiķskābes.

13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir [4-(4-etānsulfonil-fenoksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābe.

14. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir [4-(5-etānsulfonil-pīridin-2-iloksi)-6-fluor-3-metil-naftalen-2-il]-etiķskābe.

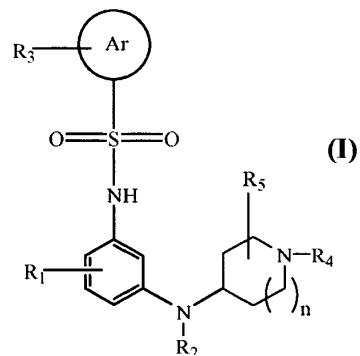
15. Savienojuma saskaņā ar 12., 13. vai 14. pretenziju farmaceutiski pieņemams sāls.

16. Savienojuma saskaņā ar 12., 13. vai 14. pretenziju farmaceutiski pieņemams esters, kur farmaceutiski pieņemamie esteri ir skābes ar formulu (I) metil- un etil-esteri, izmantošanai par priekštecēzālēm.

17. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski iedarbīgu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, daudzumu un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

18. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai astmas, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), alerģiska rinīta, alerģiska iekaisuma un atopiska dermatīta ārstēšanai vai profilaksei.

- (86) PCT/IN2009/000145 03.03.2009  
 (87) WO2010/032258 25.03.2010  
 (73) Suven Life Sciences Limited, Serene Chambers Road No. 5, Avenue 7, Banjara Hills, Hyderabad 500 034, Andra Pradesh, IN  
 (72) NIROGI, Ramakrishna, IN  
 SHINDE, Anil, Karbhari, IN  
 KAMBHAMPATI, Rama, Sastri, IN  
 JAYARAJAN, Pradeep, IN  
 BHYRAPUNENI, Gopinadh, IN  
 JASTI, Venkateswarlu, IN  
 (74) Fagerlin, Heléne, et al, Zacco Sweden AB, P.O. Box 5581, 114 85 Stockholm, SE  
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **ARILSULFONAMĪDU AMĪNA SAVIENOJUMI UN TO IZMANTOŠANA PAR 5-HT6 LIGANDIEM**  
**ARYL SULFONAMIDE AMINE COMPOUNDS AND THEIR USE AS 5-HT6 LIGANDS**  
 (57) 1. Savienojums ar vispārīgo formulu (I)



tā stereozomēri, tā polimorfī, tā farmaceutiski pieņemami sāļi un solvāti, kur R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> un R<sub>5</sub> var būt vienādi vai dažādi un katrs neatkarīgi apzīmē ūdeņraža atomu, halogēna atomu, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkoksigrupu, ciklo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, ciklo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu, halogēn(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupu vai halogēn(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkoksigrupu;



apzīmē arilgrupu;  
 R<sub>4</sub> apzīmē ūdeņraža atomu, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupu, ciklo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, halogēn(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alkilgrupu, arilgrupu vai aralkilgrupu;  
 „n” apzīmē 1 vai 2.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

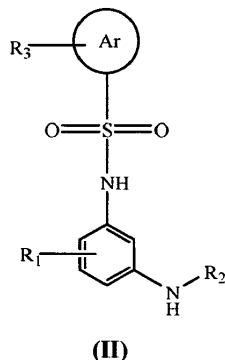
N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-fluor-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-izopropil-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-brom-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-fluor-N-[4-metoksi-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 N-[4-metoksi-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-brom-N-[4-metoksi-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-izopropil-N-[4-metoksi-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-metoksi-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-brom-N-[3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-izopropil-N-[3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-fluor-N-[3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-brom-N-[4-metil-3-(1-metilpiperidīn-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,

- (51) C07D 333/62<sup>(200601)</sup> (11) 2346847  
 C07D 295/30<sup>(200601)</sup>  
 (21) 09787575.1 (22) 03.03.2009  
 (43) 27.07.2011  
 (45) 15.05.2013  
 (31) CH22642008 (32) 17.09.2008 (33) IN



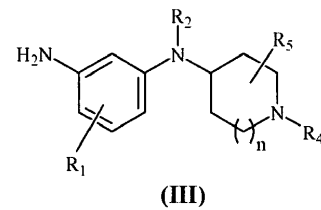
N-[4-metil-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-fluor-N-[4-metil-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-metil-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 N-[3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda hidrohlorīda,  
 4-izopropil-N-[4-metil-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda hidrohlorīda,  
 2-brom-N-[4-metoksi-3-[N-metil-N-(1-metilpiperidin-4-il)amino]fenil]benzolsulfonamīda,  
 N-[4-brom-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 N-[4-etoksi-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 N-[4-trifluormetil-3-(piperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-fluor-N-[4-fluor-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-fluor-N-[4-metoksi-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-brom-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-etoksi-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-izopropil-N-[4-trifluormetoksi-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-izopropil-N-[4-hlor-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-brom-N-[4-hlor-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-brom-N-[3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-brom-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metoksi-N-[4-brom-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metoksi-N-[4-trifluormetil-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2,4-dihlor-N-[4-metoksi-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2,4-dihlor-N-[4-brom-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-trifluormetoksi-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-hlor-N-[4-hlor-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-hlor-N-[4-hlor-3-(1-metilpiperidin-4-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 2-metoksi-N-[4-trifluormetil-3-(piperidin-1-ilamino)fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-hlor-3-[N-metil-N-(4-metilpiperidin-1-il)amino]fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-metoksi-3-[N-metil-N-(4-metilpiperidin-1-il)amino]fenil]benzolsulfonamīda,  
 4-metil-N-[4-fluor-3-[N-metil-N-(piperidin-1-il)amino]fenil]benzolsulfonamīda un  
 4-metil-N-[4-trifluormetil-3-[N-metil-N-(piperidin-1-il)amino]fenil]benzolsulfonamīda,  
 un tā tautomērās formas, tā stereoizomēri, tā polimorfī, tā farmaceutiski pieņemami sāļi un solvāti.

3. Metode savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (II)



pakļaušanu reakcijai ar piperidin-4-ona atvasinājumiem, izmantojot piemērotu reducējošu reagentu un bāzi piemērota šķīdinātāja klātbūtnē istabas temperatūrā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (I), turklāt visi aizvietotāji ir, kā definēts 1. pretenzijā.

4. Metode savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (III)



pakļaušanu reakcijai ar arilsulfonilhlorīda atvasinājumiem piemērota šķīdinātāja klātbūtnē istabas temperatūrā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (I), turklāt visi aizvietotāji ir, kā definēts 1. pretenzijā.

5. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām vai farmaceutiski pieņemamu nesēju, atšķaidītāju, bāzes vielu (*recipient*) vai solvātu kopā ar savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju, tā stereoizomēru, tā polimorfu, tā farmaceutiski pieņemamu sāļu, tā farmaceutiski pieņemama solvāta vai jebkuras derīgas iepriekš minēto formu kombinācijas terapeitiski efektīvu daudzumu.

6. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kas satur vienu vai vairākas papildu aktīvās sastāvdaļas, kas izvēlētas no grupas, kas sastāv no *beta*-sekretāzes inhibitoriem, *gamma*-sekretāzes inhibitoriem, amiloīdu agregācijas inhibitoriem, tiešas vai netiešas iedarbības neiroprotektīviem savienojumiem, antioksidantiem, pretiekaisuma līdzekļiem, HMG-CoA reduktāzes inhibitoriem, acetilholīnesterāzes inhibitoriem, NMDA receptoru antagonistiem, AMPA agonistiem, savienojumiem, kas modulē neirotransmiteru atbrīvošanu vai koncentrāciju, savienojumiem, kas stimulē augšanas hormonu atbrīvošanu, CB1 receptora antagonistiem vai pretējas iedarbības (inversiem) agonistiem, antibiotikām, PDE-IV un PDE-IX inhibitoriem, GABAA pretējas iedarbības (inversiem) agonistiem, nikotīna agonistiem, histamīna H3 antagonistiem, 5-HT<sub>4</sub> agonistiem vai daļējiem agonistiem, 5-HT<sub>6</sub> antagonistiem, a2-adrenoreceptoru antagonistiem, muskarīna M1 agonistiem, muskarīna M2 antagonistiem, metabotropiem glutamāta receptora 5 pozitīviem modulatoriem.

7. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju, kas satur vienu vai vairākus papildu līdzekļus, kas ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no Alzhemed™, E vitamīna, ginkgoīda, donepezila, rivastigmīna, takrīna, galantamīna, memantīna, NS-2330, ibutamorēna mezilāta, kapromorelīna, minociklīna un rifampicīna.

8. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kas ir tabletes, kapsulas, pulvera, sūkājamas tabletes, svečīšu, sīrupa, šķīduma, suspensijas vai injicējamā formā, turklāt minētā forma tiek ievadīta vienas devas vai vairāku devu vienību veidā.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, klīnisku stāvokļu, kā piemēram, trauksmes, Alcheimera slimības, depresijas, konvulsīvu traucējumu, obsesīvi kompulsīvu traucējumu, migrēnas, galvassāpju, kognitīvu atmiņas traucējumu, uzmanības deficīta un hiperaktivitātes sindroma (ADHD), personības traucējumu, psihozes, parafrēnijas, psihotiskas depresijas, Pārkinsona slimības, mānijas, šizofrēnijas, panikas traucējumu un miega traucējumu ārstēšanai un/vai profilaksei.

10. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, klīnisku stāvokļu, kā piemēram, abstinences sindroma, triekas, galvas traumas, vieglas izziņāšanas spējas vājināšanās, neirodeģeneratīvu traucējumu, gastrointestinālas saslimšanas un aptaukošanās ārstēšanai un/vai profilaksei.

11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kas papildus satur 5-HT<sub>6</sub> atpakaļsaistes inhibitora, melatonīna, melatonīnerģiska modulatora vai tā farmaceutiski pieņemama sāls terapeitiski efektīvu daudzumu.

12. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai par medikamentu tādu centrālās nervu sistēmas traucējumu ārstēšanā, kas saistīti ar 5-HT<sub>6</sub> receptoru vai kurus tas ietekmē.

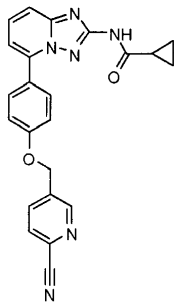
13. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētie traucējumi ir trauksme, Alcheimera slimība, depresija, konvulsīvi traucējumi, obsesīvi kompulsīvi traucējumi, migrēna, galvassāpes, kognitīvi atmiņas traucējumi, uzmanības deficīta un hiperaktivitātes sindroms (ADHD), personības traucējumi, psihoze, parafrēnija, psihotiska depresija, Pārkinsona slimība, mānija, šizofrēnija, panikas traucējumi un miega traucējumi.

14. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt minētie traucējumi ir abstinences sindroms, trieka, galvas trauma, viegla

izzināšanas spējas vājināšanās, neirodeģeneratīvi traucējumi, gastrointestināla saslimšana un aptaukošanās.

15. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais savienojums ir radioiezīmēts.

- (51) **C07D 471/04**<sup>(200601)</sup> (11) **2346864**  
**A61K 31/437**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 19/02**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09781073.3 (22) 24.07.2009  
(43) 27.07.2011  
(45) 06.03.2013  
(31) 135920 (32) 25.07.2008 (33) US  
220685 26.06.2009 US  
(86) PCT/EP2009/059605 24.07.2009  
(87) WO2010/010191 28.01.2010  
(73) Galapagos N.V., Industriepark Mechelen Noord, Generaal De Wittelaan L11 A 3, 2800 Mechelen, BE  
(72) MENET, Christel Jeanne Marie, BE  
BLANC, Javier, BE  
(74) Sagittarius IP, Three Globeside, Fieldhouse Lane, Marlow, Buckinghamshire SL7 1HZ, GB  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **JAUNI SAVIENOJUMI, KAS LIETOJAMI DEĢENERATĪVU UN IEKAIŠUMA SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**  
**NOVEL COMPOUNDS USEFUL FOR THE TREATMENT OF DEGENERATIVE AND INFLAMMATORY DISEASES**  
(57) 1. Savienojums saskaņā ar formulu (VIa):



VIa

vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

2. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceitiski pieņemamu nesēju un savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju farmaceitiski efektīvu daudzumu.

3. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana medicamenta ražošanā.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju izmantošanai, kas paredzēta slimību, kuras saistītas ar skrimšļa degradāciju, kaulu un/vai locītavu degradāciju, piemēram, osteoartrītu, un/vai saslimšanu, kas saistītas ar iekaisumu vai imūnreakcijas traucējumiem, piemēram, Krona slimības, reimatoīdā artrīta, psoriāzes, alerģisku elpceļu slimību (piemēram, astmas, rinīta), juvenīlā idiopātiskā artrīta, kolīta, zarnu iekaisuma slimību, slimību, ko izraisa endotoksīnu iedarbība (piemēram, komplikāciju pēc šuntēšanas operācijas vai sistemātiskas endotoksīnu iedarbības, piemēram, hroniskas sirds mazspējas), locītavu slimību (piemēram, slimību, kas saistītas ar hondrocītu anabolisko stimulāciju), iedzimtu skrimšļu anomāliju, slimību, kas saistītas ar IL6 sekrēciju un transplantācijas atgrūšanu (piemēram, orgānu transplantāta atgrūšanu), ārstēšanai vai profilaksei.

5. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju vai farmaceitiskas kompozīcijas saskaņā ar 2. pretenziju izmantošana proliferatīvo slimību ārstēšanā vai profilaksē.

6. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts slimību, kas saistītas ar skrimšļa degradāciju, kaulu un/vai locītavu degradāciju, piemēram, osteoartrītu, un/vai saslimšanu, kas saistītas ar iekaisumu vai imūnreakcijas traucējumiem, piemēram, Krona slimības, reimatoīdā artrīta, psoriāzes, alerģisku elpceļu slimību (piemēram, astmas,

rinīta), juvenīlā idiopātiskā artrīta, kolīta, zarnu iekaisuma slimību, slimību, ko izraisa endotoksīnu iedarbība (piemēram, komplikāciju pēc šuntēšanas operācijas vai sistemātiskas endotoksīnu iedarbības, piemēram, hroniskas sirds mazspējas), locītavu slimību (piemēram, slimību, kas saistītas ar hondrocītu anabolisko stimulāciju), iedzimtu skrimšļu anomāliju, slimību, kas saistītas ar IL6 sekrēciju un transplantācijas atgrūšanu (piemēram, orgānu transplantāta atgrūšanu), ārstēšanai vai profilaksei.

7. Savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts slimību ārstēšanai vai profilaksei.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kas satur vienu vai vairākas citas aktīvas vielas.

9. Savienojums saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju izmantošanai kombinācijā ar vienu vai vairākām citām aktīvām vielām.

10. Izmantošana saskaņā ar jebkuru – 3., 6. vai 7. pretenziju, kur medikaments ir paredzēts ievadīšanai ar vienu vai vairākām citām aktīvām vielām.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, savienojums saskaņā ar 9. pretenziju vai izmantošana saskaņā ar 10. pretenziju, kur viena vai vairākas citas aktīvās vielas ir terapeitisks līdzeklis, kas paredzēts slimību, kas saistītas ar iekaisumu, artrītu, proliferatīvo slimību, autoimūno slimību, transplantāta atgrūšanas, astmas un/vai rinīta un/vai hroniskās obstruktīvās plaušu slimības (COPD), zarnu iekaisuma slimības (IBD), sistēmiskās sarkanās vilkēdes (SLE) vai psoriāzes, ārstēšanai vai profilaksei.

12. Farmaceutiska kompozīcija, savienojums vai izmantošana saskaņā ar 11. pretenziju, kur viena vai vairākas citas aktīvās vielas ir terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti iekaisuma slimību ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no līdzekļiem ar imūnregulējošu iedarbību, piemēram, azatioprīns, kortikosteroīdi (piemēram, prednizolons vai deksametazons), ciklosporīns, ciklosporīns A, takrolīms, mikofenolāta mofetils, muromonabs-CD3 (OKT3), ATG, aspirīns, acetaminofēns, ibuprofēns, naproksēns un piroksikāms; terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti artrīta ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no analgētiķiem, nesteroidiem pretiekaisuma līdzekļiem (NSAIDS), steroidiem, sintētiskajiem DMARDS (piemēram, metotreksāta, leflunomīda, sulfasalazīna, auranofīna, nātrija aurotiomalāta, penicilamīna, hlorokvīna, hidroksihlorokvīna, azatioprīna un ciklosporīna) un bioloģiskajiem DMARDS (piemēram, infliksimaba, etanercepta, adalimumaba, rituksimaba un abatacepta); terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti slimību ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no metotretsāta, leikovorīna, adriamīcīna, prednizona, bleomicīna, ciklofosfamīda, 5-fluoruracila, paklitaksela, docetaksela, vinkristīna, vinblastīna, vinorelbīna, doksorubicīna, tamoksifēna, toremifēna, megestrola acetāta, anastrozola, goserelīna, anti-HER2 monoklonālajām antivielām, kapecitabīna, raloksifēna hidrohlorīda, EGFR inhibitoriem, VEGF inhibitoriem, proteasomu inhibitoriem un hsp90 inhibitoriem (piemēram, 17-AAG); terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti autoimūno slimību ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no glikokortikoidiem, citostatiskajiem līdzekļiem (piemēram, purīna analogiem), alkilējošiem līdzekļiem (piemēram, slāpekļa mustarda (ciklofosfamīda), nitrozoetilurīnvielas un platīna savienojumiem), antimetabolītiem (piemēram, metotreksāta, azatioprīna un merkaptopurīna), citotoksiskajām antibiotikām (piemēram, daktinomicīna, antraciklīna, mitomicīna C, bleomicīna un mitramicīna), antivielām (piemēram, anti-CD20, anti-CD25 vai anti-CD3 (OKT3) monoklonālajām antivielām), ciklosporīna, takrolīma, rapamicīna (sirolīma), interferona (piemēram, IFN-β), TNF saistošajiem proteīniem (piemēram, infliksīma, etanercepta vai adalimumaba), mikofenolāta, fingolimoda un miriocīna; terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti transplantāta atgrūšanas ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no kalcineīna inhibitoriem (piemēram, ciklosporīna vai takrolīma (FK506)), mTOR inhibitoriem (piemēram, sirolīma, everolīma), antiproliferatīvajiem līdzekļiem (piemēram, azatioprīna, mikofenolskābes), kortikosteroīdiem (piemēram, prednizolona, hidrokortizona), antivielām (piemēram, monoklonālajām anti-IL-2Rα receptora antivielām, baziliksīmaba, daklizumaba) un poliklonālajām anti-T-šūnu antivielām (piemēram, antitimocīta globulīna (ATG), antiilmocīta globulīna (ALG)); terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti astmas un/vai rinīta, un/vai hroniskās obstruktīvās plaušu slimības (COPD) ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no beta<sub>2</sub>-adrenoceptoru agonistiem (piemēram, salbutamola, levalbuterola, terbutalīna un bitolterola), epinefrīna (inhalējama vai tabletēs), antiholinēriskajiem līdzekļiem (piemēram, ipratropija bromīda), glikokortikoidiem (perorālai lietošanai vai inhalējamiem), ilgstošas iedarbības

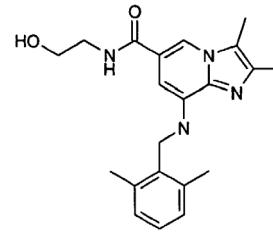
$\beta_2$ -agonistiem (piemēram, salmeterola, formoterola, bambuterola un perorālai lietošanai lēnas atbrīvošanas albuterola), kombinācijas no inhalējamiem steroidiem un ilgstošas iedarbības bronhodilatatoriem (piemēram, flutikazona/salmeterola, budesonīda/formoterola), leikotriēnu antagonistiem un sintētiskajiem inhibitoriem (piemēram, montelukasta, zafirlukasta un zileitona), mediatora atbrīvošanas inhibitoriem (piemēram, kromoglikāta un ketotifēna), IgE atbildes reakcijas bioloģiskajiem regulatoriem (piemēram, omalizumaba), antihistamīniem (piemēram, ceterizīna, cinnarizīna, feksofenadīna) un vazokonstriktoriem (piemēram, oksimetazolīna, ksilometazolīna, nafazolīna un tramazolīna; terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti zarnu iekaisuma slimību (IBD) ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no glikokortikoīdu (piemēram, prednizona, budesonīda) sintēzes slimību modificējošiem, imūnomodulējošiem līdzekļiem (piemēram, metotreksāta, leflunomīda, sulfasalazina, mesalazīna, azatioprīna, 6-merkaptopurīna un ciklosporīna) un slimības bioloģiskajiem modificējošiem, imūnomodulējošiem līdzekļiem (infliksimaba, adalimumaba, rituksimaba un abatacepta); terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti sistēmiskās sarkanās vilkēdes (SLE) ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no slimības modificējošām antireimatisķajām zālēm (DMARDs), piemēram, antimalārijas zālēm (piemēram, plakvenīla, hidroksihlorokvīna), imūndepresantiem (piemēram, metotreksāta un azatioprīna), ciklofosfamīda un mikofenolskābes, imunitāti nomācošām zālēm un analgētiķiem, piemēram, nesteroīdām pretiekaisuma zālēm, opiātiem (piemēram, dekstropropoksifēna un ko-kodamola), opioīdiem (piemēram, hidrokodona, oksikodona vai metadona) un *Duragesic* fentanila transdermāliem plāksteriem; vai terapeitiski līdzekļi, kas paredzēti psoriāzes ārstēšanai vai profilaksei un ir izvēlēti no vietējās ārstēšanas līdzekļiem, piemēram, vannas šķīdumiem, mitrinātājiem, ārstnieciskiem krēmiem un ziedēm, kuras satur akmeņogļu darvu, ditranola (antralīna), kortikosteroīdiem, tādiem kā dezoksimetazons, fluocinonīda,  $D_3$  vitamīna analogiem (piemēram, kalcipotriola), argana eļļas un retinoīdiem (etretināta, acitretīna, tazarotēna), sistēmiskās terapijas līdzekļiem, tādiem kā metotreksāta, ciklosporīna, retinoīdiem, tioguanīna, hidroksiurīnvielas, sulfasalazīna, mikofenolāta mofetila, azatioprīna, takrolīma, fumārskābes estieriem un bioloģiskajiem līdzekļiem, tādiem kā ustekinumabs (IL-12 un IL-23 blokatori).

kur R ir  $-CH_2COOH$  vai  $-COOH$ .

2. Aizvietotais imidazo[1,2-a]piridīns saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (I) ir 5-{2-[(8-[(2,6-dimetilbenzil)amino]-2,3-dimetilimidazo[1,2-a]piridīn-6-il)karbonil)amino]etoksi}-5-oksopentānskābe, vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

3. Aizvietotais imidazo[1,2-a]piridīns saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (I) ir 4-{2-[(8-[(2,6-dimetilbenzil)amino]-2,3-dimetilimidazo[1,2-a]piridīn-6-il)karbonil)amino]etoksi}-4-oksobutānskābe, vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

4. Paņēmiens aizvietota imidazo[1,2-a]piridīna saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka 2,3-dimetil-8-(2,6-dimetilbenzilamino)-N-hidroksietil-imidazo[1,2-a]piridīn-6-karbonskāme ar formulu (II)



II

tiek pakļauts reakcijai ar anhidrīdu, kas izvēlēts no glutārskābes anhidrīda un dzintarskābes anhidrīda šķīdinātājā temperatūras intervālā starp 40 un 130°C.

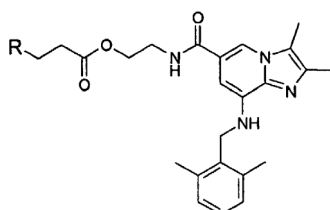
5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka šķīdinātājs ir izvēlēts no virknes: dimetilformamīds, dimetilacetamīds, N-metilpirolidons, tetrahidrofurāns, cikliskie ketoni un alicikliskie ketoni.

6. Paņēmiens saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka process tiek veikts zem spiediena, sākot ar atmosfēras spiedienu un līdz  $5 \times 10^2$  Kpa.

7. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver aizvietotu imidazo[1,2-a]piridīnu saskaņā ar 1. pretenziju kombinācijā ar farmaceitiski pieņemamu šķīdinātāju vai nesēju.

8. Aizvietota imidazo[1,2-a]piridīna saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts ar kuņģa skābi saistītu slimību, kuņģa un zarnu trakta iekaisuma slimību, simptomātiskas gastroezofageāla refluksa slimības (GERD), erozīva ezofagīta, peptiskas čūlas slimības, grēmu, atļiņa slimības, skābu atraugu un sliktas dūšas ārstēšanai un profilaksei.

- (51) **C07D 471/04**<sup>(200601)</sup> (11) **2365975**  
**A61K 31/437**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 1/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 1/04**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 1/06**<sup>(200601)</sup>  
(21) 09748823.3 (22) 27.10.2009  
(43) 21.09.2011  
(45) 13.03.2013  
(31) 20086158 (32) 03.12.2008 (33) FI  
(86) PCT/FI2009/050861 27.10.2009  
(87) WO2010/063876 10.06.2010  
(73) Dahlström, Mikael, Kansjerfvägen 145 B, 10570 Bromarv, FI  
(72) DAHLSTRÖM, Mikael, FI  
(74) Mattsson, Niklas, et al, Awapatent AB, Drottninggatan 89, P.O. Box 45 086, 104 30 Stockholm, SE  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **IMIDAZOPIRIDĪNA ATVASINĀJUMI KUŅĢA SKĀBES SEKRĒCIJAS INHIBĒŠANAI**  
**IMIDAZOPYRIDINE DERIVATIVES WHICH INHIBIT THE SECRETION OF GASTRIC ACID**  
(57) 1. Aizvietotais imidazo[1,2-a]piridīns ar formulu (I) vai tā farmaceitiski pieņemams sāls



I

- (51) **B61D 3/10**<sup>(200601)</sup> (11) **2366599**  
**B61D 13/00**<sup>(200601)</sup>  
(21) 10380041.3 (22) 18.03.2010  
(43) 21.09.2011  
(45) 14.08.2013  
(73) Vossloh España S.A., Pol. Ind. del Mediterraneo-Mitxera, n° 6, 46550 Albuixech (Valencia), ES  
(72) ALBELDA, Ricardo, ES  
CALATAYUD, Angel, ES  
VARA, Jorge, ES  
PERIS, Carlos, ES  
REDONDO, Jose Carlos, ES  
(74) Feder Walter Ebert, Patentanwälte, Achenbachstrasse 59, 40237 Düsseldorf, DE  
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV  
(54) **SLIEŽU TRANSPORTLĪDZEKLIS, ĪPAŠI ZEMAS GRĪDAS TRANSPORTLĪDZEKLIS**  
**RAIL VEHICLE, IN PARTICULAR A LOW-FLOOR RAIL VEHICLE**

(57) 1. Sliežu transportlīdzeklis, īpaši zemas grīdas sliežu transportlīdzeklis, kas satur virsbūvi (2) ar daudziem sēdekļiem (3) un ratiņus (4), kas izvietoti zem virsbūves, pie kam ratiņus (4) piedzen motors (5), kas izvietots zonā starp diviem sēdekļiem (3), kas raksturīgs ar to, ka sēdekļu (3) aizmugures (3.1) ir vērstas savstarpēji viena otrai pretim un veido atstarpi, un ar to, ka



motors (5) vismaz daļēji ir novietots atstarpē starp sēdekļu (3) aizmugurēm (3.1)

2. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka motors (5) ir novietots virs riteņu agregātiem (6), un telpa (7) kāju izvietošanai zem sēdekļa plešas zonā starp riteņu agregātiem (6) transversāli ratiņu (4) pārvietošanās virzienam.

3. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ratiņi (4) satur ratiņu rāmi (8), kas satur divus longitudinālus atbalstus (9), pie kam motori (5) ir izvietoti uz longitudinālo atbalstu (9) augšējām virsmām (9.1).

4. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka riteņu agregāti (6) ir uzmontēti uz asu buksēm (13), kas ir izvietotas uz longitudinālajiem atbalstiem (9).

5. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka asu bukses (13) satur atspere mezglu virsbūves (2) atbrīvošanai no ciešas sasaistes.

6. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ratiņi (4) ir šarnīrveidīgi nostiprināti pie virsbūves (2) ar rotācijas (šūpošanās) iespēju ap rotācijas centru (P), kas atrodas ratiņu (4) priekšā vai aizmugurē attiecībā pret pārvietošanās virzienu.

7. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ratiņi (4) ar virsbūvi (2) ir savienoti ar divu savilkņu (14) palīdzību.

8. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka savilkņi (14) to pievienošanas zonā ir elastīgi savienoti ar ratiņiem (4) un/vai to pievienošanas zonā ir elastīgi savienoti ar virsbūvi (2).

9. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ratiņu (4) rotāciju ierobežo aizturi (15).

10. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka motori (5) ir izvietoti virs riteņu agregātiem (6) un ir savienoti ar riteņu agregātiem (6) caur transmisijas mezglu (16), kas būtībā stiepjas vertikāli.

11. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka transmisijas mezgls (16) satur līdzekļus, kas kompensē riteņu agregāta (6) kustību pirmajā atspere mezglā.

12. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētie līdzekļi ir izveidoti kā elastīgs savienošais posms (sajūgs), vislabāk kā tāds posms, kas satur elastīgas gumijas materiālu.

13. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka divas blakus esošas virsbūves (2) ir savienotas viena ar otru ar augšējās slāpēšanas ierīces (100) un apakšējās svārstību slāpēšanas ierīces (120) palīdzību.

14. Sliežu transportlīdzeklis saskaņā ar 13. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka augšējā svārstību slāpēšanas ierīce (100) satur svārstību slāpētāju (101), kas stiepjas diagonāli attiecībā pret transportlīdzekļa longitudinālo virzienu.

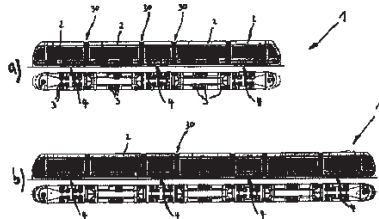


Fig. 1

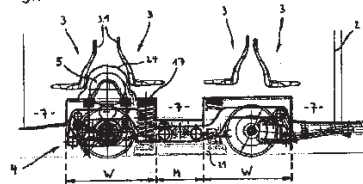


Fig. 2

(51) **A61K 9/20**<sup>(200601)</sup> (11) **2367539**  
**A61K 47/10**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/60**<sup>(200601)</sup>

(21) 09764826.5 (22) 04.12.2009  
 (43) 28.09.2011  
 (45) 05.06.2013  
 (31) 70708 U (32) 05.12.2008 (33) AT  
 (86) PCT/EP2009/066405 04.12.2009  
 (87) WO2010/063824 10.06.2010  
 (73) AOP Orphan Pharmaceuticals AG, Wilhelminenstrasse 91/II f, 1160 Vienna, AT  
 (72) WIDMANN, Rudolf, AT  
 (74) Loidl, Manuela Bettina, et al, REDL Life Science Patent Attorneys, Donau-City-Straße 1, 1220 Wien, AT  
 Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga LV-1083, LV  
 (54) **JAUNA KOMPOZĪCIJA ESENCIĀLĀS TROMBOCITĒMIJAS ĀRSTĒŠANAI**  
**NOVEL COMPOSITION FOR TREATMENT OF ESSENTIAL THROMBOCYTHEMIA**

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija tabletes vai kapsulas formā, kas satur anagrelīda daļiņas, povidonu, krosopovidonu, mikrokristāliisku celulozi, magnija stearātu un vismaz 60 mg laktozes monohidrāta, kur vismaz 90 % no minētām anagrelīda daļiņām ir mazākas par 10 µm diametrā.

2. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur anagrelīdu mazāk nekā 1 mg, vēlams mazāk nekā 0,70 mg, vēl labāk mazāk nekā 0,65 mg, vēlams starp 0,54 un 0,60 mg, vēlams 0,57 mg daudzumā.

3. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 2. pretenzijai, kas satur vismaz 60 mg, vēlams vismaz 90 mg, vēl labāk 93,9 mg laktozes monohidrāta.

4. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 3. pretenzijai, kur anagrelīda daļiņu vidējais lielums ir aptuveni 5 µm.

5. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 4. pretenzijai, kas satur no 4 līdz 13 mg povidona, vēlams daudzumā no 5,5 līdz 6,6 mg, labāk 6 mg daudzumā.

6. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 5. pretenzijai, kas satur no 3,5 līdz 13 mg krosopovidona, vēlams daudzumā no 5,5 līdz 6,6 mg, vēl labāk 5,5 mg daudzumā.

7. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 6. pretenzijai, kas satur mikrokristāliisku celulozi.

8. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kas satur vismaz 15 mg, vēlams vismaz 20 mg, vēl labāk vismaz 22,5 mg mikrokristāliiskas celulozes.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 8. pretenzijai, kas satur farmaceutiski pieņemamus nesējus, vēlams izvēlētos no grupas, kas sastāv no krosopovidona, povidona, un magnija stearāta.

10. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar vienu no 1. līdz 9. pretenzijai, kuras maksimālā koncentrācija plazmā tiek sasniegta vismaz 60 minūtes pēc perorālas ievadīšanas.

11. Farmaceutiskā kompozīcija, kas satur 0,57 mg anagrelīda HCl, 93,9 mg laktozes monohidrāta, 6 mg povidona, 5,5 mg krosopovidona, 22,5 mg mikrokristāliiskas celulozes un 1,5 mg magnija stearāta.

12. Farmaceutiskās kompozīcijas lietošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai medikamentos vai preparātos, kas paredzēti esenciālās trombocitēmijas ārstēšanai.

13. Farmaceutiskā kompozīcija, kas paredzēta lietošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai esenciālās trombocitēmijas ārstēšanai.

(51) **H04W 72/12**<sup>(200901)</sup> (11) **2378828**  
 (21) 11159221.8 (22) 22.03.2011  
 (43) 19.10.2011  
 (45) 08.05.2013  
 (31) 316134 P (32) 22.03.2010 (33) US  
 352164 P 07.06.2010 US  
 352623 P 08.06.2010 US  
 (73) Samsung Electronics Co., Ltd., 129, Samsung-ro Yeongtong-gu, Suwon-si, Gyeonggi-do, 443-742, KR  
 (72) PAPASAKELLARIOU, Aris, KR  
 KIM, Young-Bum, KR



(74) van Westenbrugge, Andries, Nederlandsch Octrooibureau, J.W. Frisolaan 13, 2517 JS Den Haag, NL  
 Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **MULTIPLESĒŠANAS VADĪBAS UN DATU INFORMĀCIJA NO LIETOTĀJA APRĪKOJUMA FIZISKĀ DATU KANĀLĀ**  
**MULTIPLEXING CONTROL AND DATA INFORMATION FROM A USER EQUIPMENT IN A PHYSICAL DATA CHANNEL**

(57) 1. Metode apliecinājuma informācijas pārraidīšanai no lietotāja aprīkojuma (*User Equipment, UE*) uz bāzes staciju, atbildot uz vismaz viena transporta bloka (*Transport Block, TB*) saņemšanu vismaz vienā piešķirtajā nesējā starp N-tajiem piešķirtajiem nesējiem (610, 612, 614, 720, 722, 724), pie kam katram piešķirtajam nesējam caur bāzes staciju UE arī tiek piešķirts attiecīgais pārraides režīms (*Transmission Mode, TM*), kas nosaka maksimālo TB skaitu, ko UE var saņemt fiziskā lejuplīnijas koplietošanas kanālā (*Physical Downlink Shared Channel, PDSCH*), kad tas tiek pārraidīts ar bāzes stacijas palīdzību attiecīgajā piešķirtajā nesējā, pie tam apliecinājuma informācija kopā ar datu informāciju tiek pārraidīta fiziskajā lejuplīnijas koplietošanas kanālā PDSCH, un metode ietver šādus soļus:

N + M apliecinājuma bitu (620, 622, 624, 730, 732) ģenerēšanu, izmantojot UE;  
 N + M apliecinājuma bitu pasūtīšanu atslēgvārdā, izmantojot UE, saskaņā ar piešķirto nesēju secību, un atslēgvārda šifrēšanu un pārraidīšanu, pie tam M ir piešķirto nesēju skaits, un UE tiek piešķirts TM, kas ļauj saņemt maksimāli 2 TB (610, 614, 720, 724), un pie kam N-M ir piešķirto nesēju skaits, un UE tiek piešķirts TM, kas ļauj saņemt 1 TB (612, 722).

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam bāzes stacija caur radio resursu vadības signalizāciju piešķir nesējus (610, 612, 614, 720, 722, 724), TM katram nesējam un secību piešķirtajiem nesējiem.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam PDSCH tiek saņemts tikai piešķirto nesēju (720, 722) apakškopā.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam PDSCH, kas pārnes vienu TB, tiek saņemts piešķirtajā nesējā, un UE aparātam tiek piešķirts TM, kas ļauj saņemt 2 TB.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam atbilstoši otrajam TB no 2 TB apliecinājuma informācijas tiek ģenerēts negatīvs apliecinājums.

6. Lietotāja aprīkojuma (*User Equipment, UE*) aparāts apliecinājuma informācijas pārraidīšanai, pie kam UE aparātam caur bāzes staciju tiek piešķirti vairāki nesēji N (610, 612, 614, 720, 722, 724) un katram nesējam ir paredzēts pārraides režīms (*Transmission Mode, TM*), pie kam TM nosaka maksimālo transporta bloku (*Transport Block, TB*) skaitu, kuru UE aparāts var saņemt attiecīgā fiziskā lejuplīnijas koplietošanas kanālā (*Physical Downlink Shared Channel, PDSCH*), kas ar bāzes stacijas palīdzību pārraidīti piešķirtajā nesējā, pie kam apliecinājuma informācija atbild par vismaz viena TB saņemšanu vismaz vienā piešķirtajā nesējā un tiek nosūtīta kopā ar datu informāciju fiziskajā lejuplīnijas koplietošanas kanālā PDSCH, pie kam aparāts satur:

N + M apliecinājuma bitu (620, 622, 624, 730, 732) ģeneratoru; izlīdzināšanas bloku N + M apliecinājuma bitu sakārtošanai atslēgvārdā saskaņā ar piešķirto nesēju secību;

kodētāju N + M apliecinājuma bitu atslēgvārda kodēšanai un raidītāju apliecinājuma informācijas un datu informācijas pārraidīšanai,

pie kam M ir piešķirto nesēju skaits, UE aparātam tiek piešķirts TM, kas ļauj saņemt 2 TB (610, 614, 720, 724), N-M ir piešķirto nesēju skaits un UE aparātam tiek piešķirts TM, kas ļauj saņemt 1 TB (612, 722).

7. UE aparāts saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam bāzes stacija caur radio resursu vadības signalizāciju piešķir nesējus (610, 612, 614, 720, 722, 724), TM katram nesējam un secību piešķirtajiem nesējiem.

8. UE aparāts saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam PDSCH tiek uzņemts tikai piešķirto nesēju (720, 722) apakškopā.

9. UE aparāts saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam PDSCH, kas pārnes vienu TB, tiek uzņemts piešķirtajā nesējā, kur UE aparātam ir piešķirts TM, kas ļauj saņemt 2 TB.

10. UE aparāts saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam atbilstoši otrajam TB no 2 TB apliecinājuma informācijas tiek ģenerēts negatīvs apliecinājums.

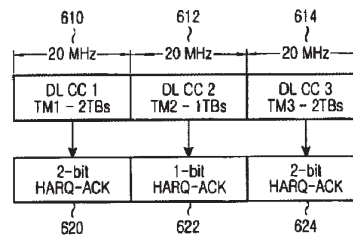
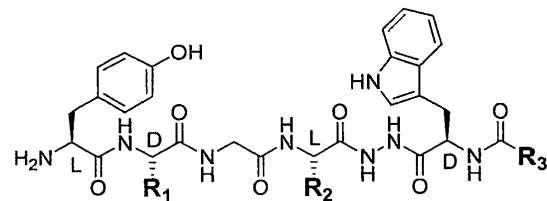


FIG.6

- (51) **C07K 5/107**<sup>(200601)</sup> (11) **2384334**  
**A61K 38/07**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 25/04**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 08876250.5 (22) 31.12.2008  
 (43) 09.11.2011  
 (45) 27.02.2013  
 (86) PCT/PL2008/000099 31.12.2008  
 (87) WO2010/077154 08.07.2010  
 (73) Action For Development of Research Sp. z o.o., ul. Generala Zajaczka 28, 01-510 Warszawa, PL  
 (72) LIPKOWSKI, Andrej, PL  
 (74) Witek, Rafal, WTS Witek Czernicki Sniezko Patent Attorneys, ul. Rudolfa Weigla 12, 53-114 Wroclaw, PL  
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
 (54) **PAŅĒMIENS JAUNA OPIOĪDU PEPTĪDA IEGŪŠANAI**  
**A METHOD OF PRODUCING A NOVEL OPIOID PEPTIDE**  
 (57) 1. Savienojums ar vispārējo formulu:



- kur:
- L, D apzīmē piemērotu aminoskābju hirālītāti;
  - R<sub>1</sub> ir aminoskābju sānu ķēde, kas ir izvēlēta no: D-alanīna, D-leicīna, D-arginīna, D-lizīna, D-serīna vai D-treonīna;
  - R<sub>2</sub> ir aminoskābju sānu ķēde, kas ir izvēlēta no L-fenilalanīna vai L-triptofāna;
  - -CO-R<sub>3</sub> apzīmē benziloksikarbonilgrupu vai cinnamoilgrupu, alfa-metil-4-(2-metilpropil)benzoacetilgrupu, salicil-glicilgrupu, benzoil-glicilgrupu, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ir izvēlēts no:
- (N'-tirozil-D-alanil-glicil-fenilalanīna, N''-benziloksikarbonil-D-triptofanil)hidrazīda vai no tā sāls, it īpaši, hidrohlorīda;
  - (N'-tirozil-D-alanil-glicil-fenilalanīna, N'-salicil-glicil-D-triptofanil)hidrazīda vai no tā sāls, it īpaši, hidrohlorīda;
  - (N'-tirozil-D-alanil-glicil-fenilalanīna, N''-alfa-metil-4-(2-metilpropil)benzoacetil-D-triptofanil)hidrazīda vai no tā sāls, it īpaši, hidrohlorīda;
3. Savienojuma saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju izmantošana pretsāpju zāļu līdzekļa iegūšanai.

- (51) **H04L 27/26**<sup>(200601)</sup> (11) **2385669**  
**H04L 27/34**<sup>(200601)</sup>  
**H04L 1/00**<sup>(200601)</sup>  
**H04L 5/00**<sup>(200601)</sup>

- (21) 11165281.4 (22) 03.06.2009  
 (43) 09.11.2011  
 (45) 21.08.2013  
 (31) 150325 P (32) 06.02.2009 (33) US  
 (62) EP09161861.1 / EP2216951  
 (73) LG Electronics Inc., 20, Yeouido-Dong Yeongdeungpo-Gu, Seoul 150-721, KR  
 (72) KO, Woo Suk, KR  
 MOON, Sang Chul, KR  
 HONG, Ho Taek, KR  
 (74) Cabinet Plasseraud, 52, rue de la Victoire, 75440 Paris Cedex 09, FR  
 Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV  
 (54) **APARĀTS SIGNĀLA PĀRRAIDĪŠANAI UN UZTVERŠANAI UN PAŅĒMIENS SIGNĀLA PĀRRAIDĪŠANAI UN UZTVERŠANAI**  
**APPARATUS FOR TRANSMITTING AND RECEIVING A SIGNAL AND METHOD OF TRANSMITTING AND RECEIVING A SIGNAL**  
 (57) 1. Aparāts plašsaziņas signāla pārraidīšanai, pie kam aparāts satur:  
 - pirmo BHC kodētāju (702-L1), kas ir konfigurēts, lai kodētu slāņa 1 (L1) signalizācijas datus, izmantojot BHC-kodu (t.i., Bouza-Hokenhema-Čoudhuri kodu);  
 - pirmo LDPC kodētāju (702-L1), kas ir konfigurēts, lai izmantotu LDPC kodu, kodētu ar BHC kodu kodētos slāņa L1 signalizācijas datus un ģenerētu vismaz vienu LDPC pārbas bitu;  
 - caurumošanas līdzekli, kas ir konfigurēts, lai veiktu caurumošanu ģenerētajā LDPC pārbas bitā (kodēšanas teorijā caurumošana apzīmē dažu pārbas bitu aizvākšanu pēc kodēšanas ar kļūdu korekcijas kodu);  
 - pirmo bitu kompresētāju (703-L1), kas ir konfigurēts bitu kompresēšanai ar LDPC kodu kodētajos slāņa L1 signalizācijas datos, kuros ir veikta caurumošana;  
 - pirmo demultipleksētāju (305-1), kas ir konfigurēts, lai demultipleksētu par šūnu vārdiem slāņa L1 signalizācijas datu kompresētos bitus;  
 - pirmo QAM kartētāju (306-1), kas ir konfigurēts demultipleksēto slāņa 1 signalizācijas datu kartēšanai konstelācijas vērtībās, un  
 - pirmo kompresētāju (1008-L1) pēc laika, kurš ir konfigurēts, lai pēc laika kompresētu konstelācijas vērtībās kartētos slāņa L1 signalizācijas datus, kompresēšanu pēc laika veicot noteiktā dziļumā,  
 kas raksturīgs ar to, ka slāņa L1 signalizācijas dati ietver informāciju par pārrāvuma sākšanās lauku, kas norāda izraisītā pārrāvuma sākšanās zonas pozīciju, pie kam bitu skaits, kas tiek izmantots priekš pārrāvuma sākšanās informācijas lauka, mainās atkarībā no aizsardzības intervāla (Guard Interval, GI) lieluma.  
 2. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, kurš papildus satur atkārtosšanas moduli, kas ir konfigurēts, lai pievienotu slāņa L1 galveni pēc laika kompresētajiem slāņa L1 signalizācijas datiem, pie kam slāņa L1 galvene ietver informāciju par slāņa 1 kompresēšanu pēc laika, kas norāda kompresēšanas pēc laika dziļumu.  
 3. Aparāts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam informācija par kompresēšanu pēc laika papildus norāda, ka kompresēšana pēc laika nav veikta.  
 4. Paņēmiens plašsaziņas signāla pārraidīšanai, pie kam paņēmiens satur:  
 - slāņa 1 signalizācijas datu BHC kodēšanu;  
 - ar BHC kodu kodēto slāņa 1 signalizācijas datu LDPC kodēšanu, lai ģenerētu vismaz vienu LDPC pārbas bitu;  
 - ģenerēto LDPC pārbas bitu caurumošanu;  
 - ar LDPC kodu kodēto slāņa 1 signalizācijas datu, kuros tika veikta caurumošana, bitu kompresēšanu;  
 - slāņa 1 signalizācijas datu, kuros tika veikta bitu kompresēšana, demultipleksēšanu šūnu vārdos;  
 - demultipleksēto slāņa 1 signalizācijas datu kartēšanu konstelācijas vērtībās;  
 - konstelācijas-kartēšanas rezultātā iegūto slāņa 1 signalizācijas datu kompresēšanu pēc laika, to veicot noteiktā dziļumā,  
 kas raksturīgs ar to, ka slāņa 1 signalizācijas dati ietver informāciju par pārrāvuma sākšanās lauku, kas norāda izraisītā pārrāvuma sākšanās zonas pozīciju, pie kam bitu skaits, kas tiek izmantots

priekš pārrāvuma sākšanās informācijas lauka, mainās atkarībā no aizsardzības intervāla lieluma.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam tas papildus satur slāņa 1 galvenes pievienošanu pēc laika kompresētajiem slāņa 1 signalizācijas datiem, pie tam slāņa 1 galvene ietver informāciju par slāņa 1 kompresēšanu pēc laika, kas norāda kompresēšanas dziļumu pēc laika.

6. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam informācija par kompresēšanu pēc laika papildus norāda, ka kompresēšana pēc laika nav veikta.

7. Aparāts plašsaziņas signāla uztveršanai, kurš satur:

- dekompresētāju (r1010-L1) pēc laika, kas ir konfigurēts, lai slāņa 1 signalizācijas datus, kuri ir ietverti plašsaziņas signālā, kompresēšanu pēc laika veicot noteiktā dziļumā, dekompresētu pēc laika;

- QAM dekartētāju (r713-L1), kas ir konfigurēts konstelācijas vērtību dekartēšanai, kuras atbilst slāņa 1 signalizācijas datiem, šūnu vārdos;

- multipleksētāju, kas ir konfigurēts, lai multipleksētu konstelācijas-kartēšanas rezultātā iegūtos šūnu vārdus slāņa 1 signalizācijas datos;

- bitu dekompresētāju (r714-L1), kas ir konfigurēts bitu dekompresēšanai slāņa 1 multipleksētajos signalizācijas datos;

- decaurumošanas līdzekli, kas ir konfigurēts, lai veiktu decaurumošanu slāņa 1 signalizācijas datos, kas tika pakļauti bitu kompresēšanai;

- LDPC dekodētāju (r715-L1), kas ir konfigurēts slāņa 1 signalizācijas datu LDPC dekodēšanai, kuros tika veikta decaurumošana;

- BHC dekodētāju (r715-L1), kas ir konfigurēts, lai veiktu ar LDPC kodu dekodēto slāņa 1 signalizācijas datu BHC dekodēšanu,

kas raksturīgs ar to, ka slāņa L1 signalizācijas dati ietver informāciju par pārrāvuma sākšanās lauku, kas norāda izraisītā pārrāvuma sākšanās zonas pozīciju, pie kam bitu skaits, kas tiek izmantots priekš pārrāvuma sākšanās informācijas lauka, mainās atkarībā no aizsardzības intervāla lieluma.

8. Aparāts saskaņā ar 7. pretenziju, kurš papildus satur slāņa 1 galvenes izdalīšanas (ekstraģēšanas) moduli no slāņa 1 signalizācijas datiem, pie kam slāņa L1 galvene ietver informāciju par slāņa 1 kompresēšanu pēc laika, kas norāda kompresēšanas pēc laika dziļumu.

9. Aparāts saskaņā ar 7. pretenziju, pie kam informācija par kompresēšanu pēc laika papildus norāda, ka kompresēšana pēc laika nav veikta.

10. Paņēmiens plašsaziņas signāla uztveršanai, pie kam paņēmiens satur:

- slāņa 1 signalizācijas datu, kuri ir iekļauti plašsaziņas signālā, kompresēšanu pēc laika veicot noteiktā dziļumā, dekompresēšanu;

- konstelācijas vērtību, kuras atbilst slāņa 1 signalizācijas datiem, dekartēšanu šūnu vārdos;

- konstelācijas-kartēšanas rezultātā iegūto šūnu vārdu multipleksēšanu slāņa 1 signalizācijas datos;

- multipleksēto slāņa 1 signalizācijas datu bitu dekompresēšanu; decaurumošanas veikšanu slāņa 1 signalizācijas datos, kuri iepriekš tika pakļauti bitu dekompresēšanai;

- slāņa 1 signalizācijas datu, kuros tika veikta decaurumošana, dekodēšanu, izmantojot LDPC kodu, un

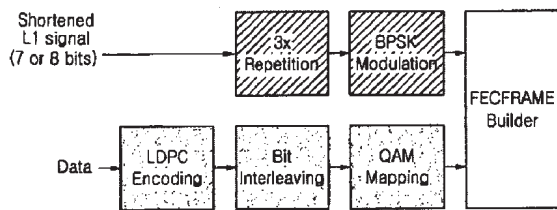
- ar LDPC kodu dekodēto slāņa 1 signalizācijas datu BHC dekodēšanu,

kas raksturīgs ar to, ka slāņa L1 signalizācijas dati ietver informāciju par pārrāvuma sākšanās lauku, kas norāda izraisītā pārrāvuma sākšanās zonas pozīciju, pie kam bitu skaits, kas tiek izmantots priekš pārrāvuma sākšanās informācijas lauka, mainās atkarībā no aizsardzības intervāla lieluma.

11. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, kurš papildus satur slāņa 1 galvenes izdalīšanu no slāņa 1 signalizācijas datiem, pie kam slāņa L1 galvene ietver informāciju par slāņa 1 kompresēšanu pēc laika, kas norāda kompresēšanas pēc laika dziļumu.

12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam informācija par kompresēšanu pēc laika papildus norāda, ka kompresēšana pēc laika nav veikta.

Fig. 77



- (51) **H04W 72/12<sup>(200901)</sup>** (11) **2385736**  
**H04L 5/00<sup>(200601)</sup>**
- (21) 11164705.3 (22) 04.05.2011
- (43) 09.11.2011
- (45) 22.05.2013
- (31) 331272 P (32) 04.05.2010 (33) US  
350890 P 02.06.2010 US  
354647 P 14.06.2010 US  
355941 P 17.06.2010 US  
201113096565 28.04.2011 US
- (73) Samsung Electronics Co., Ltd., 129, Samsung-ro Yeongtong-gu, Suwon-si, Gyeonggi-do, 443-742, KR
- (72) ZHANG, Charlie, KR  
NAM, Young Han, KR
- (74) van Westenbrugge, Andries, Nederlandsch Octrooibureau, J.W. Frisolaan 13, 2517 JS Den Haag, NL  
Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **PĀRRAIDES REŽĪMA NORĀDĪŠANA AUGŠUPSĀITES VADĪBAS INFORMĀCIJAI INDICATING THE TRANSMISSION MODE FOR UPLINK CONTROL INFORMATION**

(57) 1. Bāzes stacija (102), kas satur:  
pārraides trakta shēmu, kas ir konfigurēta, lai:  
izvēlētos pirmo augšupsaites vadības informācijas (UCI) multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai (111) ļauj vienlaicīgi pārraidīt fizisku augšupsaites koplietošanas kanālu (*Physical Uplink Shared Channel, PUSCH*) un fizisku augšupsaites vadības kanālu (*Physical Uplink Control Channel, PUCCH*), vai izvēlētos otru UCI multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai neļauj vienlaicīgi pārraidīt PUSCH un PUCCH;  
pārraidītu uz abonenta staciju (111) augstāka slāņa signālu, kas norāda vienu izvēlēto UCI multipleksēšanas metodi;  
pārraidītu uz abonenta staciju (111) vienu vai vairākas augšupsaites atļaujas, pie kam katra no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām augšupsaites komponenta nesējā (UL CC) ietilpst PUSCH, kas paredzēts apakškadram n pārraidei uz abonenta staciju (111), un katra no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām nes kanāla kvalitātes informācijas (CQI) pieprasījumu;  
- pie kam uztveršanas trakta shēma ir konfigurēta tā, lai saņemtu aperiodiska kanāla stāvokļa informācijas (CSI) atskaiti, kuru abonenta stacija (111) pārraida uz augšupsaites komponenta nesējā i esošo PUSCH, kad no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām tikai viena augšupsaites atļauja, kas augšupsaites komponenta nesējā i ietilpst PUSCH, pārnes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība,  
- pie kam, kad tajā pašā apakškadram n ir ietilpnota apliecinājuma (ACK)/negatīva apliecinājuma (NACK) informācija un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode, ACK/NACK informācija arī tiek pārraidīta ar abonenta staciju (111) uz PUSCH, kas tiek pārraidīts augšupsaites komponenta nesējā i.  
2. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam uztveršanas trakta shēma ir konfigurēta tā, lai no abonenta stacijas (111) pa PUSCH nesējā UL PCC saņemtu vismaz vienu ACK/NACK informāciju un periodisku CSI atskaiti, kad abonenta stacija (111) plāno pārraidīt vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām, kas augšupsaites komponenta nesējā i ietilpst PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam no vērtību kopas ir viena vērtība; un kad augšupsaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) vismaz viena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām ietilpst PUSCH.

3. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam uztveršanas trakta shēma ir konfigurēta tā, lai saņemtu tikai aperiodisku CSI atskaiti, kad aperiodiska CSI atskaiti ir ietilpnota tajā pašā apakškadram n, kurā periodiskā CSI atskaiti.

4. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam uztveršanas trakta shēma tiek konfigurēta tā, lai no abonenta stacijas (111) pa PUSCH nesējā UL PCC saņemtu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti, kad abonenta stacija (111) plāno pārraidīt vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām, kas augšupsaites komponenta nesējā i ietilpst PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; un kad augšupsaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) vismaz viena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām ietilpst PUSCH.

5. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam uztveršanas trakta shēma ir konfigurēta tā, lai no abonenta stacijas (111) pa PUSCH nesējā UL SCC saņemtu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti ar vismazāko UL CC skaitli, kad abonenta stacijā tiek ietilpnots pārraidīt vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad neviena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām, kas augšupsaites komponenta nesējā i ietilpst PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām augšupsaites sekundārā komponenta nesējā (UL SCC) ietilpst PUSCH; un kad neviena no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām augšupsaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) neietilpst PUSCH.

6. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam vērtību kopa satur '1', '01', '10' un '11'.

7. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam, kad no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām tikai viena augšupsaites atļauja, kas augšupsaites komponenta nesējā i ietilpst PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode, tad uztveršanas trakta shēma ir konfigurēta tā, lai primārā komponenta nesējā (PCC) esošais PUSCH saņemtu ACK/NACK informāciju.

8. Bāzes stacija (102) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam uztveršanas trakta shēma ir konfigurēta tā, lai pa PUSCH, kas pārraidīts augšupsaites komponenta nesējā i, saņemtu aperiodisku CSI atskaiti un ACK/NACK informāciju, kad no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām tikai viena augšupsaites atļauja, kas augšupsaites komponenta nesējā i ietilpst PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.

9. Metode bāzes stacijas (102) ekspluatācijai, pie kam metode ietver:

- izvēli starp pirmo augšupsaites vadības informācijas (UCI) multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai (111) ļauj vienlaicīgi pārraidīt fizisku augšupsaites koplietošanas kanālu (*Physical Uplink Shared Channel, PUSCH*) un fizisku augšupsaites vadības kanālu (*Physical Uplink Control Channel, PUCCH*), vai otro UCI multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai (111) neļauj vienlaicīgi pārraidīt PUSCH un PUCCH;

- augstāka slāņa signāla, kas norāda vienu izvēlēto UCI multipleksēšanas metodi, pārraidīšanu uz abonenta staciju (111);

- vienas vai vairāku augšupsaites atļauju pārraidīšanu uz abonenta staciju (111), pie kam katra no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām uz abonenta staciju (111) augšupsaites komponenta nesējā (UL CC) ietilpst PUSCH, kas paredzēts apakškadram n, un katra no vienas vai vairākām augšupsaites atļaujām nes kanāla kvalitātes informācijas (CQI) pieprasījumu;

- aperiodiskas kanāla stāvokļa informācijas (CSI) atskaites saņemšanu, kuru uz PUSCH pārraida abonenta stacija (111)



augšpusaites komponenta nesējā i, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno kanālu PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība,

pie kam, kad tajā pašā apakšskadrā n ir ielplānota apliecinājuma (ACK)/negatīva apliecinājuma (NACK) informācija un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode, tad ACK/NACK informācija arī tiek pārraidīta ar abonenta stacijas (111) palīdzību uz kanālu PUSCH, kas pārraidīts augšpusaites komponenta nesējā i.

10. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus ietver vismaz ACK/NACK informācijas vai periodiskas CSI atskaites saņemšanu no abonentu stacijas pa UL PCC esošo PUSCH, kad abonenta stacijā (111) tiek ielplānots pārraidīt vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; un kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) ielplāno PUSCH.

11. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kurā tiek uzņemta tikai aperiodiska CSI atskaiti, kad aperiodiska CSI atskaiti tiek ielplānota tajā pašā apakšskadrā n, kurā periodiskā CSI atskaiti.

12. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus ietver vismaz ACK/NACK informācijas vai periodiskas CSI atskaites saņemšanu no abonenta stacijas (111) pa UL PCC esošo PUCCH, kad abonentu stacijā tiek ielplānots pārraidīt vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; un kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) ielplāno PUSCH.

13. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus ietver vismaz ACK/NACK informācijas vai periodiskas CSI atskaites saņemšanu no abonenta stacijas (111) pa augšpusaites sekundārā komponenta nesējā (UL SCC) esošo PUSCH, kam ir vismazākais UL CC skaitlis, kad abonentu stacijā tiek ielplānots pārraidīt vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites sekundārā komponenta nesējā (UL SCC) ielplāno PUSCH, un kad neviena no viena vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) neielplāno PUSCH.

14. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam vērtību kopa ietver '1', '01', '10' un '11'.

15. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus ietver ACK/NACK informācijas saņemšanu primārā komponenta nesējā (PCC) esošajā kanālā PUCCH, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno kanālu PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.

16. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus ietver aperiodiskas CSI atskaites un ACK/NACK informācijas saņemšanu uz PUSCH, kas pārraidīts augšpusaites komponenta nesējā i, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.

17. Abonenta stacija (111), kas satur:

- uztveršanas trakta shēmu, kas ir konfigurēta, lai uzņemtu:
  - no bāzes stacijas (102) nākošu augstāka slāņa signālu, kas norāda pirmo augšpusaites vadības informācijas (UCI) multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai (111) ļauj vienlaicīgi pārraidīt fizisku augšpusaites koplietošanas kanālu (*Physical Uplink Shared Channel*,

*PUSCH*) un fizisku augšpusaites vadības kanālu (*Physical Uplink Control Channel, PUCCH*), vai otru UCI multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai (111) neļauj vienlaicīgi pārraidīt PUSCH un PUCCH;

no bāzes stacijas (102) nākošas vienu vai vairākas augšpusaites atļaujas, pie kam katra no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites komponenta nesējā (UL CC) ielplāno fizisku augšpusaites koplietošanas kanālu (PUSCH) apakšskadrā n uz abonenta staciju (111), un katra no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām nes kanāla kvalitātes informācijas (CQI) pieprasījumu;

- pārraides trakta shēmu, kas ir konfigurēta tā, lai pārraidītu aperiodisku kanāla stāvokļa informācijas (CSI) atskaiti uz bāzes staciju (102) augšpusaites komponenta nesējā i esošajā PUSCH, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība,

pie kam, kad apliecinājuma/negatīva apliecinājuma (ACK/NACK) informācija ir ielplānota tajā pašā apakšskadrā n un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode, tad ACK/NACK informācija arī tiek pārraidīta uz bāzes staciju pa PUSCH, kas pārraidīts augšpusaites komponenta nesējā i.

18. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam pārraides trakta shēma ir konfigurēta tā, lai uz bāzes staciju (102) caur UL PCC esošo PUSCH pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti, kad abonenta stacija (111) ir ielplānota, lai pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode, kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) ielplāno PUSCH,

19. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam pārraides trakta shēma ir konfigurēta tā, lai pārraidītu tikai aperiodisku CSI atskaiti, kad aperiodiska CSI atskaiti ir ielplānota tajā pašā apakšskadrā n, kur periodiskā CSI atskaiti.

20. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam pārraides trakta shēma ir konfigurēta tā, lai uz bāzes staciju (102) caur UL PCC esošo PUCCH pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti, kad abonenta stacijā (111) ir ielplānots pārraidīt vismaz vienu ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) ielplāno PUSCH.

21. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam pārraides trakta shēma ir konfigurēta tā, lai no bāzes stacijas (102) caur UL SCC esošo PUSCH pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti, kam ir vismazākais UL CC skaitlis, kad abonenta stacija (111) ir ielplānota, lai pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites sekundārā komponenta nesējā (UL SCC) ielplāno PUSCH un kad neviena no viena vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) neielplāno PUSCH.

22. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam vērtību kopa satur '1', '01', '10' un '11'.

23. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam pārraides trakta shēma ir konfigurēta tā, lai caur primārā komponenta nesējā (PCC) esošo PUCCH pārraidītu ACK/NACK informāciju, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielplāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.



24. Abonenta stacija (111) saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam pārraides trakta shēma ir konfigurēta tā, lai pa PUSCH, kas pārraidīts augšpusaites komponenta nesējā i, pārraidītu aperiodisku CSI atskaiti un ACK/NACK informāciju, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.

25. Metode abonenta stacijas (111) ekspluatācijai, pie kam metode satur:

- no bāzes stacijas (102) nākoša augstāka slāņa signāla uztveršanu, kas norāda pirmo augšpusaites vadības informācijas (UCI) multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai (111) ļauj vienlaicīgi pārraidīt fizisku augšpusaites koplietošanas kanālu (*Physical Uplink Shared Channel, PUSCH*) un fizisku augšpusaites vadības kanālu (*Physical Uplink Control Channel, PUCCH*), vai otru UCI multipleksēšanas metodi, kas abonenta stacijai neļauj vienlaicīgi pārraidīt PUSCH un PUCCH;

- no bāzes stacijas (102) nākošas(-u) vienas vai vairāku augšpusaites atļauju uztveršanu, pie kam katra no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites komponenta nesējā (UL CC) ielāno fizisku augšpusaites koplietošanas kanālu (PUSCH) apakškadram n uz abonenta staciju (111) un katra no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām nes kanāla kvalitātes informācijas (CQI) pieprasījumu;

- aperiodiskas kanāla stāvokļa informācijas (CSI) atskaites pārraidīšanu uz bāzes staciju (102) caur PUSCH augšpusaites komponenta nesējā i, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība,

pie tam, kad apliecinājuma/negatīva apliecinājuma (ACK/NACK) informācija tiek ielānota tajā pašā apakškadram n un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode, ACK/NACK informācija arī tiek pārraidīta ar abonenta stacijas palīdzību uz PUSCH, kas pārraidīts augšpusaites komponenta nesējā i.

26. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kas papildus ietver vismaz ACK/NACK informācijas vai periodiskas CSI atskaites pārraidīšanu uz bāzes staciju (102) caur UL PCC esošo PUSCH, kad abonenta stacija (111) tiek ielānota, lai pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir pirmā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) ielāno PUSCH.

27. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, pie kam, kad aperiodiska CSI atskaiti ir ielānota tajā pašā apakškadram n, kur periodiskā CSI atskaiti, tad tiek pārraidīta tikai aperiodiska CSI atskaiti.

28. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kas papildus ietver vismaz ACK/NACK informācijas vai periodiskas CSI atskaites pārraidīšanu uz bāzes staciju (102) caur UL PCC esošo PUSCH, kad abonenta stacija (111) tiek ielānota, lai pārraidītu vismaz vienu ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode; kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) ielāno PUSCH.

29. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kas papildus ietver vismaz ACK/NACK informācijas vai periodiskas CSI atskaites pārraidīšanu uz bāzes staciju (102) caur UL SCC esošo PUSCH, kam ir vismazākais UL CC skaitlis, kad abonenta stacija (111) tiek ielānota, lai pārraidītu vismaz ACK/NACK informāciju vai periodisku CSI atskaiti:

kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nenes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība; kad vismaz viena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites

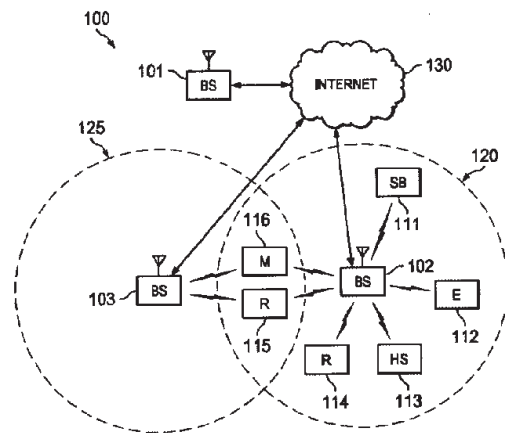
sekundārā komponenta nesējā (UL SCC) ielāno PUSCH un kad neviena no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām augšpusaites primārā komponenta nesējā (UL PCC) neielāno PUSCH.

30. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, pie kam vērtību kopa ietver '1', '01', '10' un '11'.

31. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kas papildus ietver ACK/NACK informācijas pārraidīšanu primārā komponenta nesējā (PCC) esošajā PUCCH:

kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.

32. Metode saskaņā ar 25. pretenziju, kas papildus ietver aperiodiskas CSI atskaites un ACK/NACK informācijas pārraidīšanu pa PUSCH, kas pārraidīts augšpusaites komponenta nesējā i, tikai tad, kad no vienas vai vairākām augšpusaites atļaujām tikai viena augšpusaites atļauja, kas augšpusaites komponenta nesējā i ielāno PUSCH, nes CQI pieprasījumu, kam ir no vērtību kopas izvēlēta vērtība, un kad viena izvēlēta UCI multipleksēšanas metode ir otrā UCI multipleksēšanas metode.



- (51) **C07D 215/227<sup>(200601)</sup>** (11) **2387563**  
**A61K 31/47<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 35/00<sup>(200601)</sup>**
- (21) 10701175.1 (22) 15.01.2010  
(43) 23.11.2011  
(45) 06.03.2013  
(31) 145421 P (32) 16.01.2009 (33) US  
(86) PCT/US2010/021194 15.01.2010  
(87) WO2010/083414 22.07.2010  
(73) Exelixis, Inc., 210 East Grand Avenue, P.O. Box 511, South San Francisco, CA 94080-0511, US  
(72) BROWN, Adrian St. Clair, GB  
LAMB, Peter, US  
GALLAGHER, William, P., US  
(74) Duckett, Anthony Joseph, et al, Mathys & Squire LLP, 120 Holborn, London EC1N 2SQ, GB  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **N-(4-[6,7-BIS(METILOKSI)HINOLIN-4-IL]OKSIFENIL)-N'-(4-FLUORFENIL)CIKLOPROPĀN-1,1-DIKARBOKSAMĪDA MALĀTA SĀLS UN TĀ KRISTĀLISKĀS FORMAS VĒŽA ĀRSTĒŠANAI**  
**MALATE SALT OF N-(4-[6,7-BIS(METHYLOXY)QUINOLIN-4-YL]OXYPHENYL)-N'-(4-FLUOROPHENYL)CYCLOPROPANE-1,1-DICARBOXAMIDE, AND CRYSTALLINE FORMS THEREOF FOR THE TREATMENT OF CANCER**
- (57) 1. N-(4-[[6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il]oksi]fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls.  
2. N-(4-[[6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il]oksi]fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais sāls ir (DL)-malāta sāls.  
3. N-(4-[[6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il]oksi]fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais sāls ir (L)-malāta sāls un (D)-malāta sāls.

4. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 3. pretenziju, kur minētais sāls ir (L)-malāta sāls.

5. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 3. pretenziju, kur minētais sāls ir (D)-malāta sāls.

6. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 5. pretenzijai, kur minētais sāls ir kristālisks sāls.

7. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 6. pretenziju, kur minētais sāls ir kristāliskajā formā N-1 un minētā forma N-1 raksturīga ar vismaz vienu no šādām īpašībām:

(i) cietvielu <sup>13</sup>C KMR spektru ar četrām vai vairākām smailēm, kas izvēlētas no 18,1, 42,9, 44,5, 70,4, 123,2, 156,2, 170,8, 175,7 un 182,1, ± 0,2 ppm;

(ii) rentgenstaru difraktogrammu (CuKα λ=1,5418 Å), kas ietver četras vai vairākas smailes ar 2θ vērtībām, kas izvēlētas no: 12,8 ± 0,2 °2θ, 13,5 ± 0,2 °2θ, 16,9 ± 0,2 °2θ, 19,4 ± 0,2 °2θ, 21,5 ± 0,2 °2θ, 22,8 ± 0,2 °2θ, 25,1 ± 0,2 °2θ, 27,6 ± 0,2 °2θ, kur kristāliskās formas mērījumi ir veikti istabas temperatūrā, un/vai

(iii) rentgenstaru difraktogrammu (XRPD), kas praktiski atbilst difraktogrammai, kas parādīta 1. zīm.

8. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 7. pretenziju, kur minētais sāls sastāv vismaz no 90 mas. % formas N-1, rēķinot uz minētā sāls masu.

9. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 6. pretenziju, kur minētais sāls ir kristāliskajā formā N-2 un minētā forma N-2 raksturīga ar vismaz vienu no šādām īpašībām:

(i) cietvielu <sup>13</sup>C KMR spektru ar četrām vai vairākām smailēm, kas izvēlētas no 23,0, 25,9, 38,0, 41,7, 69,7, 102,0, 122,5, 177,3, 179,3, 180,0 un 180,3 ± 0,2 ppm;

(ii) rentgenstaru difraktogrammu (CuKα λ=1,5418 Å), kas ietver 2θ vērtības pie 20,9 ± 0,2 °2θ un 21,9 ± 0,2 °2θ, un divas vai vairākas smailes ar 2θ vērtībām, kas izvēlētas no: 6,4 ± 0,2 °2θ, 9,1 ± 0,2 °2θ, 12,0 ± 0,2 °2θ, 12,8 ± 0,2 °2θ, 13,7 ± 0,2 °2θ, 17,1 ± 0,2 °2θ, 22,6 ± 0,2 °2θ, 23,7 ± 0,2 °2θ, kur kristāliskās formas mērījumi ir veikti istabas temperatūrā, un/vai

(iii) rentgenstaru difraktogrammu (XRPD), kas praktiski atbilst difraktogrammai, kas parādīta 8. zīm.

10. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar 9. pretenziju, kur minētais sāls sastāv vismaz no 90 mas. % formas N-2, rēķinot uz minētā sāls masu.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur N-(4-{{6,7-bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāli saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 10. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu pildvielu.

12. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 10. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanai vēža ārstēšanai.

13. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda malāta sāls saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 10. pretenzijai, kuru izmanto terapijā vēža ārstēšanā.

14. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda (L)-malāta sāls kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 10. pretenzijai, kuru izmanto kā medikamentu vairogdziedzera vēža ārstēšanai subjektam.

15. N-(4-{{6,7-Bis(metiloksi)hinolin-4-il}oksi}fenil)-N'-(4-fluorfenil)ciklopropān-1,1-dikarboksamīda (L)-malāta sāls kristāliskā forma saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 10. pretenzijai, kuru izmanto kā medikamentu glioblastomas ārstēšanai subjektam.

(21) 11002906.3

(22) 06.06.2006

(43) 30.11.2011

(45) 05.06.2013

(31) 687971 P

(32) 07.06.2005 (33) US

(32) 785353 P

23.03.2006 US

(62) EP06741625.5 / EP1891110

(73) ESBATech - a Novartis Company LLC, Wagistrasse 21, 8952 Schlieren, CH

(72) EWERT, Stefan, CH

URECH, David, CH

LICHTLEN, Peter, CH

BARBERIS, Alcide, CH

AUF DER MAUR, Adrian, CH

(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Anwaltssozietät, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE  
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **STABILAS UN ŠĶĪSTOŠAS, TNF ALFA INHĪBĒJOŠAS ANTIVIELAS  
STABLE AND SOLUBLE ANTIBODIES INHIBITING TNF(ALPHA)**

(57) 1. Stabila un šķīstoša antiiviela vai antiivielas atvasinājums, kas specifiski saista TNFα, turklāt minētā antiiviela vai antiivielas atvasinājums satur SEQ ID NO: 1 vieglās ķēdes variablo domēnu (VL), kas ir saistīts ar SEQ ID NO: 2 smagās ķēdes variablo domēnu (VH).

2. Antiivielas atvasinājums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir scFv antiiviela, turklāt VL un VH domēni ir saistīti ar linkeru.

3. scFv antiiviela saskaņā ar 2. pretenziju, kas satur sekvenču izvietojuumu VL-linkeris-VH.

4. scFv antiiviela saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, turklāt linkeris ir ar sekvenci SEQ ID NO: 10 vai ir atvasināts no minētās sekvences.

5. scFv antiiviela saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt vismaz viens minētā linkera G ir nomainīts ar polārāku vai lādētu aminoskābi.

6. Antiivielas atvasinājums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir Fab fragments, turklāt VL domēns ir sapludināts ar cilvēka Ig kappa ķēdes konstanto apgabalu, VH domēns ir sapludināts ar cilvēka IgG CH1 domēnu un abi sapludinātie polipeptīdi ir savienoti ar starpkēžu disulfīda tiltni.

7. Antiiviela vai antiivielas atvasinājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas ir iezīmēta(-s) vai ķīmiski modificēta(-s).

8. DNS sekvenca, kas kodē antiivielu vai antiivielas atvasinājumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai.

9. Klonēšanas vai ekspresijas vektors, kas satur DNS sekvenci saskaņā ar 8. pretenziju.

10. Piemērota saimniekšūna, kas transformēta ar ekspresijas vektoru saskaņā ar 9. pretenziju.

11. Saimniekšūna saskaņā ar 10. pretenziju, kas ir *E. coli*, rauga, auga, insekta vai zīdītāja šūna.

12. Metode antiivielas vai antiivielas atvasinājuma molekulas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai ražošanai, kas ietver saimniekšūnas saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju kultivēšanu apstākļos, kas ir labvēlīgi minētās antiivielas molekulas sintēzei, un tās iegūšanu no minētās kultūras.

13. Antiiviela vai antiivielas atvasinājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai kā farmaceutisks līdzeklis.

14. Antiiviela vai antiivielas atvasinājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai ar TNFα saistītas slimības ārstēšanas metodē.

15. Antiiviela vai antiivielas atvasinājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai ar TNFα saistītas slimības ārstēšanas metodē saskaņā ar 14. pretenziju, raksturīga ar to, ka ar TNFα saistītā slimība ir osteoartrīts, sausās acs sindroms, uveīts, ādu skarošas iekaisuma slimības, psoriāze vai iekaisīga zarnu slimība.

16. Antiiviela vai antiivielas atvasinājums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai ar TNFα saistītas slimības ārstēšanas metodē, turklāt antiiviela vai antiivielas atvasinājums tiek ievadīts lokāli vai vietēji.

17. Antiivielas vai antiivielas atvasinājuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanai ar TNFα saistītu slimību ārstēšanai vai izmantošana par *in vitro* diagnostisku līdzekli šādu slimību atklāšanai.

(51) **C07K 16/24**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 39/395**<sup>(200601)</sup>  
**G01N 33/53**<sup>(200601)</sup>  
**C12N 15/13**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 37/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 29/00**<sup>(200601)</sup>

(11) **2390267**

18. Izmantošana saskaņā ar 17. pretenziju, turklāt medikaments ir domāts ar TNF $\alpha$  saistītās slimības ārstēšanai un turklāt anti viela vai anti vielas atvasinājums tiek ievadīts lokāli vai vietēji.

19. Izmantošana saskaņā ar 17. vai 18. pretenziju, turklāt ar TNF $\alpha$  saistītā slimība ir osteoartrīts, uveīts, iekaisīga zarnu slimība, sausās acs sindroms, ādu skarošas iekaisuma slimības vai psoriāze.

20. Diagnostiska vai terapeitiska kompozīcija, kas satur anti vielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai kopā ar farmaceitiski pieņemamu nesēju, atšķaidītāju vai palīgvielu.

21. Kombinētais preparāts, kas satur anti vielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai kopā ar vismaz vienu otru savienojumu.

22. Kombinētais preparāts saskaņā ar 21. pretenziju, turklāt otrs savienojums nav TNF $\alpha$  specifiska anti viela.

23. Kombinētais preparāts saskaņā ar 21. vai 22. pretenziju izmantošanai par medikamentu.

24. Vektors saskaņā ar 9. pretenziju kā farmaceitisks līdzeklis gēnu terapijas pielietojumam cilvēkiem un/vai dzīvniekiem.

- (51) **A47J 36/06**<sup>(200601)</sup> (11) **2391252**  
**A47J 36/38**<sup>(200601)</sup>  
**A47J 37/12**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10706777.9 (22) 29.01.2010  
(43) 07.12.2011  
(45) 01.05.2013  
(31) RM20090046 (32) 02.02.2009 (33) IT  
(86) PCT/IT2010/000027 29.01.2010  
(87) WO2010/086892 05.08.2010  
(73) BY ME S.R.L., Via Congiunte Sinistre, No. 18, 04100 Latina, IT  
(72) FERRARI, Luciano, IT  
FERRARI, Marco, IT  
(74) Santi, Filippo, et al, Barzanò & Zanardo Roma S.p.A., Via Piemonte 26, I-00187 Roma, IT  
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **ĒDIENU GATAVOŠANAS KONTEINERA UZLABOTS PERFORĒTS VĀKS**  
**IMPROVED PERFORATED LID FOR CONTAINERS FOR COOKING FOOD**

(57) 1. Uzlabots perforēts vāks (10) ēdienu gatavošanas konteineriem, kurš satur caurumus (15) augšup ejošo tvaiku un gāzu un lejup ejošo kondensētu tvaiku virzīšanai, kā arī satur līdzekļus caur minētajiem caurumiem ejošo tvaiku atdzesēšanai un kondensēšanai un līdzekļus minēto tvaiku dzesēšanas līdzekļu balstīšanai,

kas raksturīgs ar to, ka minētie līdzekļi tvaiku atdzesēšanai ir izveidoti kā līdzekļu virkne, kas sākas no ēdienu gatavošanas konteinerā un virzās augšup un satur perforētu apakšējo plātni (11), vismaz vienu perforētu starplātni (12) un augšējo plātni (13), kas nav perforēta, pie kam minētie līdzekļi minēto tvaiku atdzesēšanas līdzekļu balstīšanai ir izveidoti no apakšējā distancējošā elementa (16), kas ir pozicionēts starp minēto apakšējo plātni (11) un minēto starplātni (12), un no augšējā distancējošā elementa (18), kas ir pozicionēts starp minēto starplātni (12) un minēto augšējo plātni.

2. Perforēts vāks (10) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka satur vairākas starplātnes (12), kuras saista atbilstošs skaits distancējošo starpelementu.

3. Perforēts vāks (10) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētās apakšējās plātnes (11) augšējai virsmai un vismaz vienas minētās starplātnes (12) augšējai virsmai ir ieliekums, kas vērsts augšup.

4. Perforēts vāks saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētās augšējās plātnes (13) apakšējā virsma un vismaz vienas minētās starplātnes (12) apakšējā virsma ir ieliekums, kas vērsts lejup.

5. Perforēts vāks (10) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka minētās augšējās plātnes (13) apakšējā virsma un vismaz vienas minētās starplātnes (12) apakšējā virsma ir viļņveida virsma.

6. Perforēts vāks (10) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka minētās augšējās plātnes (13)

apakšējā virsma un vismaz viena minētās starplātnes (12) apakšējā virsma ir lamelāras.

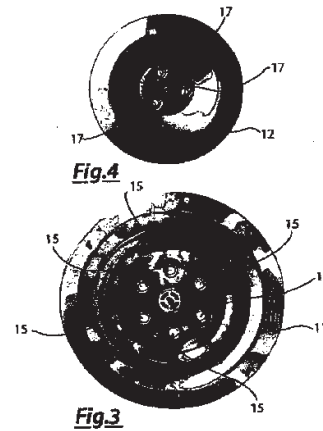
7. Perforēts vāks saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētie līdzekļi minēto dzesēšanas līdzekļu balstīšanai ir regulējami.

8. Perforēts vāks saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētie līdzekļi minēto dzesēšanas līdzekļu balstīšanai satur skrūvi.

9. Perforēts vāks saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas satur rokturi (14), kas ir pozicionēts uz minēto dzesēšanas līdzekļu minētajiem balstīšanas līdzekļiem.

10. Cepšanas aparāts (20) izmantošanai kopā ar perforēto vāku (10), kas definēts jebkurā no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka satur čaulu (21), kas izgatavota no izolējoša materiāla, kura iekšpusē ir izvietots katls (22) un izņemams veltinis (23), minētais vāks (10) un elektriskā cepšanas krāsns (25), kā rezultātā elektriskā cepšanas krāsns (25) var tikt atdalīta no cepšanas aparāta pārējiem elementiem.

11. Cepšanas aparāts (20) saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka satur vienu vai vairākus gaisnecaurlaidīgus elementus vāka (10) balstīšanai uz minētā katla (22).



- (51) **C03B 5/04**<sup>(200601)</sup> (11) **2397446**  
**C03B 5/235**<sup>(200601)</sup>  
**C03B 5/44**<sup>(200601)</sup>
- (21) 11004955.8 (22) 17.06.2011  
(43) 21.12.2011  
(45) 07.08.2013  
(31) 817754 (32) 17.06.2010 (33) US  
(73) Johns Manville, 717 Seventeenth Street, Denver, CO 80202, US  
(72) HUBER, Aaron Morgan, US  
(74) Mai, Dörr, Besier, Patentanwälte, Steuerberater/Wirtschaftsprüfer, John-F.-Kennedy-Straße 4, 65189 Wiesbaden, DE  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **STIKLA KAUSĒŠANAS VANNĀ IEGREMDĒTAS KRĀSNS GEOMETRIJA AR DZESĒŠANAS PANEĻIEM UN STIKLA KAUSĒŠANAS PANEĻIEM**  
**PANEL-COOLED SUBMERGED COMBUSTION MELTER GEOMETRY AND METHODS OF MAKING MOLTEN GLASS**

(57) 1. Kausēšanas iekārta (100), kas ietver:  
a) grīdu (8) un pārsegumu (7);  
b) būtībā vertikālu sienu, kas savieno grīdu (8) ar pārsegumu (7) pa grīdas un pārseguma perimetru, kausēšanas zonu, kuru norobežo grīda (8), pārsegums (7) un siena; pie kam kausēšanas zonai ir ietilpdes atvere (9) un izkausētā stikla izplūdes atvere (6), kas izvietotas kausēšanas zonas pretējos galos, turklāt kausēšanas zona satur paplašinājuma zonu (14), kas sākas no ietilpdes atveres un turpinās kā starpposms virzienā uz pretējo galu, un sašaurinājuma zonu (16), kas turpinās no starpposma virzienā uz izplūdes atveri (6),



kas raksturīga ar to, ka kausēšanas iekārta satur lielu skaitu degļu (10, 25, 26), no kuriem vismaz daži ir izvietoti tā, lai sadegšanas produktus novirzītu kausēšanas zonā zem kausēšanas zonā (10, 10A, 10B, 10C) esošā izkausētā stikla līmeņa.

2. Kausēšanas iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kur starposms atrodas tur, kur kausēšanas zonai ir maksimālais platums  $W_M$ .

3. Kausēšanas iekārta saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā vismaz daļa sienas satur ar šķidrums dzesējamus ugunsizturīgus paneļus (130, 140).

4. Kausēšanas iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kur ar šķidrums dzesējamie paneļi (130, 140) ir tādi, kas satur vienu vai vairākus kanālus (131) šķidrums ieplūšanai un izplūšanai pa šiem kanāliem.

5. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā kausēšanas zonai ir noteikta forma, kuru nosaka pirmā un otrā trapece (14, 16), kurām ir kopīgs pamats, kas atrodas starposmā un būtībā ir perpendikulārs kausētāja garenasij, turklāt pirmajai trapecei (14) ir mala, kas ir paralēla kopīgajam pamatam un atrodas pie ieplūdes atveres, bet otrajai trapecei (16) ir mala, kas ir paralēla kopīgajam pamatam un atrodas pie izplūdes atveres.

6. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā kausētāja dziļums samazinās līdz ar kausētāja platuma samazināšanos sašaurinājuma zonā.

7. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kurā starposms satur nemainīga platuma zonu, kas atrodas starp paplašinājuma zonu (14) un sašaurinājuma zonu (16).

8. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur vismaz daži degļi (10, 25, 26) ir skābekļa un degvielas degļi.

9. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kuras caurlaidspēja ir 2 kvadrātpēdas uz īso tonnu dienā vai mazāk, vēlams 0,5 kvadrātpēdas uz īso tonnu dienā vai mazāk.

10. Kausēšanas iekārta saskaņā ar 1. vai 2., vai no 4. līdz 9. pretenzijai, kur kausētāja siena satur pilnībā ar šķidrums dzesējamus paneļus (130, 140), turklāt siena vismaz starp paneļiem un kausēto stiklu satur ugunsizturīgu starplātni (135).

11. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur paplašinājuma zonā un sašaurinājuma zonā esošā siena nav lineāra.

12. Kausēšanas iekārta saskaņā ar 3. vai 4., vai 10. pretenziju, kur paneļi (130, 140) tiek atdzesēti ar siltuma pārnese flūīdu, kas izvēlēts no grupas, kura satur gāzveida, šķidrums kompozīcijas vai gāzveida un šķidrums kompozīciju kombinācijas, kas darbojas vai ir pārveidojamas, lai darbotos kā siltuma pārnese flūīds, vēlams gāzveida siltuma pārnese flūīds, kas ir izvēlēts no grupas, kura satur apkārtējo gaisu, bagātinātu gaisu, inertas neorganiskas gāzes, inertas organiskas gāzes un inertu gāzu maisījumus ar nelielām neinertu gāzu daļām, un šķidrums siltuma pārnese flūīdus, kas ir izvēlēti no grupas, kura satur inertus flūīdus, kas var būt organiski, neorganiski vai dažas to kombinācijas.

13. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, kurā vismaz daži degļi (10) ir iemontēti grīdā un izvietoti vienā vai vairākās paralēlās rindās būtībā perpendikulāri kausētāja garenasij.

14. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, kurā degļu (10) skaits katrā rindā ir proporcionāls kausētāja platumam.

15. Kausēšanas iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, kurā viens vai vairāki degļi (10C) sadegšanas produktus kausējumā izdala leņķīt pret grīdu, pie kam minētais leņķis nav 90 grādus liels leņķis, bet vēlams, lai minētais leņķis ir no 30 līdz 80 grādiem liels leņķis.

16. Paņēmiens, kas ietver:

a) vismaz viena daļēji stiklveida vielā pārvēršama materiāla padevi pa ugunsizturīgās kausēšanas iekārtas kausēšanas zonas ieplūdes atveri (9), pie kam kausēšanas iekārta satur grīdu (8), pārsegumu (7) un būtībā vertikālu sienu, kas savieno grīdu ar pārsegumu pa grīdas un pārseguma perimetru, kausēšanas zonu, kas satur paplašinājuma zonu (14), kas sākas no ieplūdes atveres un turpinās kā starposms virzienā uz pretējo galu, un sašaurinājuma zonu (16), kas turpinās no starposma virzienā uz izplūdes atveri (6);

b) vismaz viena daļēji stiklveida vielā pārvēršama materiāla karsēšanu ar vismaz vienu degli (10, 25, 26), kas sadegšanas produktus novirza kausēšanas zonā;

c) izkausētā stikla izvadīšanu pa kausētā stikla izplūdes atveri (6), kas izvietota kausēšanas zonas ieplūdes atveri (9) pretējā galā,

kas raksturīgs ar to, ka vismaz viens deglis (10, 25), kas sadegšanas produktus novirza kausēšanas zonā, atrodas zem kausēšanas zonā esošā izkausētā stikla līmeņa.

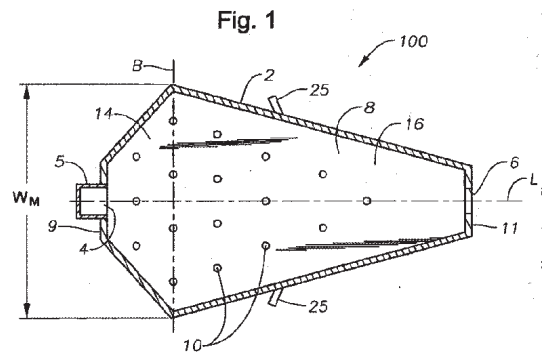
17. Paņēmiens saskaņā ar 16. pretenziju, kas satur sienu dzesēšanu ar sienu, kas satur atdzesētus ugunsizturīgus paneļus (130, 140) un virza šķidrums siltumnesēju caur minētajiem paneļiem.

18. Paņēmiens saskaņā ar 16. vai 17. pretenziju, kurā karsēšana notiek, sadegšanas produktus novirzot kausēšanas zonā zem izkausētā stikla līmeņa, zonā, kurā darbojas divi vai vairāki grīdā iemontēti degļi (10, 10A, 10B, 10C).

19. Paņēmiens saskaņā ar 18. pretenziju, kas satur sadegšanas produktu novirzīšanu kausēšanas zonā zem izkausētā stikla līmeņa zonā, kur darbojas divās vai vairāk rindās grīdā iemontēti degļi (10, 10A, 10B, 10C), kas izkārtoti būtībā perpendikulāri kausētāja garenasij.

20. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 16. līdz 19. pretenzijai, kas satur izkausētā stikla dziļuma samazināšanu vietā, kur tas pārvietojas no starposma uz kausētāja izplūdes atveri (6).

21. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 16. līdz 20. pretenzijai, kur izplūde ir vismaz 0,5 īsās tonnas dienā uz kausētāja grīdas kvadrātpēdu, vēlams vismaz 2 īsās tonnas dienā uz kausētāja grīdas kvadrātpēdu.



- (51) **G02B 23/12**<sup>(200601)</sup> (11) **2399157**  
**G02B 3/10**<sup>(200601)</sup>  
**H04N 5/225**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10743378.1 (22) 19.02.2010  
(43) 28.12.2011  
(45) 01.05.2013  
(31) 154182 P (32) 20.02.2009 (33) US  
(86) PCT/CA2010/000237 19.02.2010  
(87) WO2010/094133 26.08.2010  
(73) Thales Canada Inc., 4868 Rue Levy, Saint-Laurent, Québec H4R 2P1, CA  
(72) CARON, Hubert, CA  
(74) Kurtz, Laurent Charles Edmond, Santarelli, 14 avenue de la Grande Armée, 75017 Paris, FR  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **OPTISKA ATTĒLU VEIDOŠANAS SISTĒMA AR DUĀLU REDZESLAUKU UN BIFOKĀLU LĒCU**  
**DUAL FIELD-OF-VIEW OPTICAL IMAGING SYSTEM WITH DUAL FOCUS LENS**
- (57) 1. Optiska attēlu veidošanas sistēma ar duālu redzeslauku, kas satur:  
bifokālu lēcu, kur minētajai lēcai ir vidējā zona ar fokusa attālumu  $f_1$  un perifērā zona ar fokusa attālumu  $f_2$ , kur  $f_2$  ir lielāks nekā  $f_1$ , turklāt minētā vidējā zona ir piemērota, lai radītu plata redzeslauka attēlu, un minētā perifērā zona ir piemērota, lai radītu šaura redzeslauka attēlu, turklāt minētā lēca ir piestiprināta pie balsta;  
detektoru, kurš ir pārvietojamā veidā piestiprināts pie minētā balsta, lai atklātu un iegūtu divu redzeslauku attēlus, turklāt minētais detektors ir novietots uz kopīgas optiskās ass ar minēto lēcu, minētais detektors ir aksiāli pārvietojams starp pirmo pozīciju, kas



atbilst minētajam fokusa attālumam f1, un otru pozīciju, kas atbilst minētajam fokusa attālumam f2;

kontrolleri ar minēto lēcu radīto platā un šaurā redzeslauka attēlu uztveršanai.

2. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētā lēca ir no viena gabala izveidota lēca.

3. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētā lēca ir izgatavota no divām kopā sakombinētām lēcu daļām.

4. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētajai lēcai ir ārēja virsma, kurai ir divējāds izliekuma rādiuss.

5. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētajai lēcai ir ārēja virsma, kas ir asfēriska.

6. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētajai lēcai ir iekšējā virsma, kas pielāgota optisko aberāciju koriģēšanai.

7. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētajai lēcai ir ārēja virsma un iekšējā virsma un kur minētajai iekšējai virsmai vai minētajai ārējai virsmai, vai abām ir antiatstarojošs pārklājums.

8. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētā lēca ir izgatavota no materiāla, kas laiž cauri to gaismas viļņu garuma diapazonu, kas nāk no apskatāmās ainas.

9. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētais detektors ir fotonu detektors vai termiskais detektors.

10. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kas papildus satur lauka korektoru, kurš ir novietots starp minēto lēcu un minēto detektoru.

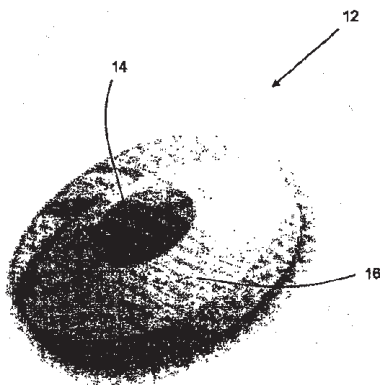
11. Attēlu veidošanas sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kur minētā attēlu veidošanas sistēma papildus ietver ekrānu parazītiskas gaismas bloķēšanai.

12. Paņēmiens vienas ainas divu attēlu iegūšanai, kur pirmajam attēlam ir plats redzeslauks un otrajam attēlam ir šaurs redzeslauks, kas satur tādus soļus kā:

(a) lēcas ar diviem redzeslaukiem sagādāšana, kurai ir vidējā zona ar fokusa attālumu f1 plata redzeslauka attēla veidošanai pirmajā fokālajā plaknē un perifērā zona ar fokusa attālumu f2 šaura redzeslauka attēla veidošanai otrajā fokālajā plaknē;

(b) pārvietojama detektora sagādāšana, kur minētais detektors ir novietots uz kopīgas optiskas ass ar minēto lēcu ar diviem redzeslaukiem, turklāt minētais detektors ir pārvietojams starp minētajiem fokusa attālumiem f1 un f2;

(c) regulatora sagādāšana minēto divu attēlu, kuri iegūti pie minētajiem fokusa attālumiem f1 un f2, detektēšanai un uztveršanai.



Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV

(54) **IEVELKAMAS SPĒKA IEKĀRTAS VAI ATBILSTOŠA KUSTĪGI PRET KORPUSU UZMONTĒTA DZINEKĻA SERVISA TELPA**  
**SERVICE SPACE FOR A RETRACTABLE PROPULSION DEVICE OR CORRESPONDING**

(57) 1. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas, kas uzstādīta kuģī vai tam atbilstošā peldošā konstrukcijā, servisa telpa (11), kura satur slēgtu vai noslēdzamu telpu, ko ierobežo sienas, virsējā konstrukcija un dibens, pie kam: minētajā telpā ir izveidota atvere dzenskrūvei (C), ko veido kuģa vai tam atbilstošās peldošās konstrukcijas citas detaļas/mezgli; servisa telpa (11) ir izveidota saistībā ar kuģa vai tam atbilstošās peldošās konstrukcijas dibenu (2), sakarā ar ko spēka iekārta (4) vai atbilstošā dzinekļa sistēma ir ievilkama servisa telpā (11) no funkcionēšanas pozīcijas servisa/glabāšanas pozīcijā un atbilstoši ir nolaižama no servisa telpas (11) leņķu funkcionēšanas pozīcijā,

kas ir raksturīga ar to, ka servisa telpa (11) lielākoties atrodas vismaz zem kuģa vai tam atbilstošās peldošās konstrukcijas ūdenslīnijas (WL) un ir aprīkota vismaz ar vienu ūdensnecaurlaidīgu noslēgšanas ierīci (14), kas būtībā atrodas kuģa vai atbilstošās peldošās konstrukcijas dibena (2) līmenī, pie kam iekārta(-s), kad ir deblokēta(-s), konstituē tiešu atveri no servisa telpas (11) uz ūdeni caur kuģa vai atbilstošās peldošās konstrukcijas dibenu (2), lai nolaižtu spēka iekārta (4) vai atbilstošo dzinekļa sistēmu no servisa telpas (11) ūdenī funkcionēšanas pozīcijā, t.i., darbības stāvoklī, un atbilstoši, lai to paceltu no ūdens un ievietotu servisa telpā (11) servisa/glabāšanas pozīcijā, t.i., servisa/glabāšanas stāvoklī, pie kam, kad iekārtas(-u) darbība ir bloķēta, tā(-s) kopā ar servisa telpas (11) virsējo konstrukciju un sienām konstituē ūdensnecaurlaidīgu telpu, no kuras pēc ierīces (14) noslēgšanas ūdens ir aizvācams prom,

kā arī ir raksturīga ar to, ka, spēka iekārtai (4) vai atbilstošai dzinekļa sistēmai esot funkcionēšanas stāvoklī, servisa telpu (11) noslēgšanas ierīces (14) ir deblokētas un spēka iekārtas (4) vai atbilstošās dzinekļu sistēmas ir mehāniski bloķētas kuģa vai atbilstošā peldlīdzekļa korpusa struktūrās tā, ka spēka iekārtas (4) vai atbilstošās dzinekļa sistēmas balststruktūra (4a) konstituē ūdensnecaurlaidīgu kontaktpvirsmu un ir savienota ar kuģa vai atbilstošās peldošās konstrukcijas korpusu.

2. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas servisa telpa saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka spēki, kas rezultējas no kuģa vai atbilstošās peldošās konstrukcijas kustībām un spēka iekārtas (4) dzenskrūves hidrodinamiskās darbības, ir izkārtoti tā, lai tos caur spēka iekārtas (4) bloķēšanas ierīcēm (8) aizvadītu uz kuģa vai atbilstošās peldošās konstrukcijas korpusa struktūrām.

3. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas servisa telpa saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka, spēka iekārtai (4) vai atbilstošai dzinekļa sistēmai esot darbības stāvoklī, noslēgšanas ierīces (14) ir pozicionētas servisa telpā (11) tā, ka spēka iekārta (4) vai atbilstošā dzinekļa sistēma ir brīvi ievilkama servisa telpā (11) servisa/glabāšanas stāvoklī.

4. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas servisa telpa (11) saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka servisa telpa ir aprīkota ar tālvadības bloķēšanas ierīcēm (8, 8'), ar kuru palīdzību spēka iekārtas (4) vai atbilstošās dzinekļa sistēmas, tām atrodoties darbības stāvoklī vai servisa/glabāšanas stāvoklī, balststruktūras (4a) tiek piestiprinātas pie kuģa korpusa vai atbilstošās peldošās konstrukcijas korpusa un mehāniski bloķētas.

5. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas servisa telpa saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka servisa telpa (11) ir aprīkota ar pacelšanas ierīcēm (15), lai izceltu spēka iekārtas (4) vai atbilstošo dzinekļa sistēmu no ūdens un ievietotu servisa telpā (11) vai to nolaižtu ūdenī.

6. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas servisa telpa saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka servisa telpā (11) ir izveidota vismaz viena ventilācijas caurule (13), kas aprīkota ar noslēgšanas vārstuļiem (13').

7. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošās dzinekļa sistēmas servisa telpa saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas

- |  |                     |
|--|---------------------|
| (51) <b>B63H 5/125<sup>(200601)</sup></b>                                      | (11) <b>2403749</b> |
| (21) 09841030.1  | (22) 05.03.2009     |
| (43) 11.01.2012  |                     |
| (45) 24.04.2013  |                     |
| (86) PCT/FI2009/050181   | 05.03.2009          |
| (87) WO2010/100313   | 10.09.2010          |
| (73) Beacon Finland Ltd OY, PI 228, 26101 Rauma, FI                            |                     |
| (72) HÖRKKÖ, Tuija, FI   |                     |
| RINTALA, Timo, FI  |                     |
| KORTE, Tommi, FI   |                     |
| SUUTARI, Juhani, FI  |                     |
| (74) Turun Patentitoimisto Oy, P.O. Box 99, Tykistökatu 2-4 B, 20521 Turku, FI |                     |

raksturīga ar to, ka spēka iekārtas (4) vai atbilstošas dzinekļa sistēmas piedziņas mehānisms (5, 5') ir novietots nodalījumā (12), kas no servisa telpas (11) ir atdalīts ar ūdensnecaurlaidīgu balstsienu (10) vai pārsedzi (10').

8. levelkamas spēka iekārtas vai atbilstošas dzinekļa sistēmas servisa telpa saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kas raksturīga ar to, ka, lai atvilktu spēka iekārtu (4) vai atbilstošo dzinekļa sistēmu no darbības stāvokļa servisa/glabāšanas stāvoklī, savienojums starp spēka iekārtu (4) vai atbilstošo dzinekļa sistēmu un piedziņas mehānismu (5, 5'), kur nepieciešams, tiek demontēts.

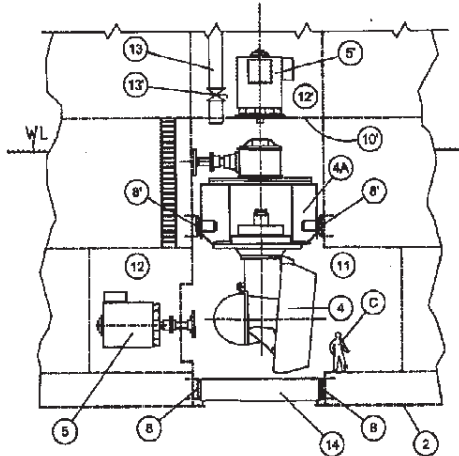


Fig. 3

- |  |                     |         |
|--|---------------------|---------|
| (51) <b>A61K 38/02</b> <sup>(200601)</sup>   | (11) <b>2405749</b> |         |
| <b>A61K 38/16</b> <sup>(200601)</sup>  |                     |         |
| <b>A61P 25/28</b> <sup>(200601)</sup>  |                     |         |
| (21) 10810282.3  | (22) 19.08.2010     |         |
| (43) 18.01.2012  |                     |         |
| (45) 08.05.2013  |                     |         |
| (31) 337612 P  | (32) 11.02.2010     | (33) US |
| 274687 P   | 20.08.2009          | US      |
| (86) PCT/US2010/002283   | 19.08.2010          |         |
| (87) WO2011/022063   | 24.02.2011          |         |
| (73) Yeda Research and Development Co., Ltd., P.O. Box 95, 76100 Rehovot, IL   |                     |         |
| (72) KLINGER, Ety, IL  |                     |         |
| (74) Nachshen, Neil Jacob, D Young & Co LLP, 120 Holborn, London EC1N 2DY, GB<br>Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga LV-1083, LV |                     |         |
| (54) <b>ZEMAS FREKVENCES GLATIRAMĒRA ACETĀTA TERAPIJA</b>  |                     |         |

**LOW FREQUENCY GLATIRAMER ACETATE THERAPY**

(57) 1. Medikaments, kas satur glatiramēra acetātu pacienta ārstēšanai, kas cieš no recidivējoši remitējošas izkaisītās sklerozes, vai kuram ir bijusi pirmā klīniskā epizode un ir augsts risks klīniski noteiktās izkaisītās sklerozes attīstībai, kur medikaments tiek ievadīts ar trīs subkutānām injekcijām pa 40 mg glatiramēra acetāta devām septiņas dienas ar vismaz vienas dienas pārtraukumu starp katru subkutāno injekciju.

2. Glatiramēra acetāts izmantošanai trīs subkutānām injekcijām pa 40 mg glatiramēra acetāta devām septiņas dienas ar vismaz vienas dienas pārtraukumu starp katru subkutāno injekciju pacienta ārstēšanai, kas cieš no recidivējoši remitējošas izkaisītās sklerozes, vai kuram ir bijusi pirmā klīniskā epizode un ir augsts risks klīniski noteiktās izkaisītās sklerozes attīstībai.

3. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju vai glatiramēra acetāts izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kur ārstēšana ietver recidīvu biežuma samazināšanu, Gd veicinošu bojājumu vidējā kumulatīvā daudzuma samazināšanu pacienta smadzenēs, jaunu T<sub>2</sub> bojājumu vidējā daudzuma samazināšanu pacienta smadzenēs, T<sub>1</sub> veicinošu bojājumu kumulatīvā daudzuma samazināšanu T<sub>1</sub> vērtēšanas attēlos, smadzeņu atrofijas samazinā-

šanu pacientam, laika perioda līdz apstiprinātajam recidīvam palielināšanu pacientam, apstiprināto recidīvu kopējā skaita samazināšanu pacientam, MRI uzraudzītās slimības progresa aktivitātes samazināšanu pacientam, T<sub>2</sub> bojājumu kopējā daudzuma samazināšanu pacientam, jaunu hipointensitātes bojājumu daudzuma samazināšanu uzlabotos T<sub>1</sub> skenējumos pacientam, kopējā hipointensitātes bojājumu daudzuma samazināšanu uzlabotos T<sub>1</sub> skenējumos pacientam, traucējumu līmeņa mazināšanu pacientam saskaņā ar EDSS novērtējuma skalu, izmaiņu samazināšanu EDSS novērtējuma skalā pacientam, izmaiņu samazināšanu medicīniskās palīdzības indeksā pacientam, traucējumu līmeņa mazināšanu pacientam saskaņā ar EuroQoL (EQ5D) aptaujas anketu vai traucējumu līmeņa mazināšanu pacientam saskaņā ar darba ražīguma un darbības traucējumu – Vispārējo veselības (WPAI-GH) aptaujas anketu.

4. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju vai glatiramēra acetāts izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kur tūlītēju reakciju biežums pēc injekcijas vai reakcijas injekcijas vietā, kas saistīts ar subkutānās ievadīšanas biežumu pa 20 mg glatiramēra acetāta dienā, ir samazināts.

5. Medikaments izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju vai glatiramēra acetāts izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kur pacienta panesamība palielinās saistībā ar subkutānās ievadīšanas biežumu pa 20 mg glatiramēra acetāta dienā, kur paaugstinātā panesamība satur samazinātu tūlītēju reakciju biežumu pēc injekcijas vai samazinātu reakciju biežumu injekcijas vietā, katrs saistīts ar subkutānās ievadīšanas biežumu pa 20 mg glatiramēra acetāta dienā.

6. Medikaments vai glatiramēra acetāts, kuru izmanto saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur tūlītējā reakcija pēc injekcijas ir sirdsklauves, karstuma sajūta, apsārtums, karstuma viļņi, tahikardija, aizdusa, diskomforta sajūta krūtīs, sāpes krūtīs, kas nav saistītas ar sirdi, astēnija, muguras sāpes, bakteriāla infekcija, drebuļi, cista, sejas tūska, drudzis, gripas simptomi, infekcija, injekcijas vietas eritēma, injekcijas vietas asiņošana, injekcijas vietas sacietēšana, injekcijas vietas iekaisums, injekcijas vietas uztūkums, sāpes injekcijas vietā, injekcijas vietas nieze, injekcijas vietas nātrene, injekcijas vietas sabiezējums, kakla sāpes, sāpes, migrēna, ģībonis, tahikardija, vazodilatācija, anoreksija, caureja, gastroenterīts, kuņģa-zarnu trakta traucējumi, slikta dūša, vemšana, ekhimoze, perifērā tūska, artrālģija, nemiers, trauksme, apmulsums, nokarena pēdas locītava, hipertonija, nervozitāte, nistagms, runas traucējumi, trīsas, reiboņi, bronhīts, aizdusa, laringospazmas, rinīts, eritēma, parastā herpe, nieze, izsitumi, ādas mezgliņi, svīšana, nātrene, ausu sāpes, acu slimības, dismenoreja, neatliekama vajadzība urinēt, vai vaginālā kandidoze.

7. Medikaments vai glatiramēra acetāts, kuru izmanto saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur injekcijas vietas reakcija ir eritēma, asiņošana, sacietēšana, iekaisums, uztūkums, sāpes, nieze, nātrene, vai sabiezējums, kas nekavējoši izveidojas ap injekcijas vietu.

8. Medikaments izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. pretenzijas vai no 3. līdz 8. pretenzijai, kur medikaments ir farmaceitiska kompozīcija, kas satur 40 mg/ml glatiramēra acetātu.

9. Medikaments izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. pretenzijas vai no 3. līdz 8. pretenzijai vai glatiramēra acetāts, kuru izmanto saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai, kur ārstēšana ietver recidīvu biežumu samazināšanu pacientam.

10. Medikaments izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. pretenzijas vai no 3. līdz 8. pretenzijai, kuru izmanto, lai samazinātu recidīvu biežumu pacientam, kurš cieš no recidivējoši remitējošas izkaisītās sklerozes.

11. Glatiramēra acetāts, kuru izmanto saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai, lai samazinātu recidīvu biežumu pacientam, kurš cieš no recidivējoši remitējošas izkaisītās sklerozes.

12. Medikaments izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. pretenzijas vai no 3. līdz 8. pretenzijai, kuru izmanto pacienta ārstēšanai, kurš ir pieredzējis pirmo klīnisko epizodi un kuram ir augsts risks saslimt ar klīniski noteikto izkaisīto sklerozi.

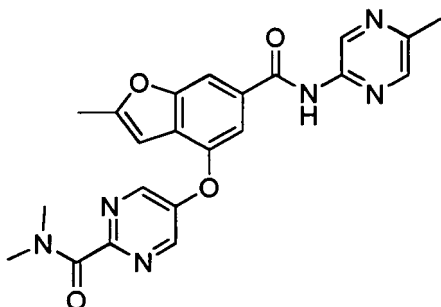
13. Glatiramēra acetāts, kuru izmanto saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai pacienta ārstēšanai, kurš ir pieredzējis pirmo klīnisko epizodi un kuram ir augsts risks saslimt ar klīniski noteikto izkaisīto sklerozi.

14. Medikaments izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 3. līdz 9., 10. vai 12. pretenzijai, vai glatiramēra acetāts, kuru izmanto saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7., 9., 11. vai 13. pretenzijai, kur

pacients ir pieredzējis pirmo klīnisko epizodi un kuram ir augsts risks saslimt ar klīniski noteikto izkaisīto sklerozi, un kur pacientam ir vismaz viens smadzeņu bojājums, kurš nosakāms ar MRI (magnētiskā rezonanse) skenēšanu un kas liecina par izkaisīto sklerozi.

15. Medikaments izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 3. līdz 10., 12. vai 14. pretenzijai, vai glatiramēra acetāts izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7., 9., 11. vai 13. un 14. pretenziju, kur glatiramēra acetāts tiek lietots, pacientam pašam izmantojot pilnšjirci ar pašārstēšanās metodi.

- (51) **C07D 405/14**<sup>(200601)</sup> (11) **2406253**  
**A61K 31/497**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/506**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 3/04**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 3/10**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10708644.9 (22) 04.03.2010  
(43) 18.01.2012  
(45) 03.07.2013  
(31) 159099 P (32) 11.03.2009 (33) US  
(86) PCT/IB2010/050943 04.03.2010  
(87) WO2010/103437 16.09.2010  
(73) Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, US  
(72) LING, Anthony Lai, US  
PFEFFERKORN, Jeffrey Allen, US  
(74) Pfizer, European Patent Department, 23-25 avenue du Docteur Lannelongue, 75668 Paris Cedex 14, FR  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV  
(54) **BENZOFURANILA ATVASINĀJUMI, KO IZMANTO PAR GLUKOKINĀZES INHIBITORIEM**  
**BENZOFURANYL DERIVATIVES USED AS GLUCOKINASE INHIBITORS**  
(57) 1. Savienojums, kas ir N,N-dimetil-5-(2-metil-6-((5-metilpirazin-2-il)karbamoil)benzofuran-4-iloksi)pirimidīn-2-karboksamīds vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar šādu struktūru:



3. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur (i) savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli; un (ii) farmaceutiski pieņemamu pildvielu, atšķaidītāju vai nesēju.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur minētais savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls ir klātesošs terapeitiski efektīvā daudzumā.

5. Kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu papildu farmaceutisku līdzekli, kas izvēlēts no rindas, kas sastāv no pretaptaukošanās līdzekļa un pret diabēta līdzekļa.

6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētais pretaptaukošanās līdzeklis ir izvēlēts no rindas, kas sastāv no dirlopatīda, mitratapīda, implitapīda, R56918 (CAS Nr. 403987), CAS Nr. 913541-47-6, lorkaserīna, cetilistata, PYY 3-36, naltreksona, oleoilēstrona, obinēpītīda, pramlintīda, tezofenzīna, leptīna, liraglutīda, bromkriptīna, orlistata, eksenatīda, AOD-9604 (CAS Nr. 221231-10-3) un sibutramīna.

7. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētais pret diabēta līdzeklis ir izvēlēts no rindas, kas sastāv no metformīna, acetoheksamīda, hlorpropamīda, diabinēza, glibenklamīda, glibipizīda, gliburīda, glimepirīda, gliklazīda, glipentīda, glikvidonā, glizolamīda, tolazamīda, tolbutamīda, tendamistata, trestatīna, akarbozes, adipozīna, kamiglibozes, emiglitāta, miglītola, voglibozes, pradimicīna-q,

salbostatīna, balaglitazona, ciglitazona, darglitazona, englitazona, izaglitazona, pioglitazona, rozigitazona, troglitazona, eksendīna-3, eksendīna-4, troduskvemina, rezervatrola, hirtiozāla ekstrakta, sitagliptīna, vildagliptīna, alogliptīna un saksagliptīna.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai, ārstējot tuklumu un ar tuklumu saistītus traucējumus dzīvniekos.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai, ārstējot 2. tipa diabētu vai ar diabētu saistītus traucējumus dzīvniekos vai palēninot 2. tipa diabēta vai ar diabētu saistītu traucējumu attīstīšanos vai progresēšanu dzīvniekos.

- (51) **A01F 15/07**<sup>(200601)</sup> (11) **2407023**  
**A01F 15/08**<sup>(200601)</sup>  
**A01F 25/14**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10169230.9 (22) 12.07.2010  
(43) 18.01.2012  
(45) 05.06.2013  
(73) Trioplast AB, P.O. Box 143, 333 00 Smålandsstenar, SE  
(72) ÖHRN, Lars, SE  
LILJEGREN, Mikael, SE  
(74) Zakrisson, Ulrika, et al, Awapatent AB, P.O. Box 45086, 104 30 Stockholm, SE  
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
(54) **MATERIĀLA FORMĒŠANAS UN IETĪŠANAS PAŅĒMIENS UN IERĪCE**  
**APPARATUS AND METHOD FOR FORMING AND WRAPPING MATERIAL**

(57) 1. Formēšanas un ietīšanas bloks (2) materiāla formēšanai vienā gabalā (20) un minētā materiāla ietīšanai, kur formēšanas un ietīšanas bloks (2) ir pielāgots tā piestiprināšanai pie materiāla piegādes bloka, kur minētais formēšanas un ietīšanas bloks (2) satur:

- formēšanas kameru (6) materiāla formēšanai vienā gabalā, turklāt minētajai kamerai ir padeves atvere materiāla padevei kamerā un izvades atvere minētā viena gabala materiāla izstumšanai no kameras;

- līdzeklis (4) minētā viena gabala ietīšanai sloksnē; kas raksturīgs ar to, ka tas papildus satur:

- vadības bloku, kas pielāgots minētā līdzekļa materiāla ietīšanai sloksnē vadīšanai,

turklāt vismaz viens no minētajiem - līdzeklis materiāla ietīšanai sloksnē vai vadības bloks - ir pielāgots darbināšanai neatkarīgi no materiāla padeves ātruma, ar kādu materiālu padod formēšanas kamerā.

2. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur orientējošo elementu (7), kas izvietots kā minētās formēšanas kameras turpinājums, turklāt minētais līdzeklis materiāla ietīšanai sloksnē ir izveidots tā, lai ar sloksni aptītu vismaz daļu orientējošā elementa.

3. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur minētajai formēšanas kamerai ir regulējams izmērs un/vai šķērsriezums.

4. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur minētajam orientējošajam elementam ir regulējams izmērs un/vai šķērsriezums.

5. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur minētais līdzeklis materiāla ietīšanai sloksnē satur vismaz vienu sloksnes devēju, kas ir izvietots uz vismaz vienas virzošās sliedes (9).

6. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur minētais līdzeklis materiāla ietīšanai sloksnē satur vismaz vienu turētāju (10), vēlams izbīdāmu turētāju, kam ir vismaz viens sloksnes devējs (11).

7. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju, kur minētais līdzeklis materiāla ietīšanai sloksnē satur 2 līdz 6 sloksnes devējus.

8. Formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur vismaz vienu sensoru (16) minētā materiāla kompresijas pakāpes kontrolei.

9. Ierīce (1) materiāla formēšanai vienā gabalā un minētā materiāla ietīšanai, kas satur:

- minētā materiāla padeves nodrošināšanas līdzekli,
  - pirmo vadības bloku minētā materiāla piegādes līdzekļa vadīšanai,
  - formēšanas un ietīšanas bloku (2) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai,
- kur minētais pirmais vadības bloks minētā materiāla padeves nodrošināšanas līdzekļa vadīšanai un vadības bloks materiāla ietīšanai sloksnē ir darbināmi atsevišķi.

10. Ierīce saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus satur:

- vismaz vienu stiepli (5), kuras tuvākais gals ir piestiprināts pie minētā materiāla padeves nodrošināšanas līdzekļa vai pie formēšanas un aptīšanas bloka aizmugurējās sienas;
- stieples atbrīvotāju, kas ir pielāgots minētās stieples atbrīvošanai.

11. Ierīce saskaņā ar 10. pretenziju, kas papildus satur līdzekli minētās stieples atbrīvošanas ātruma, ar kādu stieples atbrīvotājs stiepli atbrīvo, mērīšanai.

12. Ierīce saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju, kur minētās stieples tālākais gals ir piestiprināts pie atbilstošas stieples balstierīces (18) viengabala materiāla tālākajā galā, kur minētā stieple ir izvietota tā, lai materiāla padeves un/vai aptīšanas laikā tā tiktu ietīta viengabala materiālā.

13. Paņēmiens materiāla formēšanai un ietīšanai vienā gabalā, kas satur:

- minētā materiāla padevi uz ietīšanas pozīciju materiāla formēšanas laikā;
  - sloksnes aptīšanu ap minēto materiālu tā, ka sloksne vismaz daļēji nosedz iepriekšējo aptītās sloksnes kārtu;
  - aptītā materiāla pārvietošanu no minētās aptīšanas pozīcijas uz uzglabāšanas pozīciju;
- kas raksturīgs ar to, ka stadija, kurā minēto materiālu padod uz aptīšanas pozīciju, un stadija, materiāla aptīšanai ar sloksni, tiek vadītas atsevišķi.

14. Paņēmiens saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur minētā materiāla kompresijas pakāpes kontroli materiāla padeves laikā.

15. Paņēmiens saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu stadiju, kurā tiek regulēts formēšanas kameras, kuru izmanto minētā viengabala materiāla formēšanai, diametrs.

16. Paņēmiens saskaņā ar 15. pretenziju, kurā tiek izmantots formēšanas un ietīšanas bloks saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 8. pretenzijai, kas satur vienu stadiju minētā viengabala materiāla diametra palielināšanai, palielinot formēšanas kameras diametru, un vienu tai sekojošu stadiju minētā viengabala materiāla diametra samazināšanai, samazinot formēšanas kameras diametru.

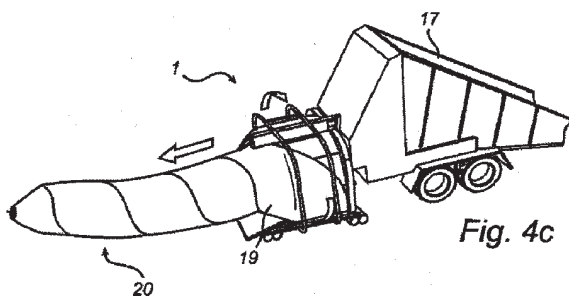


Fig. 4c

Valters GENCS, Zvērināta advokāta Valtera Genca birojs, Kr. Valdemāra iela 21, Rīga LV-1010, LV

(54) **PRESFORMĀ VEIDOTA AR ŠOKOLĀDI PILDĪTA SŪKĀJAMĀ KONFEKTE UN TĀS RAŽOŠANAS PAŅĒMIENS DIE FORMED LOLLIPOP FILLED WITH CHOCOLATE AND METHOD OF MANUFACTURE THEREOF**

(57) 1. Pildītas sūkājamas konfektes ražošanas paņēmiens, kurš ietver šādus soļus:

- a) vismaz vienas vārītas saldumu masas pagatavošana,
- b) vārītās saldumu masas pārstrāde auklā ar dobu vidu,
- c) auklas tukšā dobuma aizpildīšana ar cieta ēdama savienojuma daļiņām, kas satur šokolādes serdi,
- d) ja nepieciešams, auklas sagriešana gabalos ar vēlamo svaru,
- e) kociņa ievietošana auklā vai auklas gabaliņos tā, lai tas ietu cauri stiklences masai un vismaz daļai dobā slāņa pildījuma,
- f) auklas vai gabaliņu presformēšana konfektēs tā, lai šokolādi saturošā daļa būtu aptverta ar ārējo stiklences masu,
- g) konfekšu atzdesēšana.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā stiklences masas temperatūra a) līdz f) soļos ir augstāka par šokolādes kušanas temperatūru.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, kurā stiklences masas temperatūra ir augstāka par 30°C.

4. Paņēmiens saskaņā ar 3. pretenziju, kurā stiklences masas temperatūra ir augstāka par 40°C, bet zemāka par 90°C.

5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā solis b) tiek veikts ar presi vai veltni.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā auklas diametrs pirms soļa d) tiek pielāgots nepieciešamajam platumam ar virkni auklas uztvērējiekārtas diskiem.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kurā soļi d) un e) tiek veikti, izmantojot rotācijas vai sērijveida presformas.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kurā daļiņas, kas satur šokolādes serdi, pēc soļa c) tiek ievietotas atsevišķā masā.

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kurā šokolādes serdi saturošās daļiņas soļa f) laikā tiek ievietotas atsevišķā masā.

10. Paņēmiens saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kurā atsevišķā masa tiek pievienota pie stiklences slāņa.

11. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā soļa c) daļiņas tiek ražotas procesā, kas ietver šādus soļus:

- h) nodrošināšana ar daļiņām, kas satur šokolādi,
- i) nodrošināšanu ar grūti kūstošu sastāvu,
- j) soļa h) šokolādes daļiņu pārklāšana ar soļa i) sastāvu.

12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, kurā grūti kūstošā sastāva cieta daļiņu procentuālais īpatsvars pie 40°C ir augstāks par 90 %.

13. Pildīta sūkājamā konfekte, kas iegūta ar paņēmienu, kas atbilst jebkurai no 1. līdz 12. pretenzijai.

(51) **A23G 3/00<sup>(200601)</sup>** (11) **2407032**  
**A23G 3/56<sup>(200601)</sup>**  
**A23G 3/54<sup>(200601)</sup>**

(21) 10169437.0 (22) 13.07.2010  
 (43) 18.01.2012  
 (45) 03.07.2013

(73) Perfetti Van Melle S.p.A., Via XXV Aprile, 7, 20020 Lainate, IT

(72) BOTTINI, Alessandro, IT  
 HERNANDEZ TANTINA, Jorge, IT

(74) Minoja, Fabrizio, Bianchetti Bracco Minoja S.r.l., Via Plinio 63, 20129 Milano, IT

(51) **A61K 31/517<sup>(200601)</sup>** (11) **2411009**  
**A61P 25/00<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/16<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/02<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/14<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/28<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/30<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/08<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/18<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/22<sup>(200601)</sup>**  
**A61P 25/24<sup>(200601)</sup>**

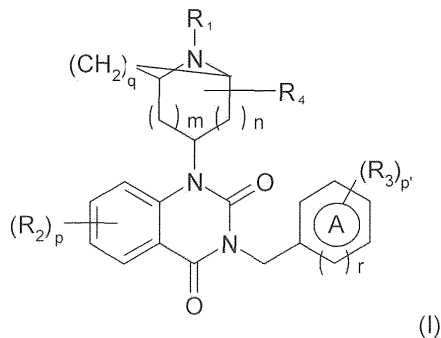
(21) 10715983.2 (22) 25.03.2010  
 (43) 01.02.2012  
 (45) 20.03.2013  
 (31) 0901460 (32) 27.03.2009 (33) FR  
 (86) PCT/FR2010/050549 25.03.2010  
 (87) WO2010/109148 30.09.2010  
 (73) SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR  
 (72) MARCINIAK, Gilbert, FR  
 NAVE, Jean-François, FR  
 VIVIANI, Fabrice, FR



(74) Veinante, Aude, et al, Sanofi Département Brevets 174, avenue de France, 75013 Paris, FR  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **HINAZOLĪNDIONU ATVASINĀJUMU TERAPEITISKAS IZMANTOŠANAS**  
**THERAPEUTIC USES OF QUINAZOLINEDIONE DERIVATIVES**

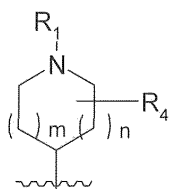
(57) 1. Savienojuma ar vispārīgo formulu (I)



izmantošana,  
kurā

- A ir arilgrupa vai heteroarilgrupa;
- R<sub>1</sub> ir:
  - ūdeņraža atoms,
  - -C(O)R, kurā R ir ūdeņraža atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa, arilgrupa, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupa vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, minēto alkilgrupu neobligāti aizvieto ar:
    - vienu vai vairākām hidroksilgrupām;
    - benziloksigrupu,
    - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu, ko neobligāti aizvieto ar arilgrupu, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupu,
  - neobligāti aizvietota (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa;
- R<sub>2</sub> ir:
  - ūdeņraža atoms,
  - halogēna atoms,
  - ciāngrupa,
  - nitrogrupa,
  - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar -NH<sub>2</sub> vai arī ar -NHC(O)Rb grupu, kur Rb ir, kā definēts turpmāk,
    - -ORa grupa, kurā Ra ir:
      - ūdeņraža atoms,
      - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām, ar arilgrupu un/vai vienu vai vairākām ciāngrupām,
        - (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkinilgrupa,
        - arilgrupa;
      - R<sub>3</sub> ir:
        - ūdeņraža atoms,
        - halogēna atoms,
        - hidroksilgrupa,
        - ciāngrupa,
        - -SCF<sub>3</sub> grupa,
        - nitrogrupa,
        - oksogrupa,
        - -S(O)<sub>0-2</sub>-alkilgrupa, -S(O)<sub>0-2</sub>-heterocikloalkilgrupa, -O-SO<sub>2</sub>-arilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem,
          - -alkilaminoalkilgrupa vai cikloalkilaminoalkilgrupa, kur katru neobligāti aizvieto gala alkilgrupā,
          - neobligāti aizvietota sulfonamīdgrupa,
          - arilgrupa vai heteroarilgrupa, kur minētā grupa ir monocikliska vai policikliska, kā arī neobligāti aizvietota ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, vienu vai vairākiem halogēna atomiem un ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu,
          - heterocikloalkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu,
          - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar:
            - vienu vai vairākiem halogēna atomiem,
            - arilgrupu, kuru var aizvietot ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām,
            - heteroarilgrupu,

- vienu vai vairākām hidroksilgrupām, kuras var tikt aizvietotas ar arilgrupu, ko pašu neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, vai
  - heterocikloalkilgrupu, ko neobligāti aizvieto ar CO(O)Ra grupu vai ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, kur Ra ir definēts iepriekš, -C(O)NRbRc grupu, kur Rb un Rc ir, kā definēts turpmāk,
    - -C(O)ORc grupa vai -O-C(O)ORc grupa, kur Rc ir, kā definēts turpmāk,
    - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa, ko neobligāti aizvieto ar
      - aminoalkilgrupu,
      - aminocikloalkilgrupu,
      - cikloalkilgrupu,
      - heterocikloalkilgrupu,
      - monociklisku vai policiklisku heteroarilgrupu,
    - vienu vai vairākām hidroksilgrupām,
    - vienu vai vairākiem halogēna atomiem,
    - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu,
    - -C(O)ORc grupu, kur Rc ir, kā definēts turpmāk,
    - -C(O)NRbRc grupu, kur Rb un Rc ir, kā definēts turpmāk,
    - oksogrupu, un/vai
- arilgrupu, ko neobligāti arī aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu, -O-halogēnalkilgrupu un/vai halogēnalkilgrupu,
  - -O-cikloalkilgrupa, -O-arilgrupa vai -O-heterocikloalkilgrupa, katru neobligāti aizvieto ar
    - arilgrupu, kuru neobligāti pašu aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu,
    - oksogrupu,
    - vienu vai vairākiem halogēna atomiem, un/vai
    - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, kuru neobligāti arī var aizvietot ar arilgrupu un/vai oksogrupu,
      - -NH-CO-NH-arilgrupa, -NH-CO-NH-heteroarilgrupa vai -NH-CO-NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, katru neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, ciāngrupu, nitrogrupu, vienu vai vairākām hidroksilgrupām vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu,
      - -N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, kur (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa var tikt aizvietota ar
        - vienu vai vairākām oksogrūpām un/vai
        - vienu vai vairākām arilgrupām, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem un SO<sub>2</sub> grupu,
        - -NH-CO-arilgrupa un -NH-CO-heteroarilgrupa, katru neobligāti var aizvietot ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;
  - vai arī R<sub>3</sub> kopā ar A veido policiklisku heteroarilgrupu, ko neobligāti aizvieto ar (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupu vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, ko neobligāti aizvieto ar arilgrupu, kuru pašu var aizvietot ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;
    - R<sub>3</sub> ir ūdeņraža atoms, oksogrupa vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa;
    - Rb ir:
      - ūdeņraža atoms,
      - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām, ciāngrupām, aminogrupām, heterocikloalkilgrupām, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrūpām vai arilgrupām, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem,
        - (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupa,
        - (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkinilgrupa,
        - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupa,
        - arilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem,
      - Rc ir ūdeņraža atoms vai (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem,
        - -NH-CO-arilgrupa un -NH-CO-heteroarilgrupa, katru neobligāti var aizvietot ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, ar kuru tie ir saistīti, veido policiklisku heteroarilgrupu vai heterocikloalkilgrupu;
    - m un n, cits no cita neatkarīgi, ir 0, 1 vai 2, saprotot, ka m+n ir 3;
    - p un p', cits no cita neatkarīgi, ir 1, 2 vai 3, saprotot, ka, ja p ir lielāks par vai vienāds ar w, tad R<sub>2</sub> grupas ir pie atsevišķiem oglekļa atomiem un var būt atšķirīgas, un, ja p' ir lielāks par vai vienāds ar 2, tad R<sub>3</sub> grupas ir pie atsevišķiem oglekļa atomiem un var būt atšķirīgas;
      - q ir 0 vai 2, saprotot, ka, ja q = 0, tad slāpekli saturoša heterocikliska grupa, kura atrodas 2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahidrohinazolīna gredzena sistēmas 1. pozīcijā, vairs nav savienota ar tiltiņu un tā ir šāda tipa grupa:



kur  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $m$  un  $n$  ir, kā definēts iepriekš;

-  $r$  ir 0 vai 1;

bāzes vai skābes pievienošanās sāls veidā;

lai iegūtu medikamentu, kas paredzēts šādu slimību ārstēšanai un/vai profilaksei: psihiatriski un neiroloģiski traucējumi, kuru starpā psihiatriskos traucējumus izvēlas no trauksmainības, depresijas, garastāvokļa traucējumiem, bezmiega, maniakāliem traucējumiem, uzbāzīgiem stāvokļiem, psihozēm, ar šizofrēniju saistītiem traucējumiem, uzmanības deficīta un hiperaktivitātes (*ADHD*) bērnos ar hiperkinētiskām īpašībām, ar psihotropu vielu lietošanu saistītiem traucējumiem, jo īpaši pārmērīgas lietošanas un/vai atkarības no vielas gadījumā, ieskaitot atkarību no alkohola un/vai atkarību no nikotīna, migrēnas, stresa, ar psihosomatiskas izcelsmes slimībām saistītiem traucējumiem, panikas lēkmēm, epilepsijas, atmiņas traucējumiem, izziņas spēju traucējumiem, jo īpaši senilās plānprātības vai ar Alcheimera slimību saistītiem traucējumiem, un uzmanības traucējumiem vai bezmiega, išēmijas, ar smadzeņu traumu saistītiem traucējumiem vai ar akūtām vai hroniskām neirodeģeneratīvām slimībām saistītiem traucējumiem, ieskaitot horeju un Hantingtona horeju, un neiroloģiskiem traucējumiem, kuri parādās kā kustību anomālijas vai motorikas traucējumi un ir saistīti ar patoloģiju, ko izvēlas no diskinēzijas, Pārkinsona slimības, postencefalīta parkinsonisma, dopa sensitīvās distonijas, Šaja-Dreidžera sindroma, periodiska locītavu kustību traucējuma (*PLMD*) sindroma, periodisku locītavu kustību miegā (*PLMS*) sindroma, Tureta sindroma vai nemierīgo kāju (*RLS*) sindroma.

2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kustību anomālijas vai motorikas traucējumi ir saistīti ar Pārkinsona slimību.

3. Izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kustību anomālijas vai motorikas traucējumus izvēlas no tremora miera stāvoklī, stīvuma, bradikinēzijas un deficīta posturālajos refleksos.

4. Izmantošana saskaņā ar vienu no 1. līdz 3. pretenzijai (a) ar šizofrēniju saistītu traucējumu ārstēšanai un/vai profilaksei, jo īpaši (i) pozitīvu vai negatīvu simptomu profilaksei un/vai ārstēšanai, un/vai (ii) atmiņas deficīta profilaksei un/vai ārstēšanai, (b) ar Pārkinsona slimību saistītu traucējumu ārstēšanai un/vai profilaksei, jo īpaši (i) motorikas traucējumu, depresijas un/vai izziņas spēju traucējumu simptomu profilaksei un/vai ārstēšanai, un/vai (ii) to pamatārstēšanai, un/vai (c) ar Alcheimera slimību saistītu traucējumu ārstēšanai un/vai profilaksei, jo īpaši (i) izziņas spēju traucējumu simptomu un/vai uzvedības traucējumu profilaksei un/vai ārstēšanai, un/vai (ii) to pamatārstēšanai.

5. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka neiroloģiskie traucējumi parādās kā kustību anomālijas vai motorikas traucējumi, kas ir saistīti ar muguras smadzeņu traumu, jo īpaši muguras traumu.

6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka A ir fenilgrupa vai pirdilgrupa.

7. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka  $q = 0$  un  $m$  un  $n$  katrs ir 1.

8. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka  $R_2$  ir  $(C_1-C_6)$ alkilgrupa, jo īpaši metilgrupa, ko aizvieto ar  $-NH-C(O)-Rb$  grupu, un  $Rb$  ir, kā definēts 1. pretenzijā.

9. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka  $R_2$  ir  $-ORa$  grupa, un  $Ra$  ir, kā definēts 1. pretenzijā.

10. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka  $R_2$  ir halogēna atoms vai ciāngrupa, vai ūdeņraža atoms, vai hidroksilgrupa, vai  $(C_1-C_6)$ alkilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar  $-NH_2$ , vai arī ar  $-NHC(O)Rb$  grupu, un  $Rb$  ir, kā definēts 1. pretenzijā.

11. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka A ir fenilgrupa, R ir  $-C(O)R$  grupa, kurā

R ir ūdeņraža atoms, q ir vienāds ar 0, n un m katrs ir 1, un  $R_2$  ir  $-ORa$ , un  $Ra$  ir, kā definēts 1. pretenzijā.

12. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka A ir fenilgrupa, R ir  $-C(O)R$  grupa, kurā R ir ūdeņraža atoms, q ir vienāds ar 0, n un m katrs ir 1, un  $R_2$  ir metilgrupa, ko aizvieto ar  $-NH-CO-Rb$  grupu, un  $Rb$  ir, kā definēts 1. pretenzijā.

13. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka A ir fenilgrupa,  $R_1$  ir  $-C(O)R$  grupa, kurā R ir ūdeņraža atoms, q ir vienāds ar 0, n un m katrs ir 1, p ir vienāds ar 2, viena no  $R_2$  grupām ir  $-ORa$ , kur  $Ra$  ir, kā definēts 1. pretenzijā, un otra  $R_2$  grupa ir halogēna atoms.

14. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka  $R_2$  grupa atrodas 6. pozīcijā 2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolīna gredzena sistēmā un ar to, ka papildus var būt  $R_2$  grupa, kas ir identiska vai atšķirīga no iepriekš minētās  $R_2$  grupas un atrodas 7. pozīcijā 2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolīna gredzena sistēmā, un minētais savienojums ar formulu (I) ir bāzes, hidrāta vai solvāta formā, vai to maisījumu formā.

15. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka savienojumu ar formulu (I) izvēlas no šādiem savienojumiem:

Nr. 1: 2-[[3-(3,4-dimetoksibenzil)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]oksi]propānitrils

Nr. 2: 1-(1-acetilpiperidin-4-il)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-hidroksihinalazolin-2,4(1H,3H)-dions

Nr. 3: [[1-(1-acetilpiperidin-4-il)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]oksi]acetonitrils

Nr. 4: 2-[[1-(1-acetilpiperidin-4-il)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]oksi]propānitrils

Nr. 6: [[3-(3,4-dimetoksibenzil)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]oksi]acetonitrils

Nr. 11: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluometil)etoksi]-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 12: 1-(1-acetilpiperidin-4-il)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluometil)etoksi]hinalazolin-2,4(1H,3H)-dions

Nr. 13: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-dioksko-6-(2,2,2-trifluoretoksi)-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 14: 1-(1-acetilpiperidin-4-il)-6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3,4-dimetoksibenzil)hinalazolin-2,4(1H,3H)-dions

Nr. 16: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 20: N-[[3-(3,4-dimetoksibenzil)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]metil]acetamīds

Nr. 22: 1-(1-acetilpiperidin-4-il)-6-(aminometil)-3-(3,4-dimetoksibenzil)hinalazolin-2,4(1H,3H)-diona hidrohlortīds

Nr. 23: N-[[3-(3,4-dimetoksibenzil)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]metil]formamīds

Nr. 24: N-[[1-(1-acetilpiperidin-4-il)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]metil]formamīds

Nr. 25: N-[[1-(1-acetilpiperidin-4-il)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-dioksko-1,2,3,4-tetrahidrohinalazolin-6-il]metil]acetamīds

Nr. 32: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 33: 4-[3-(3,4-dihlorbenzil)-6-(2,2-difluoretoksi)-2,4-dioksko-3,4-dihidrahinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 34: 4-[3-(4-hlorbenzil)-6-(2,2-difluoretoksi)-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 35: metil 4-[[6-(2,2-difluoretoksi)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,4-dihidrohinalazolin-3(2H)-il]metil]benzoāts

Nr. 36: 4-[[6-(2,2-difluoretoksi)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,4-dihidrohinalazolin-3(2H)-il]metil]benzoscābe

Nr. 37: 4-[[6-(2,2-difluoretoksi)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioksko-1,4-dihidrohinalazolin-3(2H)-il]metil]-N-(2-metoksietil)benzamīds

Nr. 38: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-metil-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 39: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3-hidroksi-4-metoksibenzil)-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 40: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-[3-(2-hidroksietoksi)-4-metoksibenzil]-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 41: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3-etoksi-4-metoksibenzil)-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 42: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-[4-metoksi-3-(2-metoksietoksi)benzil]-2,4-dioksko-3,4-dihidrohinalazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

- Nr. 43: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]azepān-1-karbaldehīds
- Nr. 47: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-[3-(3-hidroksipropoksi)-4-metoksibenzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 48: 4-[5-hlor-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 49: 4-[3-[3-(ciklopentiloksi)-4-metoksibenzil]-6-(2,2-difluoretoksi)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 50: 2-(5-[[6-(2,2-difluoretoksi)-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenoksij)acetamīds
- Nr. 51: 4-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]-3-metilpiperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 52: 3-[6-(2,2-difluoretoksi)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]-8-azabicyklo[3.2.1]oktān-8-karbaldehīds
- Nr. 56: 4-[3-[4-(ciklopentiloksi)-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 57: 4-[3-(3-hlorbenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 58: 4-[3-(4-hlorbenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 59: 4-[3-[3-(ciklopentiloksi)-4-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 72: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-(2-hidroksietoksi)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 74: 4-[3-(3,4-dihlorbenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 76: 4-[3-[[6-hlorpiridin-3-il]metil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 78: 4-[3-(3-hlor-4-metoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 79: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-(2-fluoretoksi)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 89: 2-[5-[[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenoksij)acetamīds
- Nr. 90: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-hidroksi-4-metoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 91: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-etoksi-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 97: 4-[5,7-dihlor-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 102: 4-[7-hlor-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 108: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-fluor-4-metoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 111: 4-[6-(difluormetoksi)-3-(3,4-dimetoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 112: 4-[3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-(1-metiletoksi)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 114: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-metoksi-3-(1-metiletoksi)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 116: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 117: 4-[3-[3,5-bis(trifluormetil)benzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 118: 4-[3-(3-etoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 124: 4-[3-[3-hlor-4-(2-metoksietoksi)benzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 130: 4-[3-(3,4-dietoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 131: 4-[3-(4-etoksi-3-metoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 133: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(4-metoksi-3-metilbenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 134: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-[4-(trifluormetil)benzil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 135: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-(3-fenoksibenzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 143: 4-[3-[4-(benziloksi)-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 145: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksi-4-nitrobenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 155: 4-[3-(4-etoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 158: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(morfolin-4-ilmetil)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 160: 4-[6[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(4-morfolin-4-ilbenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 165: 4-[3-(bifenil-4-ilmetil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 166: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(metilsulfanil)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 167: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-(4-piridin-3-il)benzil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 170: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksi-4-metilbenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 175: 2-[2-(ciklopentiloksi)-5-[[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]fenoksij)acetamīds
- Nr. 178: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksi-4-propoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 183: 2-[2-(ciklopentiloksi)-5-[[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]fenoksij-N-metilacetamīds
- Nr. 184: 2-[2-(ciklopentiloksi)-5-[[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]fenoksij-N,N-dimetilacetamīds
- Nr. 185: 2-[2-(ciklopentiloksi)-5-[[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]fenoksij-N-metoksi-N-metilacetamīds
- Nr. 186: 4-[3-[4-(ciklopentiloksi)-3-etoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 188: 4-[3-[4-(ciklopentiloksi)-3-(1-metiletoksi)benzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 189: 4-[3-[4-(ciklopentiloksi)-3-propoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 190: 4-[3-[4-(ciklopentiloksi)-3-hidroksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 193: 4-[3-[4-(difluormetoksi)-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 194: 4-[3-[4-(difluormetoksi)-3-etoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 200: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-(4-(tiofen-3-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 201: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-(4-(piridin-4-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 203: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(1-metil-1H-indol-6-il)metil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 206: 4-[3-[4-(ciklopropilmetoksi)-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 207: 2-[4-[[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenoksij]-N-metilacetamīds
- Nr. 212: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-[4-(1H-pirazol-1-il)benzil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 213: 4-[6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-(4-(piridin-2-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds



- Nr. 215: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-(4-(tiofen-2-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 216: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-(hinolin-7-ilmetil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 218: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(6-metoksinaftalin-2-il)metil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 223: 4-{3-[4-(1H-benzimidazol-1-il)benzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 224: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(2-metilpropoksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 226: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(tetrahidrofuran-3-iloksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 228: 4-{3-[4-[(1-benzilpirolidin-3-il)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 230: 4-{3-(1-benzotiofen-5-ilmetil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 232: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(1-metiletoksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 233: 4-{3-[3,4-dimetoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 234: 4-{3-[4-[(1-acetilpirolidin-3-il)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 239: 4-{3-[4-[(4-fluorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 240: 4-{3-[4-[(4-hlorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 242: 4-{3-[4-[(3-hlorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 243: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-(3-(tiofen-3-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 245: 4-{3-(4-etoksi-3-metoksibenzil)-6-(2-hidroksietoksi)-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 246: 4-{3-[4-[2-(2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetoksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 250: 4-{3-[4-[(3,4-dihlorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 251: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(2-okso-2-(piperidin-1-il)etoksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 254: 4-{3-[3-etoksi-4-(tiofen-2-ilmetoksi)benzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 258: 4-{3-[3,4-dimetoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(hidroksimetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 263: (2R)-2-[2-(ciklopentiloksi)-5-({6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioakso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]}metil)fenoksi]propānskābe
- Nr. 264: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(1-metil-3-(tiofen-2-il)-1H-pirazol-5-il)metil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 270: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(5-metil-1,2,4-oksadiazol-3-il)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 275: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-(4-(pirimidin-5-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 276: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(1-metil-3-fenil-1H-pirazol-5-il)metil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 278: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-[(6-(1H-pirazol-1-il)piridin-3-il)metil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 279: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-[(2-(tiofen-2-il)pirimidin-5-il)metil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 280: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 282: 4{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(3-metil-1,2,4-oksadiazol-5-il)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 283: 2-[(ciklopentiloksi)-5-({6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioakso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]}metil)fenoksi]etiķskābe
- Nr. 285: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-(tien[2,3-b]pīridin-2-ilmetil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 286: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-[(6-fenilpiridin-3-il)metil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- No. 287: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(6-(morfolin-4-il)piridin-3-il)metil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- No. 289: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-[(6-(tiofen-2-il)piridin-3-il)metil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 292: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(1-metil-5-fenil-1H-pirazol-3-il)metil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 294: 4-({6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioakso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il)}metil)bifenil-2-karbonitrils
- Nr. 295: (2R)-2-[2-(ciklopentiloksi)-5-({6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioakso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il)}metil)fenoksi]-N-metilpropānamīds
- Nr. 297: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3-(4-(tiofen-2-il)benzil)-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 298: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(morfolin-4-ilmetil)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 299: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(piperidin-1-ilmetil)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 300: 4-{3-[4-[(3,4-dihlorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 301: 2-[2-(ciklopentiloksi)-5-({6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioakso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il)}metil)fenoksi]-N-etilacetamīds
- Nr. 302: (2S)-2-[2-(ciklopentiloksi)-5-({6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-dioakso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il)}metil)fenoksi]propānskābe
- Nr. 305: 4-{6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksi-4-[(3R)-2-okso-1-fenilpirolidin-3-il]oksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 306: 4-{3-[4-(ciklobutilmetoksi)-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 307: 4-{3-[4-(benziloksi)-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 308: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(4-hidroksi-3-metoksibenzil)-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 309: 4-{3-[4-(ciklopropilmetoksi)-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 310: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(2-metilpropoksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 311: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(1-metiletoksi)benzil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 312: 4-[3-(4-etoksi-3-metoksibenzil)-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 315: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[(6-(3-metoksi-fenil)piridin-3-il)metil]-2,4-dioakso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]}piperidīn-1-karbaldehīds



- Nr. 316: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[[6-(2-fluorfenil)piridin-3-il]metil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 317: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[[6-(4-fluorfenil)piridin-3-il]metil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 318: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[[6-(4-metoksifenil)piridin-3-il]metil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 319: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-[[6-(tiofen-2-il)piridin-3-il]metil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 320: 4-{3-[3-etoksi-4-(tiofen-2-ilmetoksi)benzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 321: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 322: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-(4-pirimidin-5-il)benzil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 323: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[[1-metil-3-(tiofen-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 324: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[3-metoksi-4-(2-okso-2-(piperidin-1-il)etoksi)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 325: 4-{3-[4-[2-(2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetoksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 326: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(5-metil-1,2,4-oksadiazol-3-il)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 327: 4-{3-[4-[[3-hlorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 328: 4-{3-[[6-(3,5-dihlorfenil)piridin-3-il]metil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 329: 4-[[7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]bifenil-2-karbonitrils
- Nr. 330: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-[4-(1H-pirazol-1-il)benzil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 331: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[[6-(3-fluorfenil)piridin-3-il]metil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 332: 3-[5-[[7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]piridin-2-il]benzonitrils
- Nr. 333: 4-[3-(3,4-dietoksibenzil)-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 334: 4-[3-[4-[[4-hlorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 335: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(morfolin-4-ilmetil)benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- No. 336: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-[[6-(1H-pirazol-1-il)piridin-3-il]metil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 337: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-[4-(morfolin-4-il)-benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 338: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksi-4-propoksibenzil)-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 339: 4-[3-[4-(1H-benzimidazol-1-il)benzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 340: 5-[[7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksibenzonitrils
- Nr. 341: 3-(3,4-dimetoksibenzil)-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahidrohiazolīn-7-karbonitrils
- Nr. 342: 4-[3-(4-brombenzil)-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 343: 4-[3-[4-[[3,4-dihlorbenzil]oksi]-3-(2-metoksietoksi)benzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 344: 4-[3-[4-(benziloksi)benzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 345: 4-[3-[4-[[3,4-dihlorbenzil]oksi]-3-etoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 349: 4-[3-[4-[[3,4-dihlorbenzil]oksi]-3-(2-fluoretoksi)benzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 350: 4-[3-[4-[[2-hlor-4-fluorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 351: 4-[3-[4-[[2,4-dihlorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 352: 4-[3-[4-[[2-hlor-6-fluorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 353: 4-[3-[4-[[2,6-dihlorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 354: 4-[3-[4-[[2-hlorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 355: 4-[7-fluor-3-[4-[[2-fluorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 357: 2-[[3-(4-dihlorbenzil)oksi]-5-[[7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidin-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]benzonitrils
- Nr. 358: 4-[3-[4-[[3,4-dihlorfenoksi)metil]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 360: 4-{7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3-[4-(2-fenietil)benzil]-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 362: 4-[3-[4-[[4,5-dihlor-2-fluorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 369: 4-[3-[4-[[4-hlorfenoksi)metil]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 371: 4-[3-[3-hlor-4-[[4-hlorbenzil]oksi]-5-etoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 373: 4-[3-[3-hlor-4-[[2,4-dihlorbenzil]oksi]-5-etoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 375: 4-[7-fluor-3-[4-[[4-fluorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 376: 4-[3-[4-[[3,5-dihlorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 377: 4-[3-[4-[[4-hlor-3-(trifluormetil)benzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 379: 4-[3-[4-[[3-hlorfenoksi)metil]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 380: 4-[3-[4-[[3,5-difluorbenzil]oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds
- Nr. 381: 4-[3-[4-(benziloksi)-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds

Nr. 382: 4-[3-{4-[(3-hlor-5-fluorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 383: 4-[7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-(3-metoksi-4-[[4-(trifluormetil)benzil]oksi]benzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 384: 4-[3-{4-[(2,5-dihlorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 385: 4-[[4-[(7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidīn-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenoksi]metil]benzonitrils  
 Nr. 386: 3-[[4-[(7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidīn-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenoksi]metil]benzonitrils  
 Nr. 387: 4-[3-{4-[(4-hlor-2-fluorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 388: 4-[3-{4-[(1-(3,4-dihlorfenil)etoksi)-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 389: 4-[7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-3-4-[(3-hidroksibenziil)oksi]-3-metoksibenzil]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 390: 4-[7-fluor-3-4-[(3-fluorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 391: 4-[3-{4-[(3,4-difluorbenzil)oksi]-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 392: 4-[3-4-[(5,6-dihlor-1H-benzimidazol-1-il)-3-metoksibenzil]-7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-2,4-diokso-3,4-dihidrohiazolin-1(2H)-il]piperidīn-1-karbaldehīds  
 Nr. 393: 4-[(7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidīn-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]fenil 3,4-dihlorbenzolsulfonāts  
 Nr. 394: 4-[(7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidīn-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenil 3,4-dihlorbenzolsulfonāts  
 Nr. 403: 3,4-dihlor-N-[4-[(7-fluor-6-[2-fluor-1-(fluormetil)etoksi]-1-(1-formilpiperidīn-4-il)-2,4-diokso-1,4-dihidrohiazolin-3(2H)-il]metil]-2-metoksifenil]benzamīds bāzes vai skābes pievienošanās sāls veidā.

(51) **B63B 21/00**<sup>(200601)</sup> (11) **2411266**  
 (21) 10711090.0 (22) 29.03.2010  
 (43) 01.02.2012  
 (45) 05.06.2013  
 (31) 2002680 (32) 27.03.2009 (33) NL  
 (86) PCT/NL2010/050160 29.03.2010  
 (87) WO2010/110666 30.09.2010  
 (73) ShoreTension Holding B.V., Heijlplaatweg 7, 3089 JC Rotterdam, NL  
 (72) ZEGELAAR, Willem, Cornelis, NL  
 (74) Jansen, Cornelis Marinus, V.O. Johan de Wittlaan 7, 2517 JR Den Haag, NL  
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
 (54) **PIETAUVOŠANĀS TROSES HIDRAULISKA NOTURĒŠANAS IEKĀRTA**  
**A HYDRAULIC MOORING CABLE HOLDING DEVICE**

(57) 1. Pietauvošanās troses hidrauliska noturēšanas iekārta troses viena gala noturēšanai pie pietauvota kuģa, kas ietver:  
 - hidraulisku cilindru ar virzuli tajā;  
 - tilpni ar hidraulisku šķidrumu un gāzi, turklāt daļa hidrauliskā cilindra virzuļa vienā pusē un tilpne veido funkcionāli noslēgtu hidraulisku sistēmu;  
 - pirmo virzienu vārstu starp tilpni un hidraulisko cilindru minētā virzuļa vienā pusē, kas hidrauliskajam šķidrumam izlases veidā ļauj plūst no tilpnes uz hidraulisko cilindru,  
 - otro virzienu vārstu, kas veido savienojumu starp tilpni un hidraulisko cilindru minētā virzuļa vienā pusē un izlases veidā ļauj

hidrauliskajam šķidrumam plūst no hidrauliskā cilindra uz tilpni, turklāt pirmais un otrais virzienu vārsti ir uzstādīti, lai atvērtos, ja starp pirmo un otru spiedienu ir starpība, no hidrauliskā cilindra uz tilpni, un, attiecīgi, ja otrā spiediena starpība pārsniedz pirmo spiediena starpību ar iepriekš noteiktu sliekšni.

2. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kur pirmais virzienu vārsts ir vienvirzienu vārsts, kas būtībā ir uzstādīts, lai atvērtos, ja spiediens tilpnē pārsniedz spiedienu hidrauliskajā cilindrā, bet otrais virzienu vārsts ir vadības vārsts, kas būtībā ir uzstādīts, lai atvērtos, ja spiediens hidrauliskajā cilindrā pārsniedz spiedienu tilpnē ar iepriekš noteiktu sliekšni.

3. Iekārta saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas ir uzstādīta piestātnē un ar vienu hidraulisko cilindru un virzuli ir piestiprināta pie piestātnes, bet otrs hidrauliskais cilindrs un virzulis ar trosi ir piestiprināti pie kuģa.

4. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas ir uzstādīta ar virzuļa kustības virzienu hidrauliskajā cilindrā paralēli kuģu piestātnē, pie kam trose virzās no iekārtas uz kuģi, izmantojot piestātnes pāli kuģu pietauvošanai.

5. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ietver palīgtilpni un sūkni, kas savieno minēto palīgtilpni ar hidraulisko cilindru no virzuļa otras puses, pretēji minētajai pirmajai pusei.

6. Iekārta saskaņā ar 5. pretenziju, kas ietver vadības vārstu, kas savieno palīgtilpni ar hidraulisko cilindru virzuļa otrā pusē.

7. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ietver ārējo cilindru, turklāt hidrauliskais cilindrs ir ievietots ārējā cilindrā, kur minētā tilpne ietver atstarpi starp ārējo cilindru un hidraulisko cilindru.

8. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ietver vismaz vienu sensoru iekārtas stāvokļa mērīšanai un raidītāju, kas ir savienots ar vismaz vienu sensoru un ir izveidots, lai, pamatojoties uz sensoru datiem, pārraidītu sensoru datus un/vai trauksmes signālus uz attālinātas vadības atrašanās vietu.

9. Iekārta saskaņā ar 8. pretenziju, kur vismaz viens sensors ietver vismaz vienu cilindra stāvokļa detektoru un hidrauliska spiediena sensoru.

10. Sistēma, kas ietver lielu skaitu hidraulisku pietauvošanās trošu noturēšanas iekārtu, kas atbilst iekārtai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas uzstādītas gar piestātni pie kuģu enkurvietas, turklāt katrai iekārtai būtībā ir tāds pats iepriekš noteikts sliekšnis.

11. Kuģa pietauvošanas paņēmieni, izmantojot hidraulisku tilpni ar hidraulisku šķidrumu un gāzi un hidraulisku cilindru ar virzuli, kur hidrauliskā tilpne un hidrauliskais cilindrs virzuļa vienā pusē veido funkcionāli noslēgtu sistēmu hidrauliskam šķidrumam, kur paņēmieni ietver:

- kuģa piesaisti piestātnē ar trosi, virzuli un hidraulisku cilindru secīgi citu pēc cita;
- troses atlaišanu brīvāk, automātiski izlases veidā izlaižot hidraulisko šķidrumu no hidrauliskā cilindra minētā virzuļa vienā pusē uz tilpni, ja šķidruma spiediens hidrauliskajā cilindrā troses radītā spiediena spēka dēļ pārsniedz spiedienu tilpnē vairāk nekā par vienu vērtību;
- vilkšanu trosē ar hidrauliskā šķidruma izlases veidā izlaišanu atpakaļ no tilpnes uz hidraulisko cilindru minētā virzuļa vienā pusē, ja spiediens tilpnē pārsniedz šķidruma spiedienu hidrauliskajā cilindrā vairāk nekā par otru vērtību, kur starpība starp pirmo vērtību un otru vērtību ir vienāda ar iepriekš noteiktu pozitīvu sliekšni.

12. Paņēmieni saskaņā ar 11. pretenziju, kas ietver hidrauliska šķidruma ievadīšanu cilindrā virzuļa otrā pusē, kas ir pretēja pirmajai pusei, piesaistot kuģi piestātnē ar kuģu trosi, izmantojot hidraulisku cilindru un izlaižot hidraulisko šķidrumu no cilindra minētajā otrā pusē pēc tam, kad kuģis ir piesaistīts piestātnē, uzstādot virzuli sākuma stāvoklī.

13. Paņēmieni saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kas ietver liela skaita hidraulisku cilindru ar virzuli izmantošanu, lai pietauvotu kuģi, kur katrs no hidrauliskajiem cilindriem savieno kuģi ar piestātni ar attiecīgu trosi, turklāt tiek uzstādīts sliekšnis, kas būtībā visiem hidrauliskajiem cilindriem ir vienāds.

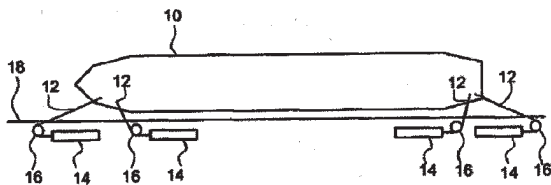


Fig. 1

- |   |                         |
|---|-------------------------|
| (51) <b>F01K 27/00</b> (200601)   | (11) <b>2417332</b>     |
| (21) 10705850.5   | (22) 18.02.2010         |
| (43) 15.02.2012   |                         |
| (45) 17.04.2013   |                         |
| (31) 09157592   | (32) 08.04.2009 (33) EP |
| (86) PCT/EP2010/052027  | 18.02.2010              |
| (87) WO2010/115654  | 14.10.2010              |
| (73) Cohen, Yoav, 5, chemin de la Tour-de-Pinchat, 1234 Vessy, CH                       |                         |
| (72) COHEN, Yoav, CH  |                         |
| (74) Kiliaridis, Constantin, Bugnion S.A. Case Postale 375, 1211 Genève 12, CH          |                         |
| Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV                                    |                         |
| <b>(54) VIDES SILTUMA ENERĢIJAS PĀRVĒRŠANAI DERĪGĀ ENERĢIJĀ PAREDZĒTA IEKĀRTA</b>       |                         |
| <b>INSTALLATION DESIGNED TO CONVERT ENVIRONMENTAL THERMAL ENERGY INTO USEFUL ENERGY</b> |                         |

(57) 1. Iekārta, kas paredzēta noteiktā darba vidē iegūstamas siltuma enerģijas pārvēršanai derīgā enerģijā un ir raksturīga ar to, ka tā satur:

ārēju, vēlams cilindriskas formas, apvalku (OS) ar tajā ierīkoti divvirzienu ventili (63), kurā ievietots iekšējais noslēgts cilindrisks rotors (IR), kas no ārējā apvalka (OS) atdalīts ar vakuumu un kuru ārējais apvalks atbalsta divās atbalsta virsmās (19, 38), turklāt iekšējais rotors (IR) sastāv no trijām dobām cilindriskām daļām, kas izgatavotas no siltumu vadoša materiāla, turklāt viena iekšā otrā ir piestiprināta viena pie otras ap to kopīgo rotācijas asi (18), pirmā daļa ir ārējs noslēgts dobs cilindrs (1), kurā ievietota otrā daļa, kas ir mazāks vidējais cilindrs (2), un trešā daļa, kas ir iekšējais cilindrs (3), ir izveidota iekšā vidējā cilindrā (2) ap kopīgo rotācijas asi, pie kam:

iekšējais cilindrs (3) ir vaļējs abos savos aksiālajos galos un ir aprīkots ar diviem vadāmiem blīvējumiem (41, 42), kuri ļauj noslēgt vai atvērt iekšējā cilindrā (3) izveidoto dobumu (7),

vidējais cilindrs (2) ir noslēgts apkārt iekšējam cilindram (3), veidojot dobumu (40),

iekšējā cilindra (3) siena, viena no vidējā cilindra (2) gala sienām un tai pretī esošā ārējā cilindra (1) siena ir aprīkotas ar siltumizolācijas slāni (26, 25),

vidējā cilindra (2) ar siltumizolācijas slāni (26) aprīkotā gala perifērijā ir ierīkoti vairāki vadāmi ventīļi vai vadāms apvalka veida blīvējums (30), kas ļauj hermētiski sadalīt divās daļās dobumu (4, 5, 6), kurš veidojas starp vidējā (2) un ārējā cilindra (1) sienām, un atvērt vai noslēgt kanālu starp minētajām daļām,

ārējā cilindrā (1) ir ierīkots divvirzienu ventilis (32) un divvirzienu ventili (33),

iekšējā cilindrā (3) ir ierīkoti daudzi propelleri (13), kuri aprīkoti ar līdzekļiem, kas ļauj propelleru rotācijas kustību pārvērst derīgā enerģijā,

ārējā korpusā (OS) ir ievietots motors, kas paredzēts iekšējā rotora (IR) rotācijas uzsākšanai,

ir uzstādīti līdzekļi, lai vadītu motoru (17), propellerus, blīvējumus, lai pārveidotu propelleru rotācijas enerģiju izvadītu ārā no iekārtas, lai uzraudzītu temperatūru un spiedienu iekšējā rotorā (IR),

iekšējā rotorā (IR) iekšā atrodas zem spiediena esošs fluīds.

2. Iekārta atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka ārējā rotora (1) ārējā sānu virsma ir aprīkota ar riņķveidīgām siltuma apmaiņas ribām (23), un ar to, ka ārējā cilindra (1) iekšējā virsma ir aprīkota ar siltuma apmaiņas ribām (21), kuras ir perpendikulāras pret tā virsmu, ir paralēlas tā asij un konverģē virzienā uz rotācijas asi.

3. Iekārta atbilstoši 1. vai 2. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka propelleri ir apgādāti ar līdzekļiem to rotācijas enerģijas pārvēršanai elektriskajā enerģijā.

4. Iekārta atbilstoši jebkurai no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka:

- ārējais cilindrs (1) ir aprīkots ar siltumizolācijas materiāla (70) slāni gredzenveida sekcijas formā, kas ievietota dobuma (6) pusē tuvu noslēgtajam pamatam kā daļa no ārējā cilindra (1),

- gredzenveida slāņa sekcijai (70) ārpusē visapkārt ir piestiprinātas divas gredzenveida plakanas siltumizolācijas materiāla virsmas (71, 72),

- ārējais apvalks (61) ir aprīkots ar gredzenveida siltumizolācijas materiāla slāni (73), kas vērsts pret un ir paralēls uz ārējā cilindra (1) esošajam izolācijas materiāla slānim (70),

- ārējā apvalka (61) iekšpusē apgabalā, kas aprīkots ar minēto gredzenveida siltumizolācijas materiāla slāni (73), ir piestiprinātas divas gredzenveida plakanas siltumizolācijas materiāla virsmas (74, 75),

- pie minētā gredzenveida siltumizolācijas materiāla slāņa (73) ārpusē ir piestiprināta siltumu izolējoša sekcija (76),

- ārējā cilindra (1) pamata gala sienas nav aprīkotas ar siltumu izolējošu slāni,

- pie ārējā cilindra (1) pamata iekšpusē siltumu vadošā veidā ir piestiprinātas vairākas siltumu vadošas siltuma apmaiņas ribas (77),

- ārējā apvalka (OS) iekšpusē dažādos rādiusus ap rotācijas ass abiem galiem siltumu vadošā veidā ir piestiprinātas vairākas siltumu vadošas siltuma apmaiņas ribas (78, 79, 80, 81).

5. Paņēmiens, izmantojot jebkurai no 1. līdz 3. pretenzijai atbilstošu iekārtu, noteiktā darba vidē iegūstamas siltuma enerģijas pārvēršanai derīgā enerģijā, kas raksturīgs ar šādiem soļiem:

- fluīds zem spiediena tiek ievadīts dobumā (60), kas izveidots starp ārējo apvalku (OS) un iekšējo rotoru (IR), tam izplūstot cauri ārējā cilindra (1) neatgriezeniskajam ventilim (32) iekšējā rotora (IR) dobumos;

- pēc tam, kad visi iekšējā rotora (IR) dobumi ar homogēni saspiesto šķidrumu ir piepildīti, šķidruma spiediens ap iekšējo rotoru (IR) tiek samazināts, tādējādi izraisot ārējā cilindra (1) neatgriezeniskā ventīļa (32) noslēgšanos;

- šķidrums tiek izvadīts no dobuma (60) starp ārējo apvalku (OS) un iekšējo rotoru (IR), izsūknējot to ārā, lai sasniegtu gandrīz absolūta vakuuma apstākļus;

- ārējais apvalks (OS) pēc tam tiek ievietots atdzesētā vidē;

- pēc tam, kad vēlāmā zemā temperatūra iekšējā rotorā (IR) viscaur ir sasniegta, blīvējums (42), kas atrodas iekšējā cilindra (3) galā tuvu ar izolējošo slāni aprīkotajām sienām, tiek hermētiski noslēgts, tai pašā laikā iekšējā cilindra (3) otrajā galā esošais blīvējums (41) un daudzie ventīļi vai apvalka veida blīvējums (30) tiek noslēgts tādā veidā, lai ļautu šķidruma plūsmai izlīdzināt spiedienus;

- tiek aktivēts motors (17), iegriežot iekšējo rotoru (IR) līdz vēlamai leņķiskai rotācijas frekvencei ( $\omega$ ), tai pašā laikā ārējais apvalks (OS) tiek turēts tajā pašā aukstajā vidē, kamēr temperatūra rotācijas apstākļos stabilizējas;

- tālāk ārējais apvalks (OS) tiek ievietots darba vidē, kurai ir augstāka temperatūra nekā pēc dzesēšanas, izraisot temperatūras paaugstināšanos iekšējā rotora dobumos, ko rada apkārtējās vides izstarotā siltuma enerģija, kas radiācijas rezultātā tiek saņemta no ārējā apvalka (OS) caur vakuuma dobumu (60), un temperatūra neizolētajos apgabalos paaugstinās daudz mazāk nekā temperatūra neizolētajos apgabalos;

- temperatūras izolētajās un neizolētajās sekcijās tiek monitorēta, regulējot iedarbības laiku, lai sasniegtu maksimālu diferenci un izraisītu atbilstošas blīvumu starpības starp fluīdu aukstākajos apgabalos un fluīdu, kas atrodas siltākajos apgabalos, sasaistot to ar centrālās apstākļiem, kuriem fluīds ir pakļauts rotācijas dēļ, turklāt radītās spiedienu diferences starp siltākā un aukstākā fluīdu spiedienu diferencēm izraisa fluīda plūsmu no aukstākā uz zemākā spiediena apgabaliem, tiecoties uz spiedienu līdzsvarotību;

- kad minētā plūsma apstājas un fluīds dobumos praktiski ir miera stāvoklī, blīvējumi (41, 42) iekšējā cilindra (3) galos un daudzie ventīļi vai apvalkveida blīvējums (30) tiek atvērti, spiedienu diferencu dēļ izraisot šķidruma plūsmu iekšējā cilindrā (3) no siltākajiem apgabaliem uz aukstākajiem apgabaliem, turklāt fluīda



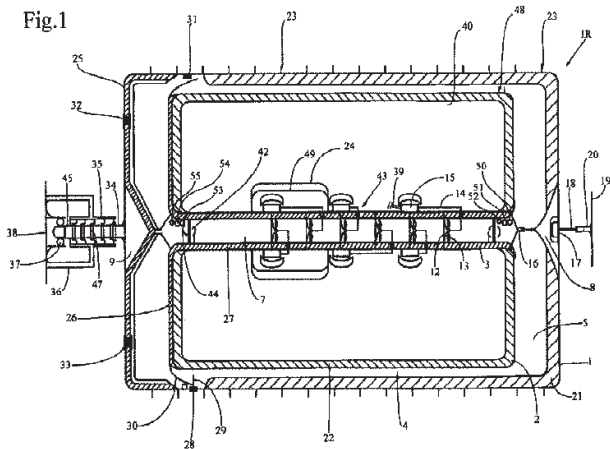
plūsma aktivē propellerus, kuru rotācijas enerģija tiek pārvērsta lietderīgā enerģijā un izraisa fluīda atdzesēšanu, kurš turpina plūst virzienā uz iekšējā rotora (IR) daļu, kas ir aprīkota ar izolējošo slāni un satur aukstāko šķidrumu;

- aukstākais fluīds pēc tam turpina plūst cauri daudzajiem ventīļiem vai apvalkveida blīvējumam (30) virzienā uz iekšējā rotora (IR) neizolētajiem apgabaliem, kuros tā temperatūra paaugstinās apkārtējās vides siltuma enerģijas dēļ.

6. Paņēmiens atbilstoši 5. pretenzijai, kas tiek īstenots 4. pretenzijai atbilstošā iekārtā, raksturīgs ar to, ka pēc tam, kad motors (17) ir aktivēts, griežot iekšējo rotoru (IR) ar vēlamo rotācijas leņķisko frekvenci ( $\omega$ ), kamēr tai pašā laikā ārējais apvalks (OS) papildus tiek turēts tajā pašā aukstajā vidē, līdz temperatūra rotācijas apstākļos ir stabilizējusies, ārējais apvalks (OS) tiek ievietots darba vidē ar diviem atšķirīgu temperatūru apgabaliem, ražojot lietderīgu enerģiju.

7. Paņēmiens atbilstoši 5. vai 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka minētais fluīds iekšējā rotora iekšējos apgabalos tiek novests līdz tādai temperatūrai, kurā šķidrums ir tuvu fāzes maiņai (kondensācijai), kad enerģija tiek izvadīta no iekārtas, tādējādi vājinot sakaršanas un atdzišanas negatīvos efektus, kas saistīti ar iekšējā rotora (IR) siltākajos un aukstākajos apgabalos (5, 6) notiekošo kompresiju un dekompresiju, tādā veidā uzlabojot iekārtas darbības parametrus.

8. Paņēmiens atbilstoši 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka monotipa fluīda vietā tiek lietots fluīdu maisījums, lai sasniegtu tādu fluīdu maisījuma temperatūru, kas ļauj vienam vai vairākiem fluīdiem pēc enerģijas izvadīšanas saglabāt gāzveida stāvokļa saglabāšanos iekšējā cilindri (3) apgabalā (7), kamēr vienam vai vairākiem citiem fluīdiem tiek ļauts kondensēties, tādējādi uzlabojot fluīdu maisījuma spējas izmantot fāzu maiņas latentās enerģijas absorbēšanas un atbrīvošanas spējas, lai papildus darbotos pret ar iekārtas siltākajos un aukstākajos apgabalos (5, 6) notiekošo kompresiju un dekompresiju saistītajiem sakaršanas/atdzišanas efektiem.



**(54) KASTE AR SALOKAMĀM SĀNU SIENĀM UN SLĒG-MEHĀNISMU AR PĀRSLODZES AIZSARDZĪBU BOX WITH FOLDABLE SIDE WALLS AND LOCKING MECHANISM WITH OVERLOAD PROTECTION**

(57) 1. Salokāma kaste (1), kas satur pamatni (2) un divas gareniskas ārsienas (6a, 6b) un divas sānu (4a, 4b) ārsienas, kuras pa pāriem ir pretējas viena otrai un ir salokāmas attiecībā pret pamatni (2), pie kam katra gareniskā ārsiena (6a, 6b) vismaz vienā sānu galā satur izvirdījumu (22), kas plešas uz augšu uzlocītu sānu ārsienu (4a, 4b) virzienā, pie tam izvirdījums ierobežo sānu ārsienu (4a, 4b) nolocīšanos uz āru,

raksturīga ar to, ka katra sānu ārsiena (4a, 4b) satur ar atspēri nospriegotu fiksējošo mehānismu, kurš ir izvietots sānu ārsienas (4a, 4b) ārpusē un kurš augšup salocītā stāvoklī satur slēdzošu elementu (100), kas ir pārvietojams vertikālā virzienā (8) attiecībā pret pamatnes (2) virsmu, kas var būt ieslēgta gareniskās ārsienas (6a, 6b) izvirdījumā (22), pie kam izvirdījums (22) un/ vai slēdzošais elements (100) satur kontaktvirsmas (110, 112), kas augšup salocītā stāvoklī attiecībā pret vertikālo virzienu (8) ir ieslēptas tādā veidā, ka fiksējošais mehānisms atveras, pārvarot atsperes izraisītā sprieguma pretdarbību, kad pārsniedz iepriekš noteikto spēku, kas vērsts uz iekšpusi un darbojas uz sānu ārsienu (4b).

2. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam pie garenisko ārsienu (6a, 6b) izvirdījuma (22) ir uzmontēts slēdzošais āķis (106), kas būtībā ir paralēli gareniskajām ārsienām (6a, 6b) un satur pirmo uz iekšpusi vērstu kontaktvirsmu (108) un otro uz ārpusi vērstu kontaktvirsmu (110).

3. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam slēdzošais elements (100) var būt ieslēgts slēdzošajā āķī (106), un slēdzošais elements (100) satur pirmo uz iekšpusi vērstu kontaktvirsmu (112) un otro uz ārpusi vērstu kontaktvirsmu (114).

4. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, pie kam vidējais slīpuma leņķis starp slēdzošā āķa (106) pirmo kontaktvirsmu (108) un vertikālo virzienu (8) ir lielāks par vidējo slīpuma leņķi starp slēdzošā āķa (106) otro kontaktvirsmu (110) un vertikālo virzienu (8).

5. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju, pie kam vidējais slīpuma leņķis starp slēdzošā elementa (100) pirmo kontaktvirsmu (112) un vertikālo virzienu (8) ir mazāks par vidējo slīpuma leņķi starp slēdzošā elementa (100) otro kontaktvirsmu (114) un vertikālo virzienu (8).

6. Salokāma kaste (1) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam slēdzošais elements (100) un fiksējošais mehānisms ir realizēts kā viens vesels un plešas visas sānu ārsienas (4b) platumā.

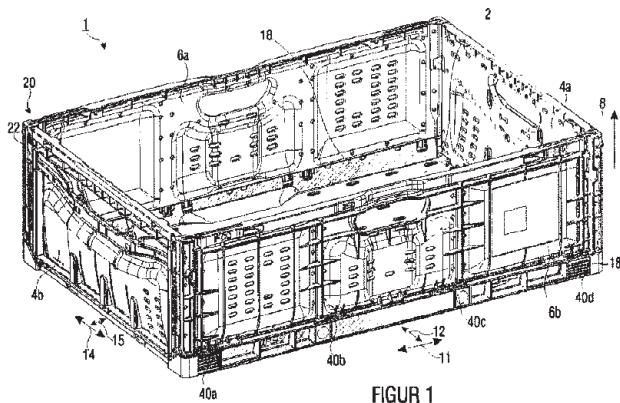
7. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam sānu ārsienas (4b) centrālajā daļā esošais slēdzošais elements (100) satur manuāli vadāmu satveršanas zonu (162) tādā veidā, ka, pārvietojot fiksējošo mehānismu (100) satveršanas zonā (162) vertikāli, slēdzošais elements (100) ir atbloķēts abās sānu ārsienas pusēs.

8. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam vidējais slīpuma leņķis starp slēdzošā āķa (106) otro kontaktvirsmu (110) un vertikālo virzienu (8) ir īstenots tādā veidā, ka, pārsniedzot iepriekš noteikto spēku, slēdzošais elements (100) pārvietojas, pārvarot atsperes izraisītā sprieguma pretdarbību ar spēka komponentu, kas darbojas uz augšu vertikālā virzienā (8), un ar spēka komponentu, kas darbojas perpendikulāri slēdzošā āķa (106) virzienam, neizraisot slēdzošā āķa (106) vai slēdzošā elementa (100) neelastīgas deformācijas.

9. Salokāma kaste (1) saskaņā ar 3. pretenziju, pie kam vidējais slīpuma leņķis starp slēdzošā elementa (100) pirmo kontaktvirsmu (112) un vertikālo virzienu (8) ir īstenots tādā veidā, ka, pārsniedzot iepriekš noteikto spēku, slēdzošais elements (100) pārvietojas, pārvarot atsperes izraisītā sprieguma pretdarbību ar spēka komponentu, kas darbojas uz augšu vertikālā virzienā (8), un ar spēka komponentu, kas darbojas perpendikulāri slēdzošā āķa (106) virzienam, neizraisot slēdzošā āķa (106) vai slēdzošā elementa (100) neelastīgas deformācijas.

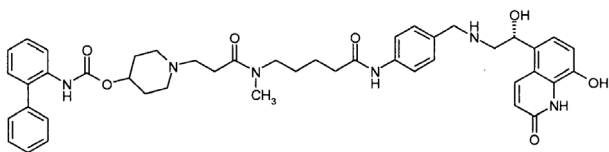
(51)	<b>B65D 6/16</b> <sup>(200601)</sup>	(11)	<b>2419344</b>
	<b>B65D 6/18</b> <sup>(200601)</sup>		
(21)	10721724.2	(22)	14.04.2010
(43)	22.02.2012		
(45)	05.06.2013		
(31)	PCT/EP2009/002760	(32)	15.04.2009
	102009034430		23.07.2009
	102009049184		13.10.2009
(86)	PCT/EP2010/054904		14.04.2010
(87)	WO2010/119073		21.10.2010
(73)	IFCO Systems GmbH, Zugspitzstrasse 7, 82049 Pullach, DE		
(72)	ORGELDINGER, Wolfgang, DE		
(74)	Zimmermann, Tankred Klaus, Patentanwälte Schoppe, Zimmermann, Stöckeler, Zinkler & Partner, Postfach 246, 82043 Pullach, DE		
	Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV		





FIGUR 1

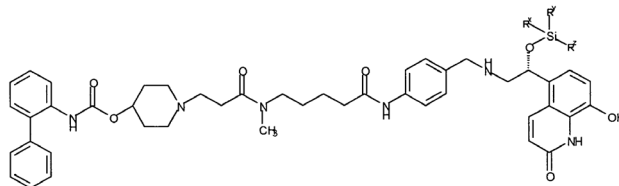
- (51) **C07D 401/12**<sup>(200601)</sup> (11) **2421849**  
**A61K 31/444**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 11/00**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 11/08**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10715058.3 (22) 16.04.2010  
(43) 29.02.2012  
(45) 03.04.2013  
(31) 172039 P (32) 23.04.2009 (33) US  
(86) PCT/US2010/031356 16.04.2010  
(87) WO2010/123766 28.10.2010  
(73) Theravance, Inc., 901 Gateway Boulevard, South San Francisco, CA 94080, US  
(72) HUGHES, Adam, US  
BYUN, Daniel, US  
CHEN, Yan, US  
FLEURY, Melissa, US  
JACOBSEN, John, R., US  
STANGELAND, Eric, L., US  
WILSON, Richard, D., US  
YEN, Rose, US  
(74) Scott, Susan Margaret, et al, Abel & Imray, 20 Red Lion Street, London WC1R 4PQ, GB  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
(54) **DIAMĪDU SAVIENOJUMI AR MUSKARĪNA RECEPTORU ANTAGONISTA UN BETA2 ADRENERĢISKO RECEPTORU AGONISTA AKTIVITĀTI**  
**DIAMIDE COMPOUNDS HAVING MUSCARINIC RECEPTOR ANTAGONIST AND BETA2 ADRENERGIC RECEPTOR AGONIST ACTIVITY**  
(57) 1. Savienojums ar formulu:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums, kā pieteikts 1. pretenzijā, kurš ir bifeni-2-ilkarbamīnskābes 1-(2-[[4-(4-[[*(R)*]-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrohinolin-5-il)etilamino]metil]-fenilkarbamoiil)-butil]metilkarbamoiil)etil)piperidin-4-il-esteris.
3. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu, kā pieteikts 1. vai 2. pretenzijā, un farmaceutiski pieņemamu nesēju.
4. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur kompozīcija satur papildu terapeitisku līdzekli.
5. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kur terapeitiskais līdzeklis ir steroīds pretiekaisuma līdzeklis vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts.
6. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur steroīdais pretiekaisuma līdzeklis ir kortikosteroīds vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts.
7. Savienojums, kā pieteikts 1. vai 2. pretenzijā, kuru izmanto terapijā.

8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, kuru izmanto plaušu traucējuma ārstēšanā.
9. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur plaušu traucējums ir hroniska obstruktīva plaušu slimība vai astma.
10. Starpprodukta savienojums savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kur starpprodukta savienojums atbilst formulai:



kur:

R<sup>x</sup> un R<sup>y</sup> ir neatkarīgi izvēlēta no C<sub>1-4</sub>alkilgrupas, fenilgrupas un -C<sub>1-4</sub>alkil-(fenil)grupas;  
R<sup>z</sup> ir izvēlēta no C<sub>1-4</sub>alkilgrupas, fenilgrupas, -C<sub>1-4</sub>alkil-(fenil)grupas un -O-(C<sub>1-4</sub>alkil)grupas;  
vai tā sāls.

11. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, kur R<sup>x</sup> un R<sup>y</sup> ir metilgrupa; un R<sup>z</sup> ir *tert*-butilgrupa.
12. Savienojuma, kā pieteikts 1. pretenzijā, iegūšanas paņēmiens, kurā ietilpst savienojuma, kā pieteikts 10. vai 11. pretenzijā, aizsarggrupas atšķelšana.

- (51) **C07K 16/28**<sup>(200601)</sup> (11) **2423229**  
**A61K 39/395**<sup>(200601)</sup>
- (21) 11167912.2 (22) 27.03.2007  
(43) 29.02.2012  
(45) 08.05.2013  
(31) 786569 P (32) 27.03.2006 (33) US  
(62) EP07712963.3 / EP1999152  
(73) Medimmune Limited, Milstein Building Granta Park, Cambridge, Cambridgeshire CB21 6GH, GB  
Zenyth Operations Pty. Ltd., 45 Poplar Road, Parkville VIC 3052, AU  
(72) COHEN, Emma, GB  
MINTER, Ralph, GB  
HARRISON, Paula, GB  
SLEEMAN, Matthew, GB  
NASH, Andrew, AU  
FABRI, Louis, AU  
(74) King, Hilary Mary, et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB  
Aleksandrs SMIRNOVS, patenti aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
(54) **SAISTOŠS ELEMENTS GM-CSF RECEPTORAM BINDING MEMBER FOR GM-CSF RECEPTOR**

- (57) 1. Izolēts saistošs elements cilvēka granulocītu/makrofāgu koloniju stimulējošā faktora receptora alfa ķēdei (GM-CSFR $\alpha$ ), kur saistošais elements:  
inhibē GM-CSF saistīšanu pie cilvēka GM-CSFR $\alpha$ ; un  
tam ir KD lielums, kas ir mazāks par 5 nM cilvēka GM-CSFR $\alpha$  saistīšanai, kā noteikts saskaņā ar virsmas plazmonu rezonansi; un kur saistošais elements satur:  
VH komplementaritāti noteicošo reģionu (CDRs) komplektu: VH CDR1, kas satur SEQ ID NO: 53, VH CDR2, kas satur SEQ ID NO: 54 un VH CDR3, kas satur SEQ ID NO: 55, neobligāti līdz 10 aminoskābju aizstāšanām minētajā VH CDRs komplektā, antielas VH domēna vai proteīnu karkasā, un neobligāti VL CDRs komplektu: VL CDR1, kas satur SEQ ID NO: 58, VL CDR2, kas satur SEQ ID NO: 59 un VL CDR3, kas satur SEQ ID NO: 60, neobligāti līdz 10 aminoskābju aizstāšanām minētajā VL CDRs komplektā, antielas VL domēna vai proteīnu karkasā.
2. Saistošs elements saskaņā ar 1. pretenziju, kur saistošais elements ir antielas molekula, kas satur antielas VH domēnu, kas satur VH CDR1, VH CDR2 un VH CDR3 un antielas VL domēnu, kas satur VL CDR1, VL CDR2 un VL CDR3.
3. Saistošs elements saskaņā ar 2. pretenziju, kur VH domēns satur:

S	VH karkasa pie Kabat-atlikuma H17;
I	VH CDR1 pie Kabat-atlikuma H34;
E	VH CDR2 pie Kabat-atlikuma H54;
I	VH CDR2 pie Kabat-atlikuma H57;
I, L, V, A vai M	VH karkasa pie Kabat-atlikuma H94;
V, N, A vai L	VH CDR3 pie Kabat-atlikuma H95;
S	VH CDR3 pie Kabat-atlikuma H97;
S, F, H, P, T vai W	VH CDR3 pie Kabat-atlikuma H99;
A, T, P, S, V vai H	VH CDR3 pie Kabat-atlikuma H100B.

4. Saistošs elements saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur VH domēns satur:

S	VL CDR1 pie Kabat-atlikuma 27A;
N	VL CDR1 pie Kabat-atlikuma 27B;
I	VL CDR1 pie Kabat-atlikuma 27C;
D	VL CDR1 pie Kabat-atlikuma 32;
N	VL CDR2 pie Kabat-atlikuma 51;
N	VL CDR2 pie Kabat-atlikuma 52;
K	VL CDR2 pie Kabat-atlikuma 53;
S, T vai M	VL CDR3 pie Kabat-atlikuma L90;
D, E, Q, S, M vai T	VL CDR3 pie Kabat-atlikuma L92; un/vai
S, P, I vai V	VL CDR3 pie Kabat-atlikuma L96.

5. Saistošs elements saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 4. pretenzijai, kur VH CDRs komplekts satur VH CDR1 ar aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 3 vai SEQ ID NO: 173, VH CDR2 ar aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 4 un VH CDR3 ar aminoskābju sekvenci, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no: SEQ ID NO: 5; SEQ ID NO: 15; SEQ ID NO: 35; SEQ ID NO: 45; SEQ ID NO: 55; SEQ ID NO: 65; SEQ ID NO: 75; SEQ ID NO: 85; SEQ ID NO: 95; SEQ ID NO: 105; SEQ ID NO: 115; SEQ ID NO: 125; SEQ ID NO: 135; SEQ ID NO: 145; SEQ ID NO: 155; SEQ ID NO: 165; SEQ ID NO: 175; SEQ ID NO: 185 un SEQ ID NO: 195, un kur

VL CDRs komplekts satur VL CDR1 ar SEQ ID NO: 8; VL CDR2 ar SEQ ID NO: 9 un VL CDR3 ar aminoskābju sekvenci, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no: SEQ ID NO: 10; SEQ ID NO: 20; SEQ ID NO: 40; SEQ ID NO: 50; SEQ ID NO: 60; SEQ ID NO: 70; SEQ ID NO: 80; SEQ ID NO: 90; SEQ ID NO: 100; SEQ ID NO: 110; SEQ ID NO: 120; SEQ ID NO: 130; SEQ ID NO: 140; SEQ ID NO: 150; SEQ ID NO: 160; SEQ ID NO: 170; SEQ ID NO: 180; SEQ ID NO: 190 un SEQ ID NO: 200.

6. Saistošs elements saskaņā ar 5. pretenziju, kas satur VH domēnu un VL domēnu, kas izvēlēti no šādas rindas:

VH domēns SEQ ID NO: 2 un VL domēns SEQ ID NO: 208;  
 VH domēns SEQ ID NO: 12 un VL domēns SEQ ID NO: 210;  
 VH domēns SEQ ID NO: 32 un VL domēns SEQ ID NO: 214;  
 VH domēns SEQ ID NO: 42 un VL domēns SEQ ID NO: 216;  
 VH domēns SEQ ID NO: 52 un VL domēns SEQ ID NO: 218;  
 VH domēns SEQ ID NO: 62 un VL domēns SEQ ID NO: 220;  
 VH domēns SEQ ID NO: 72 un VL domēns SEQ ID NO: 222;  
 VH domēns SEQ ID NO: 82 un VL domēns SEQ ID NO: 224;  
 VH domēns SEQ ID NO: 92 un VL domēns SEQ ID NO: 226;  
 VH domēns SEQ ID NO: 102 un VL domēns SEQ ID NO: 228;  
 VH domēns SEQ ID NO: 112 un VL domēns SEQ ID NO: 230;  
 VH domēns SEQ ID NO: 122 un VL domēns SEQ ID NO: 232;  
 VH domēns SEQ ID NO: 132 un VL domēns SEQ ID NO: 234;  
 VH domēns SEQ ID NO: 142 un VL domēns SEQ ID NO: 236;  
 VH domēns SEQ ID NO: 152 un VL domēns SEQ ID NO: 238;  
 VH domēns SEQ ID NO: 162 un VL domēns SEQ ID NO: 240;  
 VH domēns SEQ ID NO: 172 un VL domēns SEQ ID NO: 242;  
 VH domēns SEQ ID NO: 182 un VL domēns SEQ ID NO: 244; un  
 VH domēns SEQ ID NO: 192 un VL domēns SEQ ID NO: 246.

7. Paņēmiens saistošā elementa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām iegūšanai, kas ietver saimniekšūnas kultivēšanu, kas satur nukleīnskābes molekulu, kas satur saistošu elementu kodējošu nukleīnskābju sekvenci, kam seko saistošā elementa attīrīšana.

- (51) **C07K 16/28<sup>(200601)</sup>** (11) **2423230**  
**A61K 39/395<sup>(200601)</sup>**  
 (21) 11167923.9 (22) 27.03.2007  
 (43) 29.02.2012  
 (45) 08.05.2013  
 (31) 786569 P (32) 27.03.2006 (33) US  
 (73) Medimmune Limited, Milstein Building Granta Park, Cambridge, Cambridgeshire CB21 6GH, GB  
 Zenyth Operations Pty. Ltd., 45 Poplar Road, Parkville VIC 3052, AU  
 (72) COHEN, Emma, GB  
 MINTER, Ralph, GB  
 HARRISON, Paula, GB  
 SLEEMAN, Matthew, GB  
 NASH, Andrew, AU  
 FABRI, Louis, AU  
 (74) King, Hilary Mary, et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB  
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
 (54) **SAISTOŠS ELEMENTS GM-CSF RECEPTORAM BINDING MEMBER FOR GM-CSF RECEPTOR**

(57) 1. Kompozīcija, kas satur izolētu antivielas molekulu un farmaceitiski pieņemamu palīgvielu, kur antivielas molekula satur antivielas VH domēnu un antivielas VL domēnu, antivielas VH domēns satur smagās ķēdes komplementaritāti noteicošos reģionus (CDRs) HCDR1, HCDR2 un HCDR3, un VL domēns satur vieglās ķēdes CDRs LCDR1, LCDR2 un LCDR3, kur CDRs aminoskābju sekvences ir:

HCDR1 SEQ ID NO: 53;  
 HCDR2 SEQ ID NO: 54;  
 HCDR3 SEQ ID NO: 55;  
 LCDR1 SEQ ID NO: 58;  
 LCDR2 SEQ ID NO: 59; un  
 LCDR3 SEQ ID NO: 60.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur antivielas molekula ir cilvēka vai humanizēta antivielas molekula.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur antivielas molekula satur antivielas VH domēna aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 52.

4. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur antivielas molekula satur antivielas VL domēna aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 218.

5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 4. pretenzijai, kur antivielas molekula ir IgG4.

6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur antivielas molekula ir cilvēka IgG4 antivielas molekula, kas satur VH domēna aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 52 un VL domēna aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 218.

7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām izmantošanai paņēmiēnā reimatoīdā artrīta, astmas, alerģiskas reakcijas, multiplās sklerozes, mieloīdas leukēmijas, aterosklerozes, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības vai smēķēšanas izraisīta elpošanas ceļu iekaisuma ārstēšanai.

8. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 7. pretenziju, kur ārstēšanā ietilpst kompozīcijas ievadīšana kombinācijā vai papildus vienai vai vairākām šādām vielām:

NSAIDs (nesteroīdie pretiekaisuma līdzekļi), kortikosteroīdi un slimību modificējošie antireimatisksie medikamenti (DMARDs).

9. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kur ārstēšanā ietilpst kompozīcijas ievadīšana kombinācijā ar vienu vai vairākām šādām vielām: Cox-inhibitori, prednizons, Humira (adalimumabs), metotreksāts, Arava, Enbrel (etanercepts), Remicade (infliksimabs), Kineret (anakinra), Rituxan (rituksimabs), Orenzia (abatacepts), zelta sāļi, pretmalārijas zāles, sulfasalazīns, d-penicilamīns, ciklosporīns A, diklofenaks, ciklofosfamīds un azatioprīns.

10. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, kur ārstēšanā ietilpst kompozīcijas ievadīšana kombinācijā ar metotreksātu.

11. Paņēmiens antivielas molekulas producēšanai, kas ietver saimniekšūnas, kas satur antivielas molekulu kodējošu nukleīnskābi, kultivēšanu, kam seko antivielas molekulas attīrīšana, kur antivielas molekula konkurē ar antivielas molekulu, kas satur VH domēna

SEQ ID NO: 52 un VL domēna SEQ ID NO: 218, par GM-CSFRα ekstracelulārā domēna saistīšanu.

12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, kur virsmas plazmonu rezonanses analizē antivielas molekula saista cilvēka GM-CSFRα ekstracelulāro domēnu ar afinitāti ( $K_D$ ) mazāku par 5 nM.

13. Paņēmiens antivielas molekulas producēšanai cilvēka GM-CSFRα receptoram, minētais paņēmiens ietver, veicot vienas vai vairāku aminoskābju inserciju, delēciju vai nomainīgu HCDR1, HCDR2 un HCDR3 saturošā VH vecākdomēna aminoskābju sekvencē, VH domēna iegūšanu, kas ir VH vecākdomēna aminoskābju sekvences variants; kur:

VH vecākdomēna CDR1 satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 53; VH vecākdomēna CDR2 satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 54; un

VH vecākdomēna CDR3 satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 55; un

tādā veidā iegūtā VH domēna kombinēšanu ar vienu vai vairākiem VL domēniem, iegūstot vienu vai vairākas VH/VL kombinācijas; kur minētais viens vai minētie vairāki VL domēni tiek iegūti, veicot vienas vai vairāku aminoskābju inserciju, delēciju vai nomainīgu LCDR1, LCDR2 un LCDR3 saturošā VL vecākdomēna aminoskābju sekvencē; kur:

VL vecākdomēna CDR1 satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 58; VL vecākdomēna CDR2 satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 59; un

VL vecākdomēna CDR3 satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 60; un

VH/VL kombinācijas vai kombināciju analizēšanu, lai identificētu antivielas molekulu cilvēka GM-CSFRα receptoram.

- (51) **C12G 3/02**<sup>(200601)</sup> (11) **2427064**  
**A23L 1/185**<sup>(200601)</sup>  
**A23L 2/40**<sup>(200601)</sup>  
**C12C 7/04**<sup>(200601)</sup>  
**C12C 7/047**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10718080.4 (22) 28.04.2010  
(43) 14.03.2012  
(45) 29.05.2013  
(31) 102009020386 (32) 08.05.2009 (33) DE  
(86) PCT/EP2010/002610 28.04.2010  
(87) WO2010/127798 11.11.2010  
(73) KRONES Aktiengesellschaft, Böhmerwaldstrasse 5, 93073 Neutraubling, DE  
(72) MÜLLER-AUFFERMANN, Konrad, DE  
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Anwaltssozietāt, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **MISAS SAGATAVOŠANAS PAŅĒMIENS KVASA MISAS RAŽOŠANAI MASHING METHOD FOR THE PRODUCTION OF KVASS WORT**

(57) 1. Misas sagatavošanas paņēmiens kvasa misas ražošanai, kas satur tādus soļus kā:

a) pirmās daļējās misas, it īpaši daļējās rudzu misas, sagatavošana un pirmās daļējās misas sakarsēšana līdz temperatūrai, kas zemāka par vārīšanās temperatūru, diapazonā no 75°C līdz 90°C,

b) otrās daļējās misas sagatavošana un

c) samaisītās pirmās un otrās daļējās misas pakāpeniska sakarsēšana.

2. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka daļējās misas sildīšana solī a) notiek pirmajā misas sagatavošanas ierīcē (8a) un otrās daļējās misas sagatavošana solī b) notiek otrajā misas sagatavošanas ierīcē (8b), un daļējās misas tiek samaisītas kopā vai nu pirmajā, vai otrajā misas sagatavošanas ierīcē, vai solī a) pirmā daļējā mīsa tiek sildīta pirmajā misas sagatavošanas ierīcē (8a) un otrā daļējā mīsa tiek iemaisīta pirmajā misas sagatavošanas ierīcē (8a).

3. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši 1. vai 2. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka temperatūra solī a) ir no 80°C līdz 85°C.

4. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pirmās daļējās misas sildīšanas laikā tiek taisīts viens pārtraukums vai vairāki pārtraukumi temperatūru diapazonā no 56°C līdz 70°C.

5. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka otrās daļējās misas sagatavošanas temperatūra ir no 5°C līdz 25°C un/vai pirmās daļējās misas sagatavošanas temperatūra ir no 30°C līdz 65°C, vēlams, no 35°C līdz 55°C.

6. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pirmā daļējā mīsa ir daļēja rudzu mīsa, kas satur ūdeni un kā izejvielu rudzus, it īpaši rudzu miltus un fermentētu kvasa rudzu iesalu.

7. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka otrā daļējā mīsa satur ūdeni un vismaz vienu no sekojošām izejvielām vai izejvielu produktiem: miežus, kviešus, kukurūzu, griķus, rīsus, kā arī kartupeļus.

8. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pirmā daļējā mīsa ir bieza mīsa, kurā misā iejaukto izejvielu daudzuma (kg) un ūdens daudzuma (l) attiecība ir diapazonā no 1 : 2 līdz 1 : 3,4, it īpaši no 1 : 2,5 līdz 1 : 3.

9. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dominējošā misas koncentrācija ir diapazonā no 18 līdz 28 Plato grādiem, it īpaši līdz vairāk nekā 28 Plato grādiem.

10. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pirmā daļējā mīsa veido 40 līdz 80 % no kopējās misas.

11. Misas sagatavošanas paņēmiens atbilstoši jebkurai no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka vismaz misas sagatavošanas procesa solī c) misā tiek radītas svārstības ar vibratora sistēmas palīdzību.

12. Kvasa ražošanas paņēmiens ar vismaz vienai no 1. līdz 11. pretenzijai atbilstošu misas sagatavošanas paņēmienu, kurš satur tādus soļus kā:

- izejvielu, it īpaši skrotēta iesala un sasmalcinātu izejvielu, sagatavošana,
- ar ūdeni samaisīto izejvielu iejaukšana,
- kvasa misas attīrīšana/filtrēšana no maisījuma,
- kvasa misas sildīšana.

13. Paņēmiens atbilstoši 12. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pēc kvasa misas raudzēšanas pēc izvēles seko šādi soļi: kvasa misas filtrēšana un/vai cukura, un/vai aromātisku vielu pievienošana.

14. Paņēmiens atbilstoši 12. vai 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka sildīšanas laikā mīsa tiek uzvārīta un karstās duļķes atdalītas.

15. Paņēmiens atbilstoši jebkurai no 12. līdz 14. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pirms raudzēšanas mīsa tiek iztvaicēta un koncentrēta.

16. Paņēmiens atbilstoši 15. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka koncentrāts tiek vārīts, turklāt vārīšanas process notiek pie palielināta spiediena un tajā notiek maisīšana.

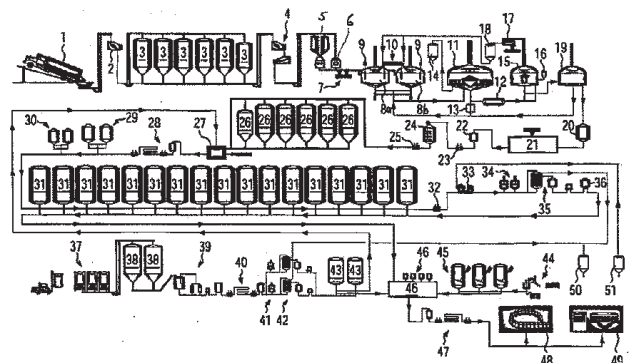
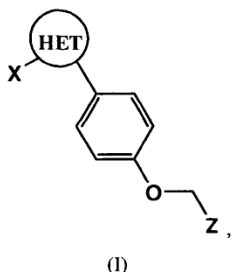


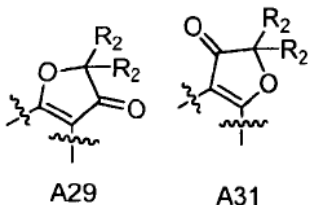
FIG. 1



- (51) **C07D 405/12**<sup>(200601)</sup> (11) **2427454**  
**C07D 471/04**<sup>(200601)</sup>  
**C07D 487/04**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/437**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/443**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/5025**<sup>(200601)</sup>  
**A61P 25/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 09796217.9 (22) 18.12.2009  
(43) 14.03.2012  
(45) 20.03.2013  
(31) 176413 P (32) 07.05.2009 (33) US  
(86) PCT/US2009/068644 18.12.2009  
(87) WO2010/128995 11.11.2010  
(73) Envivo Pharmaceuticals, Inc., 480 Arsenal Street Bldg. 1, Watertown, MA 02472, US  
(72) SHAPIRO, Gideon, US  
RIPKA, Amy, US  
CHESWORTH, Richard, US  
(74) Harrison Goddard Foote, 4th Floor, Merchant Exchange, 17-19 Whitworth Street West, Manchester M1 5WG, GB  
Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV  
(54) **HETEROCIKLISKI FENOKSIMETILSAVIEŅOJUMI  
PHENOXYMETHYL HETEROCYCLIC COMPOUNDS**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (I)



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls,  
kur:  
HET ir heterociklisks gredzens ar formulu A29 vai A31



kur vistālāk kreisajā pusē esošais radikālis ir savienots ar X grupu formulā (I);  
X ir pēc izvēles aizvietota arilgrupa vai pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa, kur aizvietotāji ir atlasīti no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas;  
Z ir imidazo[1,2-a]piridin-2-ilgrupa, imidazo[1,2-b]piridazin-2-ilgrupa vai imidazo[1,2-b]piridazin-6-ilgrupa, katra no tām var būt pēc izvēles aizvietota, kur aizvietotāji ir atlasīti no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas; un katrs R<sub>2</sub> ir neatkarīgi pēc izvēles fluora aizvietota (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupa, vai divas R<sub>2</sub> grupas kopā ar oglekļa atomu, kam tās ir pievienotas, veido 3 locekļu cikloalkilgredzenu;  
un kur:  
- alkilgrupa apzīmē lineāru vai sazartu piesātinātu vai nepiesātinātu alifātisko (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)ogļūdeņradi, kas var būt pēc izvēles

aizvietots ar fluora atomiem (līdz 3) un, ja norādīts specifikācijā, aizvietots ar citām grupām;  
- arilgrupa ir fenilgrupa vai naftilgrupa;  
- heteroarilgrupa ir tetrazols, 1,2,3,4-oksatriazols, 1,2,3,5-oksatriazols, mono- vai bicikliska aromātiska gredzena sistēma vai heterobicikliska gredzena sistēma ar vienu aromātisko gredzenu ar 5 līdz 10 gredzena atomiem, neatkarīgi atlasīti no C, N, O un S, nodrošinot, lai ne vairāk kā 3 gredzena atomi vienā gredzenā būtu citi nekā C atomi; un  
- cikloalkilgrupa ir (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)ciklisks nearomātisks ogļūdeņradis, kas var saturēt vienu dubultsaiti un pēc izvēles un neatkarīgi ir aizvietots ar grupām (līdz 3), atlasītām no alkilgrupas, alkoksigrupas, hidroksilgrupas un oksogrupas.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur HET ir A29.
3. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 2. pretenzijai, kur X ir pēc izvēles aizvietota heteroarilgrupa.
4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur X ir:
  - (a) pēc izvēles aizvietots monociklisks heteroarila gredzens ar pieciem gredzena atomiem, atlasītiem no C, O, S un N, nodrošinot, lai gredzena heteroatomu kopskaits būtu mazāks vai vienāds ar 4 un ne vairāk par vienu no gredzena heteroatomiem būtu skābeklis vai sērs, kur aizvietotāji tiek atlasīti no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas; vai
  - (b) monociklisks heteroarila gredzens ar sešiem gredzena atomiem, atlasītiem no C un N, nodrošinot, lai ne vairāk kā trīs gredzena atomi būtu N, kur aromātiskais gredzens ir pēc izvēles un neatkarīgi aizvietots ar aizvietotājiem (līdz diviem), atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas.
5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kur X ir pēc izvēles aizvietots monociklisks heteroarila gredzens ar pieciem gredzena atomiem, atlasītiem no C, O, S un N, nodrošinot, lai gredzena heteroatomu kopskaits būtu mazāks vai vienāds ar 4 un ne vairāk par vienu gredzena heteroatomu būtu skābeklis vai sērs, kur heteroarila gredzens ir pēc izvēles un neatkarīgi aizvietots ar aizvietotājiem (līdz diviem), atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas.
6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kur X ir atlasīts no grupas, kas sastāv no pēc izvēles aizvietotas 1,2,3-triazinilgrupas, 1,2,4-triazinilgrupas, 1,3,5-triazinilgrupas, piridinilgrupas, pirazinilgrupas, piridazinilgrupas, pirimidinilgrupas, 1H-pirrolilgrupas, furanilgrupas, tiofenilgrupas, imidazolilgrupas, pirazolilgrupas, izotiazolilgrupas, izoksazolilgrupas, oksazolilgrupas, tiazolilgrupas, 1,2,3-triazolilgrupas, 1,2,4-triazolilgrupas, 1,2,3-oksadiazolilgrupas, 1,2,4-oksadiazolilgrupas, 1,2,5-oksadiazolilgrupas, 1,3,4-oksadiazolilgrupas, 1,2,3-tiadiazolilgrupas, 1,2,4-tiadiazolilgrupas, 1,2,5-tiadiazolilgrupas, 1,3,4-tiadiazolilgrupas, tetrazolilgrupas, 1,2,3,4-oksatriazolilgrupas, 1,2,3,5-oksatriazolilgrupas, 1,2,3,4-tiatriazolilgrupas un 1,2,3,5-tiatriazolilgrupas.
7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur X ir monociklisks heteroarila gredzens ar sešiem atomiem, atlasītiem no C un N, nodrošinot, lai ne vairāk kā trīs gredzena atomi būtu N, kur heteroarila gredzens ir pēc izvēles un neatkarīgi aizvietots ar aizvietotājiem (līdz diviem), atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas.



8. Savienojums saskaņā ar 7. pretenziju, kur X ir pēc izvēles aizvietota 1,2,3-triazinilgrupa, 1,2,4-triazinilgrupa, 1,3,5-triazinilgrupa, piridinilgrupa, pirazinilgrupa, piridazinilgrupa vai pirimidinilgrupa.

9. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur X ir 4-piridinilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu aizvietotāju, atlasītu no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, ciklopropilgrupas, ciklopropilmetilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, alkilsulfonilgrupas un ciāngrupas.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 2. pretenzijai, kur X ir pēc izvēles aizvietota fenilgrupa, kur aizvietotāji tiek atlasīti no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, alkoksialkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)cikloalkilalkoksigrupas, aminogrupas, alkilaminogrupas, dialkilaminogrupas, amīdgrupas, alkilamīdgrupas, dialkilamīdgrupas, tioalkilgrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, alkilsulfonilgrupas un nitrogrupas.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur Z ir aizvietots ar aizvietotājiem (līdz 3), neatkarīgi atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, halogēna, alkilsulfonilgrupas un ciāngrupas.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur Z ir imidazo[1,2-a]piridin-2-ilgrupa, aizvietota ar aizvietotājiem (līdz 2), neatkarīgi atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, halogēna atoma, alkilsulfonilgrupas un ciāngrupas.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur Z ir imidazo[1,2-b]piridazin-2-ilgrupa, aizvietota ar aizvietotājiem (līdz 2), neatkarīgi atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, halogēna atoma, alkilsulfonilgrupas un ciāngrupas.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur Z ir imidazo[1,2-b]piridazin-6-ilgrupa, aizvietota ar aizvietotājiem (līdz 2), neatkarīgi atlasītiem no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkilgrupas, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cikloalkiloksigrupas, halogēna atoma, alkilsulfonilgrupas un ciāngrupas.

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai, kur Z nav aizvietots.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, kur R<sub>2</sub> ir (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupa.

17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur aizvietotāji tiek neatkarīgi atlasīti no grupas, kas sastāv no (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkilgrupas, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoksigrupas, CF<sub>3</sub>, karboksilgrupas, ciāngrupas, aminogrupas un halogēna atoma.

18. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, atlasīts no jebkura no savienojumiem, definēta piemēros 1-185 un 187-732 zemāk esošajā tabulā, vai tā farmaceitiski pieņemams sāls:

Piemērs	#	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
1	A29				Me, Me
2	A29				Me, Me
3	A29				Me, Me
4	A29				Me, Me
5	A29				Me, Me
6	A29				Me, Me
7	A29				Me, Me

(turpinājums)

Piemērs	#	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
8	A29				Me, Me
9	A29				Me, Me
10	A29				Me, Me
11	A29				Me, Me
12	A29				Me, Me
13	A29				Me, Me
14	A29				Me, Me
15	A29				Me, Me
16	A29				Me, Me
17	A29				Me, Me
18	A29				Me, Me
19	A29				Me, Me
20	A29				Me, Me
21	A29				Me, Me
22	A29				Me, Me
23	A29				Me, Me
24	A29				Me, Me
25	A29				Me, Me
26	A29				Me, Me
27	A29				Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
28	A29			Me, Me
29	A29			Me, Me
30	A29			Me, Me
31	A29			Me, Me
32	A29			Me, Me
33	A29			Me, Me
34	A29			Me, Me
35	A29			Me, Me
36	A29			Me, Me
37	A29			Me, Me
38	A29			Me, Me
39	A29			Me, Me
40	A29			Me, Me
41	A29			Me, Me
42	A29			Me, Me
43	A29			Me, Me
44	A29			Me, Me
45	A29			Me, Me
46	A29			Me, Me
47	A29			Me, Me
48	A29			Me, Me
49	A29			Me, Me
50	A29			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
51	A29			Me, Me
52	A29			Me, Me
53	A29			Me, Me
54	A29			Me, Me
55	A29			Me, Me
56	A29			Me, Me
57	A29			Me, Me
58	A29			Me, Me
59	A29			Me, Me
60	A29			Me, Me
61	A29			Me, Me
62	A29			Me, Me
63	A29			Me, Me
64	A29			Me, Me
65	A29			Me, Me
66	A29			Me, Me
67	A29			Me, Me
68	A29			Me, Me
69	A29			Me, Me
70	A29			Me, Me
71	A29			Me, Me
72	A29			Me, Me
73	A29			Me, Me
74	A29			Me, Me
75	A29			Me, Me
76	A29			Me, Me
77	A29			Me, Me
78	A29			Me, Me
79	A29			Me, Me
80	A29			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
81	A29			Me, Me
82	A29			Me, Me
83	A29			Me, Me
84	A29			Me, Me
85	A29			Me, Me
86	A29			Me, Me
87	A29			Me, Me
88	A29			Me, Me
89	A29			Me, Me
90	A29			Me, Me
91	A29			Me, Me
92	A29			Me, Me
93	A29			Me, Me
94	A29			Me, Me
95	A29			Me, Me
96	A29			Me, Me
97	A29			Me, Me
98	A29			Me, Me
99	A29			Me, Me
100	A29			Me, Me
101	A29			Me, Me
102	A29			Me, Me
103	A29			Me, Me
104	A29			Me, Me
105	A29			Me, Me
106	A29			Me, Me
107	A29			Me, Me
108	A29			Me, Me
109	A29			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
110	A29			Me, Me
111	A29			Me, Me
121	A29			Me, Me
122	A29			Me, Me
123	A29			Me, Me
124	A29			Me, Me
125	A29			Me, Me
126	A29			Me, Me
127	A29			Me, Me
128	A29			Me, Me
129	A29			Me, Me
130	A29			Me, Me
131	A29			Me, Me
132	A29			Me, Me
133	A29			Me, Me
134	A29			Me, Me
135	A29			Me, Me
136	A29			Me, Me
137	A29			Me, Me
138	A29			Me, Me
139	A29			Me, Me



(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
140	A29			Me, Me
141	A29			Me, Me
142	A29			Me, Me
143	A29			Me, Me
144	A29			Me, Me
145	A29			Me, Me
146	A29			Me, Me
147	A29			Me, Me
148	A29			Me, Me
149	A29			Me, Me
150	A29			Me, Me
151	A29			Me, Me
152	A29			Me, Me
153	A29			Me, Me
154	A29			Me, Me
155	A29			Me, Me
156	A29			Me, Me
157	A29			Me, Me
158	A29			Me, Me
159	A29			Me, Me
160	A29			Me, Me
161	A29			Me, Me
162	A29			Me, Me
163	A29			Me, Me
164	A29			Me, Me
165	A29			Me, Me
166	A29			Me, Me
167	A29			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
168	A29			Me, Me
169	A29			Me, Me
170	A29			Me, Me
171	A29			Me, Me
172	A29			Me, Me
173	A29			Me, Me
174	A29			Me, Me
175	A29			Me, Me
176	A29			Me, Me
177	A29			Me, Me
178	A29			Me, Me
179	A29			Me, Me
180	A29			Me, Me
181	A29			Me, Me
182	A29			Me, Me
183	A29			Me, Me
184	A29			Me, Me
185	A29			Me, Me
187	A29			Me, Me
188	A29			Me, Me
189	A29			Me, Me
190	A29			Me, Me
191	A29			Me, Me
192	A29			Me, Me



(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
193	A29			Me, Me
194	A29			Me, Me
195	A29			Me, Me
196	A29			Me, Me
197	A29			Me, Me
198	A29			Me, Me
199	A29			Me, Me
200	A29			Me, Me
201	A29			Me, Me
202	A29			Me, Me
203	A29			Me, Me
204	A29			Me, Me
205	A29			Me, Me
206	A29			Me, Me
207	A29			Me, Me
211	A29			Me, Me
212	A29			Me, Me
213	A29			Me, Me
214	A29			Me, Me
215	A29			Me, Me
216	A29			Me, Me
217	A29			Me, Me
218	A29			Me, Me
219	A29			Me, Me
220	A29			Me, Me
221	A29			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
222	A29			Me, Me
223	A29			Me, Me
224	A29			Me, Me
225	A29			Me, Me
226	A29			Me, Me
227	A29			Me, Me
228	A29			Me, Me
229	A29			Me, Me
230	A29			Me, Me
231	A29			Me, Me
232	A29			Me, Me
233	A29			Me, Me
234	A29			Me, Me
235	A29			Me, Me
236	A29			Me, Me
237	A29			Me, Me
238	A29			Me, Me
239	A29			Me, Me
240	A29			Me, Me
241	A29			Me, Me
242	A29			Me, Me
243	A29			Me, Me
244	A29			Me, Me
245	A29			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
246	A29			Me, Me
247	A29			Me, Me
248	A29			Me, Me
249	A29			Me, Me
250	A29			Me, Me
251	A29			Me, Me
252	A29			Me, Me
253	A31			Me, Me
254	A31			Me, Me
255	A31			Me, Me
256	A31			Me, Me
257	A31			Me, Me
258	A31			Me, Me
259	A31			Me, Me
260	A31			Me, Me
261	A31			Me, Me
262	A31			Me, Me
263	A31			Me, Me
264	A31			Me, Me
265	A31			Me, Me
266	A31			Me, Me
267	A31			Me, Me
268	A31			Me, Me
269	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
270	A31			Me, Me
271	A31			Me, Me
272	A31			Me, Me
273	A31			Me, Me
274	A31			Me, Me
275	A31			Me, Me
276	A31			Me, Me
277	A31			Me, Me
278	A31			Me, Me
279	A31			Me, Me
280	A31			Me, Me
281	A31			Me, Me
282	A31			Me, Me
283	A31			Me, Me
284	A31			Me, Me
285	A31			Me, Me
286	A31			Me, Me
287	A31			Me, Me
288	A31			Me, Me
289	A31			Me, Me
290	A31			Me, Me
291	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
292	A31			Me, Me
293	A31			Me, Me
294	A31			Me, Me
295	A31			Me, Me
296	A31			Me, Me
297	A31			Me, Me
298	A31			Me, Me
299	A31			Me, Me
300	A31			Me, Me
301	A31			Me, Me
302	A31			Me, Me
303	A31			Me, Me
304	A31			Me, Me
305	A31			Me, Me
306	A31			Me, Me
307	A31			Me, Me
308	A31			Me, Me
309	A31			Me, Me
310	A31			Me, Me
311	A31			Me, Me
312	A31			Me, Me
313	A31			Me, Me
314	A31			Me, Me
315	A31			Me, Me
316	A31			Me, Me
317	A31			Me, Me
318	A31			Me, Me
319	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
320	A31			Me, Me
321	A31			Me, Me
322	A31			Me, Me
323	A31			Me, Me
324	A31			Me, Me
325	A31			Me, Me
326	A31			Me, Me
327	A31			Me, Me
328	A31			Me, Me
329	A31			Me, Me
330	A31			Me, Me
331	A31			Me, Me
332	A31			Me, Me
333	A31			Me, Me
334	A31			Me, Me
335	A31			Me, Me
336	A31			Me, Me
337	A31			Me, Me
338	A31			Me, Me
339	A31			Me, Me
340	A31			Me, Me
341	A31			Me, Me
342	A31			Me, Me
343	A31			Me, Me
344	A31			Me, Me
345	A31			Me, Me
346	A31			Me, Me
347	A31			Me, Me
348	A31			Me, Me
349	A31			Me, Me



(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
350	A31			Me, Me
351	A31			Me, Me
352	A31			Me, Me
353	A31			Me, Me
354	A31			Me, Me
355	A31			Me, Me
356	A31			Me, Me
357	A31			Me, Me
358	A31			Me, Me
359	A31			Me, Me
360	A31			Me, Me
361	A31			Me, Me
362	A31			Me, Me
363	A31			Me, Me
364	A31			Me, Me
365	A31			Me, Me
366	A31			Me, Me
367	A31			Me, Me
368	A31			Me, Me
369	A31			Me, Me
370	A31			Me, Me
371	A31			Me, Me
372	A31			Me, Me
373	A31			Me, Me
374	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
375	A31			Me, Me
376	A31			Me, Me
377	A31			Me, Me
378	A31			Me, Me
379	A31			Me, Me
380	A31			Me, Me
381	A31			Me, Me
382	A31			Me, Me
383	A31			Me, Me
384	A31			Me, Me
385	A31			Me, Me
386	A31			Me, Me
387	A31			Me, Me
388	A31			Me, Me
389	A31			Me, Me
390	A31			Me, Me
391	A31			Me, Me
392	A31			Me, Me
393	A31			Me, Me
394	A31			Me, Me
395	A31			Me, Me
396	A31			Me, Me
397	A31			Me, Me
398	A31			Me, Me
399	A31			Me, Me
400	A31			Me, Me



(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
401	A31			Me, Me
402	A31			Me, Me
403	A31			Me, Me
404	A31			Me, Me
405	A31			Me, Me
406	A31			Me, Me
407	A31			Me, Me
408	A31			Me, Me
409	A31			Me, Me
410	A31			Me, Me
411	A31			Me, Me
412	A31			Me, Me
413	A31			Me, Me
414	A31			Me, Me
415	A31			Me, Me
416	A31			Me, Me
417	A31			Me, Me
418	A31			Me, Me
419	A31			Me, Me
420	A31			Me, Me
421	A31			Me, Me
422	A31			Me, Me
423	A31			Me, Me
424	A31			Me, Me
425	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
426	A31			Me, Me
427	A31			Me, Me
428	A31			Me, Me
429	A31			Me, Me
430	A31			Me, Me
431	A31			Me, Me
432	A31			Me, Me
433	A31			Me, Me
434	A31			Me, Me
435	A31			Me, Me
436	A31			Me, Me
437	A31			Me, Me
438	A31			Me, Me
439	A31			Me, Me
440	A31			Me, Me
441	A31			Me, Me
442	A31			Me, Me
443	A31			Me, Me
444	A31			Me, Me
445	A31			Me, Me
446	A31			Me, Me
447	A31			Me, Me
448	A31			Me, Me
449	A31			Me, Me
450	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
451	A31			Me, Me
452	A31			Me, Me
453	A31			Me, Me
454	A31			Me, Me
455	A31			Me, Me
456	A31			Me, Me
457	A31			Me, Me
458	A31			Me, Me
459	A31			Me, Me
460	A31			Me, Me
461	A31			Me, Me
462	A31			Me, Me
463	A31			Me, Me
464	A31			Me, Me
465	A31			Me, Me
466	A31			Me, Me
467	A31			Me, Me
468	A31			Me, Me
469	A31			Me, Me
470	A31			Me, Me
471	A31			Me, Me
472	A31			Me, Me
473	A31			Me, Me
474	A31			Me, Me
475	A31			Me, Me
476	A31			Me, Me

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
477	A31			Me, Me
478	A31			Me, Me
479	A31			Me, Me
480	A31			Me, Me
481	A31			Me, Me
482	A31			Me, Me
483	A31			Me, Me
484	A31			Me, Me
485	A31			Me, Me
486	A31			Me, Me
487	A31			Me, Me
488	A31			Me, Me
489	A31			Me, Me
490	A31			Me, Me
491	A31			Me, Me
492	A31			Me, Me
493	A29			--ciklopropil--
494	A29			--ciklopropil--
495	A29			--ciklopropil--
496	A29			--ciklopropil--
497	A29			--ciklopropil--
498	A29			--ciklopropil--
499	A29			--ciklopropil--

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
500	A29			-ciklopropil-
501	A29			--ciklopropil-
502	A29			-ciklopropil-
503	A29			-ciklopropil-
504	A29			--ciklopropil-
505	A29			-ciklopropil-
506	A29			-ciklopropil-
507	A29			--ciklopropil-
508	A29			--ciklopropil-
509	A29			-ciklopropil-
510	A29			--ciklopropil-
511	A29			-ciklopropil-
512	A29			--ciklopropil-
513	A29			-ciklopropil-
514	A29			-ciklopropil-
515	A29			-ciklopropil-
516	A29			-ciklopropil-
517	A29			--ciklopropil-
518	A29			--ciklopropil-
519	A29			--ciklopropil-
520	A29			--ciklopropil-
521	A29			-ciklopropil-
522	A29			--ciklopropil-

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
523	A29			-ciklopropil-
524	A29			--ciklopropil-
525	A29			--ciklopropil-
526	A29			--ciklopropil-
527	A29			-ciklopropil-
528	A29			--ciklopropil-
529	A29			--ciklopropil-
530	A29			-ciklopropil-
531	A29			--ciklopropil-
532	A29			-ciklopropil-
533	A29			-ciklopropil-
534	A29			--ciklopropil-
535	A29			--ciklopropil-
536	A29			--ciklopropil-
537	A29			-ciklopropil-
538	A29			-ciklopropil-
539	A29			-ciklopropil-
540	A29			--ciklopropil-
541	A29			--ciklopropil-
542	A29			--ciklopropil-
543	A29			--ciklopropil-
544	A29			--ciklopropil-
545	A29			--ciklopropil-
546	A29			--ciklopropil-
547	A29			--ciklopropil-



(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
548	A29			--ciklopropil--
549	A29			--ciklopropil--
550	A29			--ciklopropil--
551	A29			--ciklopropil--
552	A29			--ciklopropil--
553	A29			--ciklopropil--
554	A29			--ciklopropil--
555	A29			--ciklopropil--
556	A29			--ciklopropil--
557	A29			--ciklopropil--
558	A29			--ciklopropil--
559	A29			--ciklopropil--
560	A29			--ciklopropil--
561	A29			--ciklopropil--
562	A29			--ciklopropil--
563	A29			--ciklopropil--
564	A29			--ciklopropil--
565	A29			--ciklopropil--
566	A29			--ciklopropil--
567	A29			--ciklopropil--
568	A29			--ciklopropil--
569	A29			--ciklopropil--
570	A29			--ciklopropil--
571	A29			--ciklopropil--
572	A29			--ciklopropil--
573	A29			--ciklopropil--
574	A29			--ciklopropil--
575	A29			--ciklopropil--
576	A29			--ciklopropil--
577	A29			--ciklopropil--

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
578	A29			--ciklopropil--
579	A29			--ciklopropil--
580	A29			--ciklopropil--
581	A29			--ciklopropil--
582	A29			--ciklopropil--
583	A29			--ciklopropil--
584	A29			--ciklopropil--
585	A29			--ciklopropil--
586	A29			--ciklopropil--
587	A29			--ciklopropil--
588	A29			--ciklopropil--
589	A29			--ciklopropil--
590	A29			--ciklopropil--
591	A29			--ciklopropil--
592	A29			--ciklopropil--
593	A29			--ciklopropil--
594	A29			--ciklopropil--
595	A29			--ciklopropil--
596	A29			--ciklopropil--
597	A29			--ciklopropil--
598	A29			--ciklopropil--
599	A29			--ciklopropil--
600	A29			--ciklopropil--
601	A29			--ciklopropil--
602	A29			--ciklopropil--
603	A29			--ciklopropil--
604	A29			--ciklopropil--
605	A29			--ciklopropil--



(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
606	A29			--ciklopropil--
607	A29			--ciklopropil--
608	A29			-ciklopropil-
609	A29			--ciklopropil--
610	A29			--ciklopropil--
611	A29			--ciklopropil--
612	A29			--ciklopropil--
613	A29			--ciklopropil--
614	A29			--ciklopropil--
615	A29			-ciklopropil-
616	A29			--ciklopropil--
617	A29			--ciklopropil--
618	A29			-ciklopropil-
619	A29			--ciklopropil--
620	A29			-ciklopropil-
621	A29			--ciklopropil--
622	A29			-ciklopropil-
623	A29			-ciklopropil-
624	A29			--ciklopropil--
625	A29			--ciklopropil--
626	A29			--ciklopropil--
627	A29			-ciklopropil-
628	A29			--ciklopropil--

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
629	A29			--ciklopropil--
630	A29			--ciklopropil--
631	A29			--ciklopropil--
632	A29			--ciklopropil--
633	A29			--ciklopropil--
634	A29			--ciklopropil--
635	A29			-ciklopropil-
636	A29			-ciklopropil-
637	A29			-ciklopropil-
638	A29			--ciklopropil--
639	A29			--ciklopropil--
640	A29			--ciklopropil--
641	A29			-ciklopropil-
642	A29			-ciklopropil-
643	A29			--ciklopropil--
644	A29			--ciklopropil--
645	A29			-ciklopropil-
646	A29			--ciklopropil--
647	A29			--ciklopropil--
648	A29			--ciklopropil--
649	A29			--ciklopropil--
650	A29			--ciklopropil--
651	A29			--ciklopropil--
652	A29			--ciklopropil--
653	A29			-ciklopropil-
654	A29			--ciklopropil--
655	A29			-ciklopropil-

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
656	A29			--ciklopropil--
657	A29			--ciklopropil--
658	A29			--ciklopropil--
659	A29			--ciklopropil--
660	A29			--ciklopropil--
661	A29			--ciklopropil--
662	A29			--ciklopropil--
663	A29			--ciklopropil--
664	A29			--ciklopropil--
665	A29			--ciklopropil--
666	A29			--ciklopropil--
667	A29			--ciklopropil--
668	A29			--ciklopropil--
669	A29			--ciklopropil--
670	A29			--ciklopropil--
671	A29			--ciklopropil--
672	A29			--ciklopropil--
673	A29			--ciklopropil--
674	A29			--ciklopropil--
675	A29			--ciklopropil--
676	A29			--ciklopropil--
677	A29			--ciklopropil--
678	A29			--ciklopropil--
679	A29			--ciklopropil--
680	A29			--ciklopropil--

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
681	A29			--ciklopropil--
682	A29			--ciklopropil--
683	A29			--ciklopropil--
684	A29			--ciklopropil--
685	A29			--ciklopropil--
686	A29			--ciklopropil--
687	A29			--ciklopropil--
688	A29			--ciklopropil--
689	A29			--ciklopropil--
690	A29			--ciklopropil--
691	A29			--ciklopropil--
692	A29			--ciklopropil--
693	A29			--ciklopropil--
694	A29			--ciklopropil--
695	A29			--ciklopropil--
696	A29			--ciklopropil--
697	A29			--ciklopropil--
698	A29			--ciklopropil--
699	A29			--ciklopropil--
700	A29			--ciklopropil--
701	A29			--ciklopropil--
702	A29			--ciklopropil--
703	A29			--ciklopropil--
704	A29			--ciklopropil--
705	A29			--ciklopropil--
706	A29			--ciklopropil--
707	A29			--ciklopropil--

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
708	A29			--ciklopropil--
709	A29			--ciklopropil--
710	A29			--ciklopropil--
711	A29			--ciklopropil--
712	A29			--ciklopropil--
713	A29			--ciklopropil--
714	A29			--ciklopropil--
715	A29			--ciklopropil--
716	A29			--ciklopropil--
717	A29			--ciklopropil--
718	A29			--ciklopropil--
719	A29			--ciklopropil--
720	A29			--ciklopropil--
721	A29			--ciklopropil--
722	A29			--ciklopropil--
723	A29			--ciklopropil--
724	A29			--ciklopropil--
725	A29			--ciklopropil--
726	A29			--ciklopropil--
727	A29			--ciklopropil--
728	A29			--ciklopropil--
729	A29			--ciklopropil--
730	A29			--ciklopropil--

(turpinājums)

Piemērs #	HET	X	Z	R <sub>2</sub>
731	A29			--ciklopropil--
732	A29			--ciklopropil--

kur, ja kādā specifiskā piemērā ir vairāki R<sub>2</sub>, tie tiek atdalīti tabulā ar komatiem (piem., Me, Me vai Et, Me) un kur, ja R<sub>2</sub> kolonna satur vērtību „-grupa-”, tādu kā „-ciklopropilgrupa-”, tad abas R<sub>2</sub> vērtības kopā veido spirogredzenu.

19. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 4-(4-(imidazo[1,2-b]piridazin-2-ilmetoksi)fenil)-2,2-dimetil-5-(piridin-4-il)furan-3(2H)-ons vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

20. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur: (i) savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 19. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli; un (ii) farmaceutiski pieņemamu nesēju vai palīgvielu.

21. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, izmantošanai CNS traucējumu; ēšanas traucējumu; aptaukošanās; azartspēļu atkarības; seksuālo traucējumu; narkolepsijas; miega traucējumu; diabēta; metaboliskā sindroma; šizofrēnijas; šizoafektīvu stāvokļu; Hantingtona slimības; bipolāro traucējumu; distonisko traucējumu; vai tardīvās diskinezijas ārstēšanā cilvēkiem, kam tā ir nepieciešama; vai izmantošanai smēķēšanas atmešanas ārstēšanā cilvēkiem, kam tā ir nepieciešama.

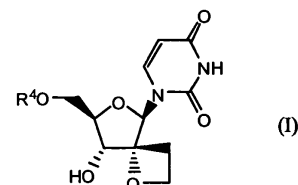
22. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 21. pretenziju, kur kompozīcija tiek izmantota šizofrēnijas vai šizoafektīvu stāvokļu ārstēšanā.

23. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 21. pretenziju, kur kompozīcija tiek izmantota Hantingtona slimības ārstēšanai.

24. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 21. pretenziju, kur kompozīcija tiek izmantota aptaukošanās vai metaboliskā sindroma ārstēšanā.

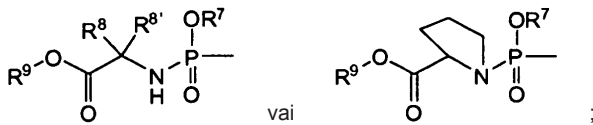
25. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 21. pretenziju, kur kompozīcija tiek izmantota bipolāro traucējumu ārstēšanā.

- (51) **C07H 19/06**<sup>(200601)</sup> (11) **2430035**  
**C07H 19/10**<sup>(200601)</sup>  
**A61K 31/7072**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10718207.3 (22) 11.05.2010  
(43) 21.03.2012  
(45) 03.04.2013  
(31) 09160215 (32) 14.05.2009 (33) EP  
(86) PCT/EP2010/056438 11.05.2010  
(87) WO2010/130726 18.11.2010  
(73) Janssen Products, L.P., 800/850 Ridgeway Drive, Horsham PA 19044, US  
Medivir AB, Lunastigen 7, 141 44 Huddinge, SE  
(72) JONCKERS, Tim, Hugo, Maria, BE  
RABOISSON, Pierre, Jean-Marie, Bernard, BE  
VANDYCK, Koen, BE  
VAN HOOF, Steven, Maurice, Paula, BE  
HU, Lili, BE  
TAHRI, Abdellah, BE  
(74) van Wanrooij, Eva, Tibotec-Virco Virology BVBA, Patent Department, PV 255 Turnhoutseweg 30, BE-2340 Beerse, BE  
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV  
(54) **URACIL-SPIROOKSETĀNA NUKLEOZĪDI**  
**URACYL SPIROOXETANE NUCLEOSIDES**  
(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



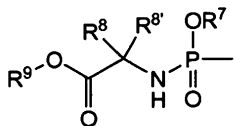


kas ietver jebkurus iespējamus tā stereoizomērus, kur:  
 $R^4$  ir monofosfāta, difosfāta vai trifosfāta esteri; vai  $R^4$  ir grupa ar formulu:



$R^7$  ir fenilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, no kuriem katrs ir neatkarīgi izvēlēts no halogēna atoma,  $C_{1-6}$ alkilgrupas,  $C_{3-6}$ alkenilgrupas,  $C_{1-6}$ alkoksigrupas, hidroksilgrupas un aminogrupas; vai  $R^7$  ir naftilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, no kuriem katrs ir neatkarīgi izvēlēts no halogēna atoma,  $C_{1-6}$ alkilgrupas,  $C_{3-6}$ alkenilgrupas,  $C_{1-6}$ alkoksigrupas, hidroksilgrupas un aminogrupas; vai  $R^7$  ir indolilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu  $C_{1-6}$ alkiloksi-karbonilgrupu un neobligāti turpmāk ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, no kuriem katrs ir neatkarīgi izvēlēts no halogēna atoma,  $C_{1-6}$ alkilgrupas,  $C_{3-6}$ alkenilgrupas,  $C_{1-6}$ alkoksigrupas, hidroksilgrupas un aminogrupas;  $R^8$  ir ūdeņraža atoms,  $C_{1-6}$ alkilgrupa, benzilgrupa vai fenilgrupa;  $R^8$  ir ūdeņraža atoms,  $C_{1-6}$ alkilgrupa, benzilgrupa vai fenilgrupa; vai  $R^8$  un  $R^8$  kopā ar oglekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido  $C_{3-7}$ cikloalkilgrupu;  $R^9$  ir  $C_{1-10}$ alkilgrupa,  $C_{3-7}$ cikloalkilgrupa vai fenil $C_{1-6}$ alkilgrupa, kur fenilgrupējums fenil- vai fenil $C_{1-6}$ alkilgrupā ir neobligāti aizvietots ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, no kuriem katrs ir neatkarīgi izvēlēts no hidroksilgrupas,  $C_{1-6}$ alkoksigrupas, aminogrupas, mono- un di $C_{1-6}$ alkilaminogrupas; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R^4$  ir grupa ar formulu:



3. Savienojums saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju, kur  $R^7$  ir fenilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar halogēna atomu vai ar vienu vai divām  $C_{1-6}$ alkilgrupām, vai  $R^7$  ir naftilgrupa vai indolilgrupa.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju, kur  $R^7$  ir fenilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar halogēna atomu vai ar divām  $C_{1-6}$ alkilgrupām, vai  $R^7$  ir naftilgrupa.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju, kur  $R^7$  ir fenilgrupa vai naftilgrupa.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur  $R^8$  ir ūdeņraža atoms un  $R^8$  ir ūdeņraža atoms vai  $C_{1-6}$ alkilgrupa.

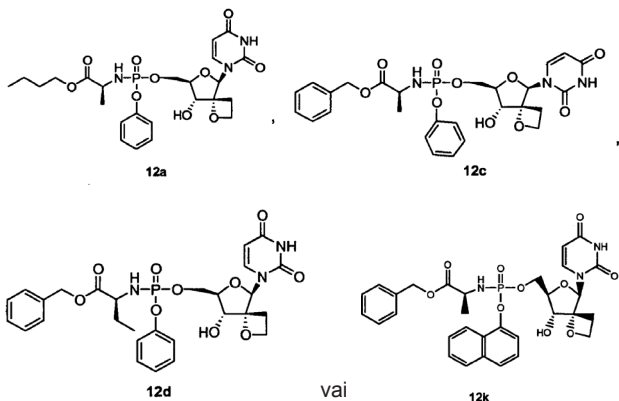
7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur  $R^8$  ir ūdeņraža atoms un  $R^8$  ir metilgrupa vai etilgrupa.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur  $R^9$  ir  $C_{1-6}$ alkilgrupa vai benzilgrupa.

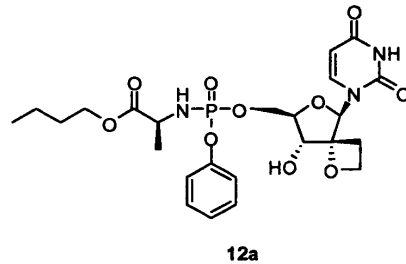
9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur  $R^9$  ir n-butilgrupa vai benzilgrupa.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur  $R^4$  ir monofosfāta, difosfāta vai trifosfāta esteri.

11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ar formulu (I) ir:



12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ar formulu (I) ir:



13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojuma ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, antivirāli efektīvu daudzumu un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai izmantošanai par HCV inhibitoru.

- (51) **G06F 9/455**<sup>(200601)</sup> (11) **2430532**  
**G06F 9/30**<sup>(200601)</sup>
- (21) 10775820.3 (22) 08.11.2010  
(43) 21.03.2012  
(45) 16.10.2013  
(31) 822368 (32) 24.06.2010 (33) US  
(86) PCT/EP2010/067045 08.11.2010  
(87) WO2011/160723 29.12.2011  
(73) International Business Machines Corporation, New Orchard Road, Armonk, NY 10504, US  
(72) GREINER, Dan, US  
OSISEK, Damian, Leo, US  
SLEGEL, Timothy, US  
HELLER, Lisa, US  
(74) Litherland, David Peter, IBM United Kingdom Limited, Intellectual Property Law, Hursley Park, Winchester, Hampshire SO21 2JN, GB  
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV  
(54) **FUNKCIJU VIZUALIZĀCIJAS IERĪCE, LAI BLOKĒTU VIRTUĀLĀ PROCESORA MULTIFUNKCIONĀLAS INSTRUKCIJAS IZPILDES FUNKCIJU FUNCTION VIRTUALIZATION FACILITY FOR BLOCKING INSTRUCTION FUNCTION OF A MULTI-FUNCTION INSTRUCTION OF A VIRTUAL PROCESSOR**  
(57) 1. Datorizpildāms paņēmieni specifisku funkciju bloķēšanai, kas ir jāizpilda saskaņā ar instrukciju, ko izpilda loģiskais procesors, pildot virtuālas mašīnas (resp. datu apstrādes sistēmas) uzdevumu, pie kam paņēmieni satur sekojošas darbības:  
- nosaka (uzdod) (1251) instrukcijas bloķēšanas vērtību (1008), to definējot virtuālai mašīnai, lai bloķētu instrukcijas izpildi, pie tam instrukcijas bloķēšanas vērtība norāda pieļaujāmās funkcijas;  
- minētais loģiskais procesors ienes (1252) instrukciju (1101), kura ir jāizpilda loģiskajam procesoram un kura satur operācijas kodu un specifificējošu funkcijas kodu (1102) no daudziem iespējamajiem funkcijas kodiem, pie tam minēto funkcijas kodu izmanto, lai izvēlētos funkciju, kas ir jāizpilda saskaņā ar instrukciju, un instrukciju atbalsta viens vai vairāki fizikāli procesori;  
- nosaka (1253) instrukcijas bloķēšanas vērtību priekš ienestās instrukcijas, kurai ir funkcijas kods, pie tam minētā noteikšana notiek, salīdzinot (1253) instrukcijas bloķēšanas vērtību, ko definē virtuālā mašīna, ar ienestās instrukcijas operācijas kodu;  
- reaģējot uz instrukcijas bloķēšanas vērtību, kas atļauj (1007, 1255) instrukcijas izpildi, kurai ir funkcijas kods, ienesto instrukciju izpilda ar loģisko procesoru, un  
- reaģējot uz instrukcijas bloķēšanas vērtību, kas neatļauj (1006, 1256) instrukcijas izpildi, kurai ir funkcijas kods, ienestās instrukcijas izpildi bloķē un izpilda programmas izņēmuma notikumu (resp., datu apstrādes sistēmā izpilda kādu citu darbību).  
2. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur sekojošas darbības:  
- instrukcijas bloķēšanas vērtību (1008) definē priekš virtuālās mašīnas, lai bloķētu funkciju izpildi, kas ir jāizpilda saskaņā ar



instrukciju, pie tam instrukcijas bloķēšanas vērtību nosaka, reaģējot uz virtuālās mašīnas darbības iespējošanu uz fizikālā procesora;

- nosaka (1351) citu instrukcijas bloķēšanas vērtību, kuru definē priekš citas virtuālās mašīnas un izpilda uz cita loģiskā procesora, pie tam minēto citu instrukcijas bloķēšanas vērtību nosaka, reaģējot uz citas virtuālās mašīnas darbības iespējošanu uz fizikālā procesora, un,

- reaģējot uz minēto citu instrukcijas bloķēšanas vērtību, atļauj (1352) instrukcijas izpildi, kurai ir funkcijas kods, kas atļauj instrukcijas izpildi ar citu loģisko procesoru, un,

- reaģējot uz minēto citu instrukcijas bloķēšanas vērtību, neatļauj (1256) instrukcijas izpildi, kurai ir funkcijas kods, kas bloķē instrukcijas izpildi ar citu loģisko procesoru.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam instrukcijas bloķēšanas vērtības noteikšana papildus satur sekojošas darbības:

- izmanto operācijas kodu, lai to indeksētu/iezīmētu ar indeksu tabulā (907) un ievietotu instrukcijas bloķēšanas vērtību, kas definēta priekš virtuālās mašīnas, pie tam instrukcijas bloķēšanas vērtība satur atļaujas lauku (1002, 1003);

- izmanto atļaujas lauku, lai pieļaujāmās funkcijas noteiktu salīdzināšanas ceļā ar ienestās instrukcijas kodu, un,

- reaģējot uz funkciju, kas ir atļautā funkcija, nosaka (1007), ka instrukcijas izpilde tiek atļauta, un,

- reaģējot uz funkciju, kas nav atļautā funkcija, nosaka (1006), ka instrukcijas izpilde netiek atļauta.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur sekojošu darbību:

- nosaka, vai instrukcija ir atļautā instrukcija, sasaistot instrukcijas operācijas kodu ar instrukcijas bloķēšanas vērtību.

5. Datorsistēma specifisku instrukciju bloķēšanai, lai tās neizpildītu procesors, kura satur:

- atmiņu,
- procesoru komunikācijā ar atmiņu, pie tam procesors satur instrukciju ieneses elementu no atmiņas un vienu vai vairākus elementus, lai izpildītu ienestās instrukcijas,

- pie tam datorsistēma ir konfigurēta, lai izpildītu paņēmienu, kas definēts jebkurā no 1. līdz 4. pretenzijai.

6. Datorprogramma, kas ir ielādējama datorsistēmas saskaņā ar 5. pretenziju atmiņā un kas satur izpildei paredzētas programmatūras koda daļas, kad minētā programma tiek darbināta datorsistēmā, lai izpildītu paņēmienu operācijas tā, kā tās ir definētas no 1. līdz 4. pretenzijai.

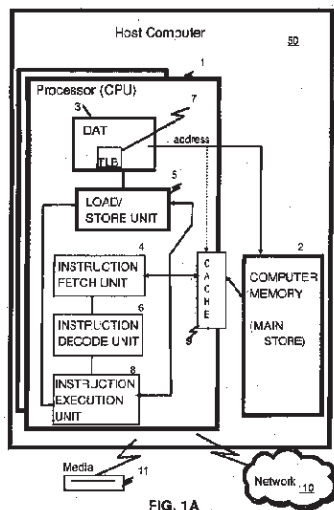


FIG. 1A

- |                                     |                 |         |
|-------------------------------------|-----------------|---------|
| (51) G06F 13/28 <sup>(200601)</sup> | (11) 2430557    |         |
| G06F 12/10 <sup>(200601)</sup>      |                 |         |
| (21) 10779511.4                     | (22) 08.11.2010 |         |
| (43) 21.03.2012                     |                 |         |
| (45) 16.10.2013                     |                 |         |
| (31) 821172                         | (32) 23.06.2010 | (33) US |
| (86) PCT/EP2010/067042              | 08.11.2010      |         |
| (87) WO2011/160721                  | 29.12.2011      |         |

(73) International Business Machines Corporation, New Orchard Road, Armonk, NY 10504, US

(72) CRADDOCK, David, US  
GREINER, Dan, US  
SCHMIDT, Donald, William, US  
GREGG, Thomas, US

(74) Roberts, Scott Anthony, et al, IBM United Kingdom Limited, Intellectual Property Law, Hursley Park, Winchester, Hampshire SO21 2JN, GB

Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV

(54) **ADRESES TELPAS ATKĀRTOTA IZMĒRA NOTEIKŠANA (REDIMENSIONĒŠANA) VIENLAICĪGI AR PIEKĻUVI ADRESEI**

**RESIZING ADDRESS SPACES CONCURRENT TO ACCESSING THE ADDRESS SPACES**

(57) 1. Paņēmiens adreses telpas pārvaldībai (vadībai) datORIZĒTĀ vidē, kas raksturīgs ar to, ka vienlaicīgi ar adaptera (110) piekļūšanu pie tiešpiekļuves atmiņas (DMA, Direct Memory Access) adreses telpas (200) izpilda darbības a) un b):

a) reaģējot uz MPFC instrukciju (Modify PCI Function Controls, t.i., modificēt PCI specifikācijas funkciju vadīšanu) pārreģistrēt funkciju, kas ietver turi (t.i., lokālu identifikatoru, ar kura palīdzību var realizēt piekļuvi kādai ierīcei) adaptera izvietošanai, MPFC instrukcija specifificē jaunas DMA adreses telpas robežu, kas saistīta ar DMA adreses telpu, un

b) informē adapteri, ka DMA adreses telpas robeža ir izmainīta.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, DMA adreses telpas izmēru palielina.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, DMA adreses telpas izmēru palielina, DMA adreses telpai pievienojot atmiņu un atjaunojot jaunās DMA adreses telpas robežu, kas definē DMA adreses telpas ārējo robežu.

4. Paņēmiens saskaņā ar 3. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, MPFC instrukcija specifificē ievades/izvades (I/O) adreses translēšanas rādītāju, lai piekļūtu pie adreses translēšanas tabulas, un translēšanas formātu, pie tam, reaģējot uz DMA adreses telpas izmēra palielināšanu,

- nosaka, vai adreses translēšanai ir jāizmanto viens vai vairāki adreses translācijas tabulu papildu līmeņi, kas tiek izmantoti piekļuvei pie DMA adreses telpas atmiņas;

- inicializē vienu vai vairākas adreses translēšanas tabulas, reaģējot uz to, ka ir noteikts, ka ir jāizmanto viens vai vairāki adreses translēšanas tabulu papildu līmeņi;

- atjauno I/O adreses translēšanas rādītāju, lai norādītu uz vienu jaunu adreses translēšanas tabulu no vienas vai vairākām jaunajām adresu translēšanas tabulām, reaģējot uz vienas vai vairāku jaunu adreses translēšanas tabulu inicializāciju, un
- atjauno translēšanas formātu, reaģējot uz I/O adreses translēšanas rādītāja atjaunošanu.

5. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam translēšanas tabulas formātu izmanto piekļuvei pie DMA adreses telpas atmiņas pirms redimensionēšanas un, reaģējot uz DMA adreses telpas izmēra palielināšanu, izmanto vienu vai vairākas adreses translēšanas tabulas.

6. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, DMA adreses telpas izmēru samazina.

7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, DMA adreses telpas izmēru samazina:

- noņemot no DMA adreses telpas atmiņu un
- atjaunojot jaunās DMA adreses telpas robežu, lai definētu adreses telpas ārējo robežu.

8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, MPFC instrukcija specifificē ievades/izvades (I/O) adreses translēšanas rādītāju, lai piekļūtu pie adreses translēšanas tabulas, un translēšanas formātu, pie tam, reaģējot uz DMA adreses telpas izmēra samazināšanu,

- nosaka, vai adreses translēšanai nav jāizmanto viens vai vairāki adreses translēšanas tabulu papildu līmeņi, kas tiek izmantoti piekļuvei pie DMA adreses telpas atmiņas;

- atjauno I/O adreses translēšanas rādītāju, reaģējot uz adreses translēšanas tabulu viena vai vairāku līmeņu noteikšanu, kuri nav izmantoti, un

- atjauno translēšanas formātu, reaģējot uz I/O adreses translēšanas rādītāja atjaunošanu.

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, pie kam, reaģējot uz DMA adreses telpas izmēra samazināšanos,

- nosaka, vai DMA adreses telpā eksistē viena vai vairākas ieejas kešatmiņā, un

- to atfīra (atbrīvo) no vismaz vienas vai vairākām eksistējošām ieejām.

10. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, pie kam adreses translēšanai izmanto vienu vai vairākas adreses translēšanas tabulas, kuras tika izmantotas piekļuvei pie DMA adreses telpas atmiņas pirms redimensionēšanas, un, reaģējot uz adreses telpas izmēra samazināšanos, viena vai vairākas adreses translēšanas tabulas nav nepieciešamas.

11. Datorsistēma (100) adreses telpas pārvaldībai (vadībai) datorizētā vidē, pie kam datorsistēma ietver:

- atmiņu (104) un
- procesoru (102) komunikācijā ar atmiņu,

kas raksturīga ar to, ka datorsistēma ir konfigurēta paņēmienu izpildei, kurš vienlaicīgi ar adaptera (110) piekļūšanu pie tiešpikļuves atmiņas (DMA, Direct Memory Access) adreses telpas (200) izpilda darbības a) un b):

a) reaģējot uz MPFC instrukciju (Modify PCI Function Controls) pārreģistrēt funkciju, kas ietver turi adaptera izvietošanai, MPFC instrukcija specifībā jaunās DMA adreses telpas robežu, kas saistīta ar DMA adreses telpu, un

b) informē adapteri, ka DMA adreses telpas robeža ir izmainīta.

12. Datorsistēma saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu,

- DMA adreses telpas izmēru palielina, DMA adreses telpai pievienojot atmiņu, un

- atjauno jaunās DMA adreses telpas robežu, kas definē DMA adreses telpas ārējo robežu.

13. Datorsistēma saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, MPFC instrukcija specifībā ievades/izvades (I/O) adreses translēšanas rādītāju, lai piekļūtu pie adreses translēšanas tabulas, un translēšanas formātu, pie tam, reaģējot uz DMA adreses telpas izmēra palielināšanos,

- nosaka, vai adreses translēšanai ir jāizmanto viens vai vairāki adreses translācijas tabulu papildu līmeņi, kas tiek izmantoti piekļuvei pie DMA adreses telpas atmiņas;

- inicializē vienu vai vairākas adreses translēšanas tabulas, reaģējot uz to, ka ir noteikts, ka ir jāizmanto viens vai vairāki adreses translēšanas tabulu papildu līmeņi;

- atjauno I/O adreses translēšanas rādītāju, lai norādītu uz vienu jaunu adreses translēšanas tabulu no vienas vai vairākām jaunajām adreses translēšanas tabulām, reaģējot uz vienas vai vairāku jaunu adreses translēšanas tabulu inicializāciju, un

- atjauno translēšanas formātu, reaģējot uz I/O adreses translēšanas rādītāja atjaunošanu.

14. Datorsistēma saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, DMA adreses telpas izmēru samazina, pie kam samazināšana satur:

- atmiņas noņemšanu no DMA adreses telpas un
- jaunās DMA adreses telpas robežas atjaunošanu, lai definētu adreses telpas ārējo robežu.

15. Datorsistēma saskaņā ar 14. pretenziju, pie kam, reaģējot uz MPFC instrukcijas izpildīšanu, MPFC instrukcija specifībā ievades/izvades (I/O) adreses translēšanas rādītāju, lai piekļūtu pie adreses translēšanas tabulas, un translēšanas formātu, pie tam, reaģējot uz DMA adreses telpas izmēra samazināšanu,

- nosaka, vai adreses translēšanai nav jāizmanto viens vai vairāki adreses translēšanas tabulu papildu līmeņi, kas tiek izmantoti piekļuvei pie DMA adreses telpas atmiņas;

- atjauno I/O adreses translēšanas rādītāju, reaģējot uz adreses translēšanas tabulu viena vai vairāku līmeņu noteikšanu, kuri nav izmantoti, un

- atjauno translēšanas formātu, reaģējot uz I/O adreses translēšanas rādītāja atjaunošanu.

16. Datorprogrammas produkts adreses telpas pārvaldībai datorizētā vidē, pie kam datorprogrammas produkts ietver datorlasāmu atmiņas vidi, kas ir nolasāma ar apstrādes shēmu, kura izpilda paņēmienu instrukcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai.

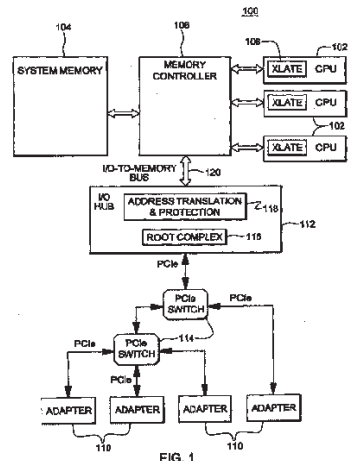
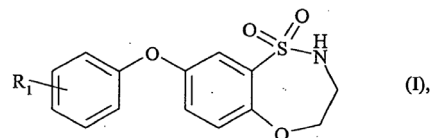


FIG. 1

- (51) **C07D 291/08**<sup>(200601)</sup> (11) **2431360**
- A61K 31/551**<sup>(200601)</sup>
- A61P 25/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 11290413.1 (22) 15.09.2011
- (43) 21.03.2012
- (45) 17.04.2013
- (31) 1003683 (32) 16.09.2010 (33) FR
- (73) Les Laboratoires Servier, 35, rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR
- (72) CORDI, Alexis, FR  
DESOS, Patrice, FR  
LESTAGE, Pierre, FR  
DANOBER, Laurence, FR  
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **DIHIDROBENZOKSATIAZEPĪNA ATVASINĀJUMI, TO IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS UN TOS SATUROŠAS FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS, KA ARĪ TO IZMANTOŠANAS PAR AMPA RECEPTORU MODULATORIEM DERIVATIVES OF DIHYDROBENZOXATHIAZEPINE, METHOD OF PREPARING SAME AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THEM AS WELL AS THEIR USES AS MODULATORS OF AMPA RECEPTORS**
- (57) 1. Savienojumi ar formulu (I):



kur R<sub>1</sub> apzīmē ūdeņraža atomu, ciāngrupu, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksikarbonilgrupu ar taisnu vai sazarotu virkni, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu, kurā katrs alkil-atlikums ir ar taisnu vai sazarotu virkni, N-hidroksikarboksimidamidogrupu vai heterociklisku grupu, to enantiomēri un diastereoizomēri un arī farmaceutiski pieņemami pievienotās skābes vai bāzes sāļi, turklāt jāņem vērā, ka termins „heterocikliska grupa” apzīmē 5-locekļu monociklisku aromātisku grupu, kas satur vienu līdz četrus heteroatomus, kuri ir vienādi vai dažādi un kuri izvēlēti no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma, pie tam minētā heterocikliskā grupa, iespējams, aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri ir vienādi vai dažādi un kuri izvēlēti no (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni un (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)polihalogēnalkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni.

2. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> apzīmē heterociklisku grupu.

3. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> apzīmē 5-locekļu monociklisku aromātisku heterociklisku grupu, kas satur vismaz vienu slāpekļa atomu, pie tam minētā grupa, iespējams, aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri ir vienādi vai dažādi un izvēlēti no (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni un (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)polihalogēnalkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni.

4. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> apzīmē pirolilgrupu, pirazolilgrupu, imidazolilgrupu, triazolilgrupu, tetrazolilgrupu, izoksazolilgrupu, oksazolilgrupu, izotiazolilgrupu; tiazolilgrupu, tiadiazolilgrupu, ditiazolilgrupu vai oksadiazolilgrupu, pie tam katra no grupām, iespējams, ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri ir vienādi vai dažādi un kuri izvēlēti no (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni un (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)polihalogēnalkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni.

5. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> apzīmē tiazolilgrupu vai oksadiazolilgrupu, pie tam katra no grupām, iespējams, ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri ir vienādi vai dažādi un kuri izvēlēti no (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni un (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)polihalogēnalkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni.

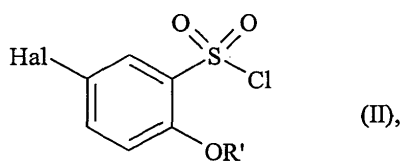
6. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> apzīmē 1,3-tiazolilgrupu vai 1,2,4-oksadiazolilgrupu, pie tam katra no grupām, iespējams, ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri ir vienādi vai dažādi un kuri izvēlēti no (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni un (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)polihalogēnalkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni.

7. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> apzīmē 1,3-tiazolilgrupu vai 1,2,4-oksadiazolilgrupu, kas aizvietota ar metilgrupu vai trifluormetilgrupu.

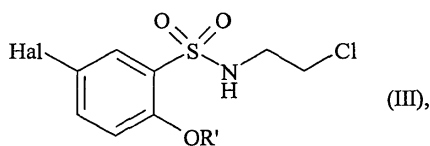
8. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgi ar to, ka R<sub>1</sub> ir fenoksi-gredzena meta-stāvoklī.

9. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kuri ir:  
 • 8-[3-(5-metil-1,2,4-oksadiazol-3-il)fenoksi]-3,4-dihidro-2H-5,1,2-benzoksatiazepīna 1,1-dioksīds;  
 • 8-[3-(3-metil-1,2,4-oksadiazol-5-il)fenoksi]-3,4-dihidro-2H-5,1,2-benzoksatiazepīna 1,1-dioksīds;  
 to enantiomēri un diastereoizomēri un arī farmaceitiski pieņemami pievienotās skābes vai bāzes sāļi.

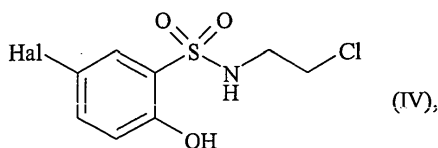
10. Savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanas paņēmieni, kas raksturīgs ar to, ka par izejvielu izmanto savienojumu ar formulu (II):



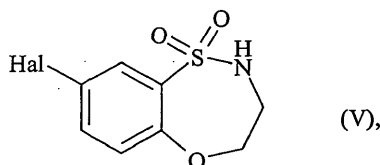
kur Hal apzīmē halogēna atomu, piemēram, fluora atomu, hlora atomu vai broma atomu un R' apzīmē (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkilgrupu ar taisnu vai sazarotu virkni, kurš reaģē ar 2-hloretilamīnu bāziskā vidē, iegūstot savienojumu ar formulu (III):



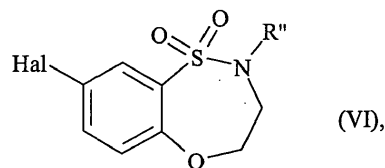
kur Hal un R' ir tādas, kā definēts iepriekš, kuru pēc tam pakļauj boru saturoša savienojuma iedarbībai, iegūstot savienojumu ar formulu (IV):



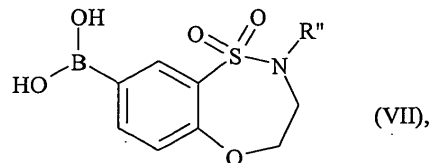
kur Hal ir tāda, kā definēts iepriekš, kuru pēc tam ciklizē, iegūstot savienojumu ar formulu (V):



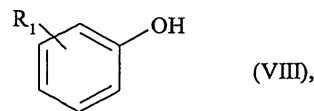
kur Hal ir tāda, kā definēts iepriekš, kuru pakļauj slāpekļa atoma aizsargāšanas reakcijai, iegūstot savienojumu ar formulu (VI):



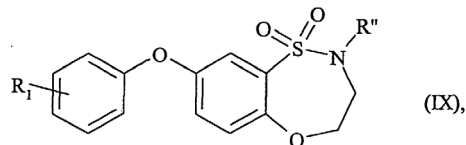
kur Hal ir tāda, kā definēts iepriekš, un R'' apzīmē aminofunkcijas aizsarggrupu, piemēram, *tert*-butiloksikarbonilgrupu, kuru pārvērš boronskābes atvasinājumā, iegūstot savienojumus ar formulu (VII):



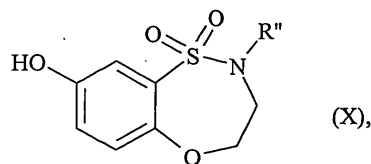
kur R'' ir tāda, kā definēts iepriekš, kurš reaģē ar spirtu ar formulu (VIII):



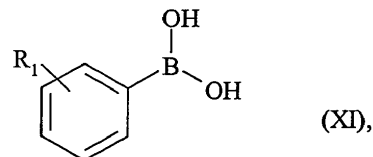
kur R<sub>1</sub> ir tāda, kā definēts formulai (I), iegūstot savienojumu ar formulu (IX):



kur R<sub>1</sub> un R'' ir tādas, kā definēts iepriekš; kuru pēc tam pakļauj aminoaizsarggrupas atšķelšanas reakcijai, iegūstot savienojumu ar formulu (I), savienojumu ar formulu (I) iegūšanas paņēmiena variantā ietilpst savienojumu ar formulu (VII) hidrolīze, iegūstot savienojumu ar formulu (X):

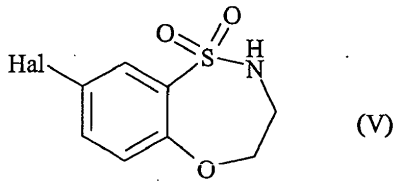


kur R'' ir tāda, kā definēts iepriekš, kurš reaģē ar boronskābes savienojumu ar formulu (XI):



kur R<sub>1</sub> ir tāda, kā definēts formulai (I), iegūstot savienojumu ar formulu (IX), kuru pēc tam pakļauj aminoaizsarggrupas atšķelšanas reakcijai, iegūstot savienojumu ar formulu (I), cita alternatīva savienojumu ar formulu (I) iegūšanas paņēmienā sastāv no parasto ķīmisko reakciju izmantošanas, pēc savienojumu ar formulu (IX) iegūšanas, lai vēlāk mainītu aizvietotāju fenoksigredzenā, pēc tam šo savienojumu ar formulu (I) var attīrīt ar attīrīšanas standartpaņēmieni, pārvērst, ja nepieciešams, farmaceitiski pieņemamos pievienotās skābes vai bāzes sāļos un, iespējams, sadalīt izomēros saskaņā ar sadalīšanas standartpaņēmieni.

11. Savienojumi ar formulu (V):



kur Hal apzīmē halogēna atomu, piemēram, fluora atomu, hlora atomu vai bromu atomu, kas raksturīgi ar to, ka šos savienojumus izmanto kā starpproduktus savienojumu ar formulu (I) iegūšanai.

12. Farmaceutiska kompozīcija, kas par aktīvu ingredientu satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai kombinācijā ar vienu vai vairākiem inertiem, netoksiskiem farmaceutiski pieņemamiem nesējiem.

13. Farmaceutiskās kompozīcijas saskaņā ar 12. pretenziju, kuras izmanto kā AMPA receptora modulatorus.

14. Farmaceutiskās kompozīcijas saskaņā ar 12. pretenziju, kuras izmanto atmiņas un izziņas traucējumu, kas saistīti ar novecošanos, nemiera vai depresijas sindromiem, progresīvajām neirodeģeneratīvajām slimībām, Alcheimera slimību, Pārkinsona slimību, Pika slimību, Hantingtona horeju, Korsakova slimību, šizofrēniju, akūtu neirodeģeneratīvo slimību komplikācijām, pieres daivas un subkortikālo demenci, išēmiskās slimības komplikācijām un epilepsijas slimības komplikācijām, ārstēšanā vai profilaksē.

15. Savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai izmantošana medikamentu ražošanā, kurus izmanto kā AMPA receptora modulatorus.

16. Savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai izmantošana medikamentu ražošanā, kurus izmanto atmiņas un izziņas traucējumu, kas saistīti ar novecošanos, nemiera vai depresijas sindromiem, progresīvajām neirodeģeneratīvajām slimībām, Alcheimera slimību, Pārkinsona slimību, Pika slimību, Hantingtona horeju, Korsakova slimību, šizofrēniju, akūtu neirodeģeneratīvo slimību komplikācijām, pieres daivas un subkortikālo demenci, išēmiskās slimības komplikācijām un epilepsijas slimības komplikācijām, ārstēšanā vai profilaksē.

17. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kurus izmanto kā AMPA receptora modulatorus.

18. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kurus izmanto atmiņas un izziņas traucējumu, kas saistīti ar novecošanos, nemiera vai depresijas sindromiem, progresīvajām neirodeģeneratīvajām slimībām, Alcheimera slimību, Pārkinsona slimību, Pika slimību, Hantingtona horeju, Korsakova slimību, šizofrēniju, akūtu neirodeģeneratīvo slimību komplikācijām, pieres daivas un subkortikālo demenci, išēmiskās slimības komplikācijām un epilepsijas slimības komplikācijām, ārstēšanā vai profilaksē.

(54) (+/-)-FENIL[4-[4-[[[4'-(TRIFLUORMETIL)-2-BIFENILIL]KARBONIL]AMINO]FENIL]-1-PIPERIDINIL]ETIĶSKĀBES METILESTERA SADALĪŠANA  
RESOLUTION OF (±)-METHYL PHENYL[4-[4-[[[4'-(TRIFLUOROMETHYL)-2-BIPHENYLYL]CARBONYL]AMINO]PHENYL]-1-PIPERIDINYL]ACETATE

(57) 1. Paņēmiens (2S)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izolēšanai no (±)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera vai no tā pievienotas skābes sāls, kas ietver šādas secīgas stadijas:

a) (±)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera vai tā pievienotas skābes sāls sajaukšanu ar piemērotu (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes vai tās sārmu vai sārmzemju metāla sāls daudzumu piemērotā šķīdinātājā pie paaugstinātas temperatūras;

b) (a) stadijas maisījuma dzesēšanu un nogulsnētā (2S)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes sāls savākšanu un (2R)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes sāli saturošā filtrāta atdalīšanu; un

c) (2S)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera atdalīšanu no minētā nogulsnētā sāls;

un, neobligāti, (2S)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera pārvēršanu par farmaceutiski pieņemamu sāli.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs (a) stadijā ir izvēlēts no 2-butanona, 4-metil-2-pentanona, etilacetāta un 1-propanola vai to maisījumiem.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs (a) stadijā ir 2-butanons.

4. Paņēmiens saskaņā ar 3. pretenziju, kur a) stadija tiek veikta temperatūru diapazonā no 60 līdz 65°C.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kur maisījums (b) stadijā tiek atdzesēts saskaņā ar nelineāru dzesēšanas līkni.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kur dzesēšanas līkne satur dzesēšanu līdz 55°C 15 minūšu laikā, līdz 17,5°C 4 stundu laikā un līdz 17°C laika posmā no 1 stundas līdz 16 stundām.

7. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes daudzuma un (±)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera daudzumu molārā attiecība ir diapazonā no 0,5 līdz 1,1.

8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, kur molārā attiecība ir 1,05.

9. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur (2S)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes sāls (c) stadijā tiek pārvērsts tā brīvas bāzes formā, šķīdinot minētā sāli organiskā šķīdinātājā pie paaugstinātas temperatūras, kam seko ūdens šķīduma, kas satur neorganisku vai organisku bāzi, pievienošana, iegūtā reakcijas maisījuma dzesēšana un nogulsnētā (2S)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera savākšana.

10. Paņēmiens saskaņā ar 9. pretenziju, kur organiskais šķīdinātājs ir propilēnglikolmonometilēteris.

11. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur (2R)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes sāls, kas atrodas b) stadijā izdalītajā filtrātā, tiek epimerizēts par (±)-fenil[4-[4-[[[4'-(trifluorometil)-2-bifenilil]karbonil]amino]fenil]-1-piperidinil]etiķskābes metilestera (S)-N-[(4-metoksifenil)sulfonyl]glutamīnskābes sāli, sasildot šo filtrātu pie paaugstinātas temperatūras ilgstošā laika posmā, neobligāti zem paaugstināta spiediena.

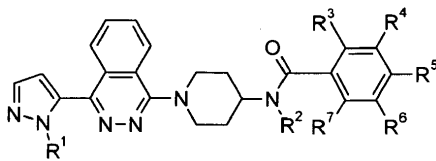
12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, kur epimerizācija tiek veikta pie temperatūras 100°C zem spiediena starp 350 kPa un 400 kPa.

(51) <b>C07D 211/34</b> <sup>(200601)</sup>	(11) <b>2435406</b>
<b>A61K 31/451</b> <sup>(200601)</sup>	
(21) 10724047.5	(22) 27.05.2010
(43) 04.04.2012	
(45) 06.03.2013	
(31) 09161460	(32) 29.05.2009
(86) PCT/EP2010/057319	(33) EP
(87) WO2010/136526	27.05.2010
(73) Janssen Pharmaceutica, N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE	02.12.2010
(72) COPMANS, Alex Herman, BE HOET, Jérôme Albert Joseph, BE WILLEMSSENS, Albert Louis Anna, BE COUCK, Wouter Louis J., BE VAN DUN, Joannes Petrus, BE	
(74) Verberckmoes, Filip Gerard, Janssen Pharmaceutica N.V., J&J Patent Law Department, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV	

(51) <b>C07D 401/14</b> <sup>(200601)</sup>	(11) <b>2443104</b>
<b>A61K 31/502</b> <sup>(200601)</sup>	
<b>A61P 35/00</b> <sup>(200601)</sup>	



- (21) 10726756.9 (22) 15.06.2010  
 (43) 25.04.2012  
 (45) 17.04.2013  
 (31) 218628 P (32) 19.06.2009 (33) US  
 (86) PCT/US2010/038568 15.06.2010  
 (87) WO2010/147917 23.12.2010  
 (73) Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US  
 (72) HIPSkind, Philip, Arthur, US  
 PATEL, Bharvin, Kumar, US  
 WILSON (NEE TAKAKUWA), Takako, US  
 (74) Suarez-Miles, Ana Sanchiz, Eli Lilly and Company Limited, European Patent Operations, Lilly Research Centre, Erl Wood Manor, Sunninghill Road, Windlesham, Surrey GU20 6PH, GB  
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  
 (54) **DIVAIZVIETOTI FTALAZĪNI KĀ HEDGEHOG SIGNĀL-CEĻA ANTAGONISTI**  
**DISUBSTITUTED PHTHALAZINE HEDGEHOG PATHWAY ANTAGONISTS**  
 (57) 1. Savienojums ar formulu:



kur:

- R<sup>1</sup> ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa;  
 R<sup>2</sup> ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa; un  
 katra grupa R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, fluora atoms, hlora atoms, ciāngrupa, trifluormetilgrupa, trifluormetoksigrupa, difluormetoksigrupa, metilsulfonilgrupa vai trifluormetilsulfonilgrupa, ar nosacījumu, ka vismaz trīs no R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> ir ūdeņraža atoms; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R<sup>1</sup> ir metilgrupa, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur R<sup>2</sup> ir metilgrupa, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur katra grupa R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, fluora atoms, hlora atoms, trifluormetilgrupa vai metilsulfonilgrupa, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur katrs aizvietotājs R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, fluora atoms vai trifluormetilgrupa, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur katra grupa R<sup>4</sup>, R<sup>6</sup> un R<sup>7</sup> ir ūdeņraža atoms, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas ir 4-fluor-*N*-metil-*N*-(1-(4-(1-metil-1*H*-pirazol-5-il)ftalazin-1-il)pipe-ridin-4-il)-2-(trifluormetil)benzamīds vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.  
 8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas ir 4-fluor-*N*-metil-*N*-(1-(4-(1-metil-1*H*-pirazol-5-il)ftalazin-1-il)pi- peridin-4-il)-2-(trifluormetil)benzamīda hidrohlorīds.  
 9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli kopā ar farmaceutiski pieņemamu nesēju, atšķaidītāju vai pild- vielu.  
 10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kuru izmanto terapijā.  
 11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kuru izmanto vēža ārstēšanā.  
 15. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kuru izmanto saskaņā ar 11. pretenziju, kur vēzis ir smadzeņu vēzis, bazālo šūnu karcinoma, barības vada vēzis, kuņģa vēzis, kuņģa- zarnu trakta vēzis, aizkuņģa dziedzera vēzis, žultsceļu vēzis, pro- stātas vēzis, krūts vēzis, sīkšūnu plaušu vēzis, nesīkšūnu plaušu vēzis, B-šūnu limfoma, multiplā mieloma, olnīcu vēzis, kolorektālais vēzis, aknu vēzis, nieru vēzis, melanoma, galvas un kakla vēzis,

mezotelioma, mīksto audu sarkomas, kaulu sarkomas, leukēmija vai sēklinieku vēzis.

- (51) **C07C 209/62**<sup>(200601)</sup> (11) **2448910**  
**C07C 209/16**<sup>(200601)</sup>  
**C07C 211/35**<sup>(200601)</sup>  
 (21) 10740144.0 (22) 28.06.2010  
 (43) 09.05.2012  
 (45) 15.05.2013  
 (31) 09008466 (32) 29.06.2009 (33) EP  
 269766 P 29.06.2009 US  
 (86) PCT/EP2010/003921 28.06.2010  
 (87) WO2011/000538 06.01.2011  
 (73) Merz Pharma GmbH & Co. KGaA, Eckenheimer Land- strasse 100, 60318 Frankfurt Main, DE  
 (72) KOLLER, Herbert, AT  
 PYERIN, Michael, AT  
 SBROGIÒ, Federico, IT  
 (74) Ricker, Mathias, et al, Wallinger Ricker Schlotter Tostmann, Patent- und Rechtsanwälte, Zweibrückenstrasse 5-7, 80331 München, DE  
 Njina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV  
 (54) **NERAMEKSĀNA IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**  
**METHOD OF PREPARING NERAMEXANE**  
 (57) 1. 1-Amino-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksāna vai tā farma- ceitiski pieņemama sāls iegūšanas paņēmiens, kas vismaz ietver etapus no (i) līdz (iv):  
 (i) izoforona konversija par 3,3,5,5-tetrametilcikloheksanonu;  
 (ii) etapā (i) iegūtā 3,3,5,5-tetrametilcikloheksanona konversija par 1-hidroksi-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu;  
 (iii) etapā (ii) iegūtā 1-hidroksi-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksāna konversija par 1-hloracetamido-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu;  
 (iv) etapā (iii) iegūtā 1-hloracetamido-1,3,3,5,5-pentametilciklohek- sāna konversija par 1-amino-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu;  
 kur vismaz viens no 3,3,5,5-tetrametilcikloheksanona, 1-hid- roksi-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksāna, 1-hloracetamido-1,3,3,5,5- pentametilcikloheksāna savienojumiem nav kāda attīrīšanas etapa objekts.  
 2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur konversija etapā (i) tiek veikta, izoforonam reaģējot ar metilmagnija hlorīdu vara(I) halogenīda un litija halogenīda klātbūtnē.  
 3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur konversija etapā (ii) tiek veikta, 3,3,5,5-tetrametilcikloheksanonam reaģējot ar metilmagnija hlorīdu.  
 4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur konversija etapā (iii) tiek veikta, 1-hidroksi-1,3,3,5,5-pentametil- cikloheksānam reaģējot ar hloracetamidonu skābā šķīdumā.  
 5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām preten- zijām, kur konversija etapā (iv) tiek veikta maisījuma, kas satur 1-hloracetamido-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu, tiourīnvielu un ūdeni, reakcijā.  
 6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, tālāk ietver etapu (v):  
 (v) etapā (iv) iegūtā 1-amino-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksāna konversija par tā farmaceutiski pieņemamu sāli;  
 7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, kur konversija etapā (v) tiek veikta, 1-amino-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānam reaģējot ar skābi.  
 8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju, kur skābe ir metān- sulfoskābe.  
 9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ietver etapus:  
 (i) izoforona konversija par 3,3,5,5-tetrametilcikloheksanonu metilmagnija hlorīda, vara(I) jodīda, litija hlorīda un tetrahidrofurāna klātbūtnē;  
 (ii) etapā (i) iegūtā 3,3,5,5-tetrametilcikloheksanona konversija par 1-hidroksi-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu metilmagnija hlorīda un tetrahidrofurāna klātbūtnē;  
 (iii) etapā (ii) iegūtā 1-hidroksi-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksāna konversija par 1-hloracetamido-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu hloracetamidona, etiķskābes un sērskābes klātbūtnē;

(iv) etapā (iii) iegūtā 1-hloracetamido-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksāna konversija par 1-amino-1,3,3,5,5-pentametilcikloheksānu tiourīnvielas, ūdens un sālskābes klātbūtnē.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur minētais metilmagnija hlorīds nesatur etilmagnija hlorīda piejaukumu.

- |  |                         |
|--|-------------------------|
| (51) <b>F03D 3/04</b> <sup>(200601)</sup>  | (11) <b>2459873</b>     |
| (21) 10703268.2  | (22) 10.02.2010         |
| (43) 06.06.2012  |                         |
| (45) 15.05.2013  |                         |
| (31) RE20090077  | (32) 28.07.2009 (33) IT |
| (86) PCT/EP2010/051650   | 10.02.2010              |
| (87) WO2011/012334   | 03.02.2011              |
| (73) Comet - S.r.l., Via della Solidarietà 1/A, 40056 Crespellano (Bologna), IT                        |                         |
| (72) GAMBERINI, Enzo, IT   |                         |
| (74) Corradini, Corrado, Ing. C. Corradini & C. S.r.l., Via Dante Alighieri 4, 42100 Reggio Emilia, IT |                         |
| Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV   |                         |

(54) **VĒJA TURBĪNA  
A WIND TURBINE**

(57) 1. Vēja turbīnas iekārta, kas satur pamata rāmi (1), kurš balsta rotoru ar vertikālu asi, rotora ass ir piesaistīta pie lietotāja iekārtas, turklāt rotors ir precīzi ielāgots cilindriskā apvalkā (15), kuram ir divas atveres (151A, 152A), kas aprīkotas attiecīgi ar konverģējošu ieejas kanālu (153A) un diverģējošu izejas kanālu (154A), turklāt apvalku (15) pret vēja virzienu jutīgi līdzekļi griež ap tā asi tādā veidā, ka konverģējošais ieejas kanāls (153A) vienmēr ir pavērsts pret vēju,

kas raksturīga ar to, ka izvirzījums pie ieejas atveres (151A) diametra ir lielāks par cilindriskā apvalka (15) rādiusu, konverģējošais kanāls (153A) atrodas starp divām konverģējošām sienām (153B, 153C), kuras novietotas apvalka (15) ass pretējās pusēs un starp kurām ir 30 līdz 45° leņķis, viena (153C) no minētajām sānu sienām (153B, 153C) ir būtībā tangenciāla pret apvalku (15) un konverģējošā kanāla (153A) konverģējošās sienas (153B, 153C) uz pusēm daļošā plakne atrodas starp apvalka (15) asi un sienu (153C), kas ir tangenciāla pret apvalku (15).

2. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka konverģējošā siena (153C), kas tangenciāla pret cilindrisko apvalku (15), ir nošķībta pret vēja virzienu leņķī  $\alpha$  ar lielumu no 7 līdz 13°, vēlams, 10,5°.

3. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka attālums starp konverģējošā kanāla (153A) ieejas atveri (151A) un rotora asi ir no 1,5 līdz 1,75 reizēm lielāks par apvalka (15) diametru.

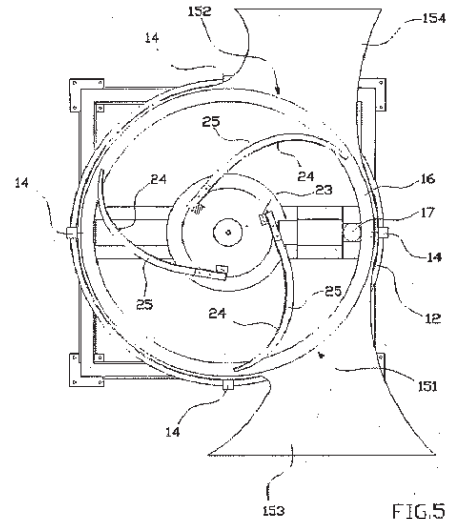
4. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka izejas atveres (152A) diverģējošais kanāls (154A) atrodas starp divām diverģējošām sienām, starp kurām ir no 11 līdz 15° leņķis.

5. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka diverģējošās sienas ir novietotas simetriski attiecībā pret rotora asi, turklāt katra no tām ir būtībā tangenciāla pret apvalku (15) un leņķis starp tām ir no 11 līdz 15°, vēlams, 13°.

6. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka attālums starp diverģējošā kanāla (154A) izejas atveri (152A) un apvalka asi ir no 1,0 līdz 1,3 reizes lielāks par apvalka (15) diametru.

7. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka pret vēja virzienu jutīgais līdzeklis ir ap vertikālo asi brīvi rotējošs plakans spārns (27), kas cieši iestiprināts apvalkā (15).

8. Vēja turbīnas iekārta atbilstoši 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka plakanais spārns (27) ir savienots ar kodētāja (29) kustīgo daļu, un tā otrā daļa ir savienota ar korpusu (15), turklāt kodētājs vada elektromotoru (18), kurš veic apvalka (15) griešanu.



- |   |                         |
|---|-------------------------|
| (51) <b>B60S 9/08</b> <sup>(200601)</sup>   | (11) <b>2462011</b>     |
| (21) 10737029.8   | (22) 22.07.2010         |
| (43) 13.06.2012   |                         |
| (45) 29.05.2013   |                         |
| (31) RE20090082   | (32) 04.08.2009 (33) IT |
| (86) PCT/EP2010/060667  | 22.07.2010              |
| (87) WO2011/015467  | 10.02.2011              |
| (73) Simol S.P.A., Via Fiocchetti 14, 42045 Luzzara (Reggio Emilia), IT                                       |                         |
| (72) RIGHETTI, Valter, IT   |                         |
| (74) Corradini, Cesare, et al, Ing. C. Corradini & C. S.r.l., Via Dante Alighieri, 4, 42121 Reggio Emilia, IT |                         |
| Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV  |                         |

(54) **ATBALSTA MEHĀNISMS  
LANDING GEAR**

(57) 1. Izstiepjama atbalsta kāja, kas satur vismaz divus turp un atpakaļ bīdāmus posmus (20, 21), regulēšanas skrūvi (5), kas aksiāli iestiprināta no posmiem (20, 21) pirmajā posmā (20), ar vītņi aprīkotu spirāli (4), kas aksiāli iestiprināta no posmiem (20, 21) otrajā posmā (21) un ir uzskrūvēta uz regulēšanas skrūves (5), un pagriežamu piedziņas vārpstu (8), kas ar mehāniska maināma pārvada (70, 71, 80, 81, 86) palīdzību savienota ar regulēšanas skrūvi (5) un ir paredzēta pagriešanai, lai panāktu regulēšanas skrūves (5) griešanos, turklāt mehāniskais maināmais pārvads (70, 71, 80, 81, 86) tālāk satur: divus pirmos zobratu (70, 71), kas ir koaksiāli ar regulēšanas skrūvi (5) un griešanās ziņā cieši ar to saistīti; divus otru zobratu (80, 81), kas ir koaksiāli ar griešanās ziņā brīvi uzmontēti uz piedziņas vārpstas (8), kursoru (86), kurš griešanās ziņā ir cieši saistīts ar piedziņas vārpstas (8) posmu, kas atrodas starp otrajiem zobratiem (80, 81), un ir pārvietojams piedziņas vārpstas (8) ass virzienā starp pirmo saķeršanās pozīciju un otro saķeršanās pozīciju, kurās piedziņas vārpsta (8) griešanās ziņā ir cieši saistīta atbilstoši ar vienu (80) un ar otru (81) no otrajiem zobratiem; kas raksturīga ar to, ka katrs no otrajiem zobratiem (80, 81) tieši saķeras ar attiecīgo zobratu no pirmajiem zobratiem (70, 71) tā, lai realizētu divus pārvadus ar dažādām pārnēsumu attiecībām.

2. Atbalsta kāja atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka tā satur tieši vienu vienīgu rotējošu vārpstu, kas kinemātiskā mehānismā ir savienota ar regulēšanas skrūvi (5), turklāt rotējošā vārpsta ir piedziņas vārpsta (8).

3. Atbalsta kāja atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka kursors (86) ir aksiāli bloķēts uz piedziņas vārpstas (8), kura ir pārvietojama savas ass virzienā tā, lai kursors (86) pārvietotos starp saķeršanās pozīcijām.

4. Atbalsta kāja atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka kursoram (86) ir pretējās sānu malas, no kurām katrā ir ierīkots vismaz viens frontāls zobs (87), kas paredzēts, lai sasaistītos ar vismaz tam pretī esošā otrā zobrata (80, 81) frontālo zobu (85) nolūkā realizēt saķeršanos.

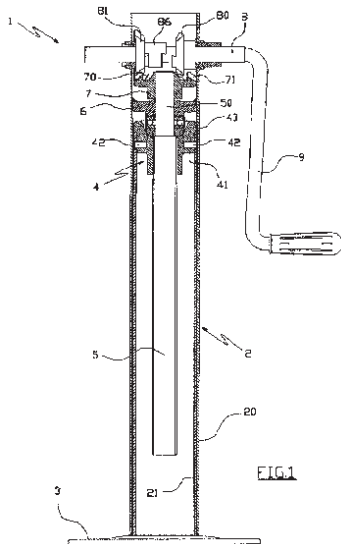
5. Atbalsta kāja atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka pirmie zobrati (70, 71) ir izgatavoti kā viengabala detaļa (7) vai kā divas atsevišķas detaļas.

6. Atbalsta kāja atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka tā satur rokturi (9), kas paredzēts manuālai darbināšanai, lai grieztu piedziņas vārpstu (8).

7. Atbalsta kāja atbilstoši 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka rokturis (9) ir izveidots no viena gabala ar piedziņas vārpstu (8).

8. Atbalsta kāja atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka piedziņas vārpsta (8) var tikt pievienota pie motora, lai realizētu piedziņas vārpstas (8) griešanu.

9. Atbalsta kāja atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka kursors (86) ir saistīts ar automātiskiem līdzekļiem kursora pārvietošanai starp saķeršanās pozīcijām.



- (51) **F03D 5/00**<sup>(200601)</sup> (11) **2463516**
- F03D 5/06**<sup>(200601)</sup>
- B63H 9/00**<sup>(200601)</sup>
- (21) 11009044.6 (22) 15.11.2011
- (43) 13.06.2012
- (45) 31.07.2013
- (31) TO20100980 (32) 09.12.2010 (33) IT
- (73) Kite Gen Research S.R.L., Via XXV Aprile 8, 10023 Chieri (TO), IT
- (72) IPPOLITO, Massimo, IT
- (74) Garavelli, Paolo, A.BRE.MAR. S.R.L., Via Servais 27, 10146 Torino, IT
- Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV
- (54) **VĒJA IEKĀRTA ENERĢIJAS PĀRVĒRŠANAI AR JAUDAS PIEVADES SPĀRNA AERODINAMISKIEM PROFILIEM**
- AEOLIAN SYSTEM FOR CONVERTING ENERGY THROUGH POWER WING AIRFOILS**

(57) 1. Vēja iekārta enerģijas pārvēršanai, kas satur:

- vismaz vienu jaudas pievades spārna aerodinamisku profilu, kas var tikt vadīts no zemes un atrodas vismaz vienā vēja plūsmā;
- bāzes platformu (1), kas savienota ar minēto jaudas pievades spārna aerodinamisko profilu ar divām trosēm (2), minētā bāzes platforma (1) ir pielāgota tam, lai vadītu minēto pievades spārna aerodinamisko profilu un pārvērstu minētās vēja plūsmas vēja enerģiju elektriskajā vai mehāniskajā enerģijā, minētās divas troses (2) ir pielāgotas tam, lai pārnestu spēkus no minētā jaudas pievades spārna aerodinamiskā profila un uz to, kā arī lai tās izmantotu gan minētā jaudas pievades spārna aerodinamiskā profila lidojuma trajektorijas vadībai, gan enerģijas pārvešanai;
- pārvietošanas sistēmu, kas pielāgota tam, lai novadītu katru no minētajām trosēm (2) minētā jaudas pievades spārna aerodinamiskā profila virzienā, kas satur pirmo bloku pāri (7a), kas uzmontēts uz minēto trošu (2) vadības moduļu (6) slīdņiem (6a),

otro bloku pāri (7b), kas izvietots aiz minēto trošu (2) minētajiem vadības moduļiem (6) un pielāgots tam, lai noturētu horizontālā stāvoklī minēto trošu (2) posmus, kas atrodas starp minētajiem otrajiem blokiem (7b) un minētajiem pirmajiem blokiem (7a), kas uzmontēti uz minēto vadības moduļu (6) minētajiem slīdņiem (6a), trešo bloku pāri (7c), kas pielāgots tam, lai pārvietotu minētās troses (2) minētā jaudas pievades spārna aerodinamiskā profila virzienā, ceturto bloku pāri (7d), kas pielāgots tam, lai pārvietotu minētās troses (2), kas nāk no minētā otrā bloku pāra (7b), minētā trešā bloku pāra (7c) virzienā,

kas raksturīga ar to, ka minētā pārvietošanas sistēma satur režģveida nesošu konstrukciju (9), kas sastāv no tenzometriem (17), kas pēc būtības sakārtoti gar piramīdas šķautnēm, kurai horizontālajā projekcijā ir trīsstūris un virsotne ir minētā trešā bloku pāra (7c) savienojuma vietā.

2. Vēja iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētā režģveida nesošā konstrukcija (9) sastāv no ārējās šķērssijas (11), ar kuru ir savienots minētais trešais bloku pāris (7c), apakšējās iekšējās šķērssijas (13) un iekšējā statņa (15), katrs minētās apakšējās iekšējās šķērssijas (13) gals un minētā iekšējā statņa (15) augšējais gals ir savienoti ar minētā trešā bloku pāra (7c) minēto savienojuma vietu pēc būtības minētās ārējās šķērssijas (11) centrālajā punktā ar atbilstošu tenzometru (17).

3. Vēja iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētā pārvietošanas sistēma satur vismaz vienu dempfera mehānismu pāri pēkšņu slodzes izmaiņu slāpēšanai, kas ievietota starp minēto pirmo (7a) un minēto otro (7b) bloku pāriem.

4. Vēja iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka katrs no minētajiem dempfera mehānismiem satur vismaz vienu amortizatoru (19), kas novietots uz vienas ass ar minētās troses (2) gareniskās slīdēšanas virzienu starp attiecīgiem vienu no minētajiem pirmajiem (7a) un vienu no otrajiem (7b) blokiem, minētais otrais bloks (7b) ir savienots ar attiecīgā viena no minētajiem amortizatoriem (19) ārējo galu.

5. Vēja iekārta saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētajam amortizatoram (19) ir atspere (21).

6. Vēja iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētā bāzes platforma (1) satur vismaz divas vinčas (3), uz katras no tām tiek satīta vai attīta attiecīgi viena no minētajām trosēm (2), katra no minētajām vinčām (3) ir savienota ar elektrības ģeneratoru/dzinēju (5).

7. Vēja iekārta saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētā vinča (3) ir savienota ar minēto elektrības ģeneratoru/dzinēju (5) caur vismaz vienu to starpā pieslēgtu planetāro reduktoru (4).

8. Vēja iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētie trešie bloki (7c) ir aprīkoti ar rotējošu savienojumu ar minēto bāzes platformu (1), kas izgatavots ar vismaz vienu atspēri (23).

9. Vēja iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētais slīdnis (6a) slīd gar sliedi (6b) paralēli minētās vinčas (3) rotācijas asij.

10. Vēja sistēma saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētā slīdņa (6a) slīdēšana gar minēto sliedi (6b) tiek vadīta ar slīdēšanas mehānismu kopā ar minētās vinčas (3) rotāciju.

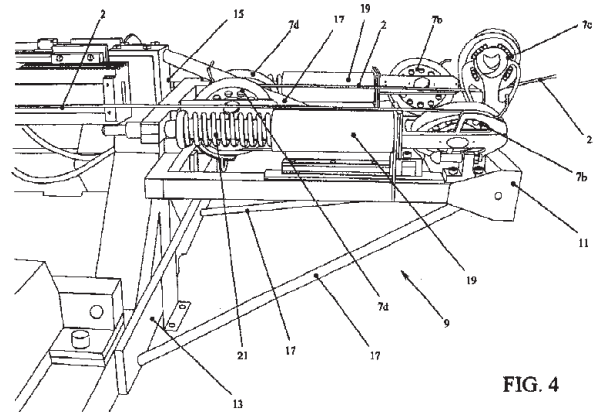


FIG. 4



- (51) **B65B 1/00**<sup>(200601)</sup> (11) **2465780**  
**B65B 65/00**<sup>(200601)</sup>  
**A23N 17/00**<sup>(200601)</sup>  
(21) 10382338.1 (22) 16.12.2010  
(43) 20.06.2012  
(45) 05.06.2013  
(73) Inversiones HIKI6, S.L., C/ Cardenal Belluga, parc. 24/23 Y 24/22, 30169 San Ginés Murcia, ES  
(72) STAMM Kristensen, Henrik, ES  
MARTINEZ Lopez, Maravillas, ES  
(74) TEMINO Cenicerós, Ignacio, Abriol Abogados, Amador de los Rios 1-1°, 28010 Madrid, ES  
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **MOBILA DOZĒŠANAS, MAISIŠANAS UN IEPAKOŠANAS IEKĀRTA**  
**MOBILE DOSING, MIXING AND PACKAGING PLANT**

(57) 1. Mobila iekārta pulverveida, granulētu vai citu ekvivalenta tipa produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai, kas distanciāli ir vadāma no centrālā vadības punkta un ietver pirmo nesošo konstrukciju (1), kura izveidota tā, lai to varētu ievietot standarta jūras transporta kravu konteinerā iekšpusē nedeformējot, kurai ir taisnstūra forma un kura ir paredzēta visu horizontālā plaknē sakārtotu elementu, no kuriem sastāv iekārta, ievietošanai,

kas atšķiras ar to, ka šī iekārta ietver:

(i) dažādo gala produktu sastāvdaļu pirmo saņemšanas un manuālas svēršanas zonu (2), kuras ietilpst tā produkta receptē, kas tiks samaisīts un sabērts maisos, lai pēc tam tos ar smago izejvielu iekrāvēju transportētu uz iekraušanas zonu;

(ii) otro materiāla iekraušanas zonu (3), kura ir konfigurēta tā, lai jau pirmajā zonā nosvērtu pulverveida materiālu ievadītu pilna tilpuma konteinerā (100), turklāt šie produkti tiek ievadīti saskaņā ar recepti, izmantojot sadalītāju, kas novieto no pirmās zonas saņemtos maisus uz iekraušanas lūkas un tad materiālu, izlaižot caur sietu, iepilda iepriekš marķētā konteinerā;

(iii) trešo maisīšanas zonu (4), kurā otrajā zonā uzpildītais konteiners tiek transportēts un novietots zem pulverveida produktu maisītāja, lai veiktu maisīšanu, pie kam maisītājs (41), lai to izdarītu, satver konteineru (100) ar spīlēm un novieto apgāztā vertikālā stāvoklī, to atgriežot sākuma stāvoklī, līdzko produkts ir samaisīts, un šo konteineru atvienojot no minētā maisītāja;

(iv) ceturto maisu uzpildīšanas zonu (5), kas ir paredzēta konteinerā, kas tiek satverts ar spīlēm un nolikts apgāztā vertikālā stāvoklī maisu uzpildīšanas mašīnas virspusē, kam seko maisu uzpildīšana, svēršana un to turpmāka aizšūšana un marķēšana (6);

(v) piekto metālu detektēšanas zonu (7), kas ir paredzēta, lai nepieļautu iespēju, ka maisi varētu saturēt kādas metālu daļiņas, kā arī maisu manuālai novietošanai uz paletēm (8) un konteinerā tīrīšanai (9), lai to varētu atkal izmantot.

2. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka nesošā konstrukcija (1) sastāv no vairākām kvadrātveida caurulēm (11), kas balstās uz vairākām atbalsta ierīcēm (12) ar regulējamu augstumu, vairākiem šarnīriem (13) un kāpnēm (14) ar drošības margām (15).

3. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka saņemšanas un svēršanas zona (2) sastāv no taisnstūra pamatnes (21), dažādiem pacelšanas elementiem, daudziem profiliem (23), drošības margām (24), smago palešu iekrāvēja (21) un svariem (26).

4. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka iekraušanas zona (3) sastāv no iekraušanas lūkas (31), rotējoša vārsta (32) un sieta (33).

5. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka maisīšanas zona (4) ir izveidota no maisītāja (41), kas ir ietverts cilindriskā konteinerā (42), lēna centrālā vibrators (43), sānu pastiprinātāja (44), vairākām apskavām (45), gredzena, kas ietver hermētisku blīvslēgu (46), pacelšanas platformas (47), divām sametinātām pusasīm (48), diviem atbalstiem (49) ar gultņiem (49a) un planetārās ātrumkārbas ar hidraulisko piedziņu (49b).

6. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka maisu uzpildīšanas zona (5) sastāv no apgāzama bunkura (51) un maisu pildītāja (52).

7. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka maisu aizšūšanas un marķēšanas zona (6) sastāv no konsoles (61), kas piestiprināta pie šujmašīnas (62).

8. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka metālu detektēšanas zona (7) sastāv no lentes transportiera (71), kuru darbina reduktordzinējs (72), un metālu detektora (73).

9. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka palešu kraušanas zona (8) sastāv no dažādām paletēm (81) un svariem (82), kurus izmanto palešu svēršanai.

10. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tīrīšanas zona (9) sastāv no vakuumsūcēja (91), mazgātāja ar ūdeni (92) un vairākiem konteineriem (93).

11. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka iekraušanas bunkura (31) sānos ir atvere (311), tekne (312), režģis (313), putekļu nosūcējs (314) un bunkura apakšējā daļa ir pievienota rotējošam vārstam (32).

12. Mobila iekārta pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 4. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka rotējošais vārsts (32) ietver astoņas rotējošas plāksnes (321), kuras darbina ar gliemežpārnesumu aprīkotu reduktormotoru (322).

13. Metode mobilas iekārtas pulverveida produktu dozēšanai, maisīšanai un iepakojšanai saskaņā ar 1. pretenziju vadībai, kas ietver šīs iekārtas distanciālu vadību no centrālā vadības punkta caur komunikāciju tīklu un kas raksturīga ar to, ka ietver: produktu saņemšanas un svēršanas zonas; produkta kraušanu; produkta maisīšanu; produkta iepildīšanu maisos, maisu aizšūšanu, marķēšanu un metālu detektēšanu; kraušanu uz paletēm un tīrīšanu, pie kam šīs stadijas tiek distanciāli vadītas ar PLC palīdzību, kas pievienots pie centrālā servera, kurš dod instrukcijas un komandas gala produkta maisīšanai un sastādīšanai.

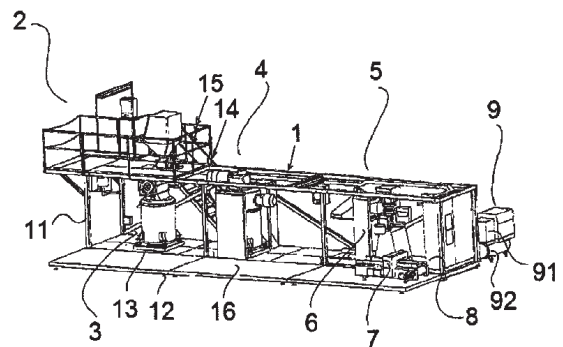


FIG.1

- (51) **C22C 9/02**<sup>(200601)</sup> (11) **2465956**  
**C22C 1/02**<sup>(200601)</sup>  
**C22F 1/08**<sup>(200601)</sup>  
(21) 11009890.2 (22) 15.12.2011  
(43) 20.06.2012  
(45) 03.07.2013  
(31) 102010055055 (32) 17.12.2010 (33) DE  
(73) Wieland-Werke AG, Graf-Arco-Strasse 36, 89079 Ulm, DE  
(72) WEBER, Kai, Dr., DE  
(74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **DAUDZKOMPONENTU VARA UN ALVAS BRONZAS SAKAUSĒJUMS, KAS IR CIETĀ FĀZĒ, TĀ IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS UN IZMANTOŠANA**  
**COPPER-TIN MULTI-ALLOY BRONZE CONTAINING HARD PHASES, METHOD FOR PRODUCING SAME AND USE OF SAME**



(57) 1. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums, kas satur šādus komponentus (masas %):

Sn – no 0,50 līdz 14,0 %,

Zn – no 0,01 līdz 7,0 %,

Al – no 0,05 līdz 2,0 %,

Si – no 0,01 līdz 2,0 %,

Fe – no 0,1 līdz 2,0 %,

vēlams arī ar Mn – no 0,2 līdz 4,0 %,

vēlams arī ar P – ne vairāk par 0,08 %,

vēlams arī ar S – ne vairāk par 0,08 %;

pārējais daudzums ir varš ar neizbēgamiem piemaisījumiem, turklāt alvas saturs šajā sakausējumā ir lielāks nekā cinka.

2. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar:

Sn – no 3,0 līdz 8,0 %,

Zn – no 1,5 līdz 5,5 %,

Al – no 0,05 līdz 1,2 %,

Si – no 0,01 līdz 1,2 %,

Fe – no 0,1 līdz 2,0 %,

vēlams arī ar Mn – no 0,2 līdz 3,0 %,

vēlams arī ar P – ne vairāk par 0,08 %,

vēlams arī ar S – ne vairāk 0,08 %;

pārējais daudzums ir varš ar neizbēgamiem piemaisījumiem.

3. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar:

Sn – no 0,5 līdz 14,0 %,

Zn – no 0,01 līdz 7,0 %,

Mn – no 0,2 līdz 4,0 %,

Fe – no 0,1 līdz 2,0 %,

Al – no 0,05 līdz 2,0 %,

Si – no 0,01 līdz 2,0 %,

vēlams arī ar P – ne vairāk par 0,08 %,

vēlams arī ar S – ne vairāk par 0,08 %;

pārējais daudzums ir varš ar neizbēgamiem piemaisījumiem.

4. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīgs ar:

Sn – no 4,0 līdz 5,0 %,

Zn – no 2,0 līdz 3,0 %,

Mn – no 1,0 līdz 2,5 %,

Fe – no 0,3 līdz 1,5 %,

Al – no 0,3 līdz 1,2 %,

Si – no 0,3 līdz 1,0 %,

vēlams arī ar P – ne vairāk par 0,08 %,

vēlams arī ar S – ne vairāk par 0,08 %;

pārējais ir varš ar neizbēgamiem piemaisījumiem.

5. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka sakausējums nesatur niķeli un svīnu, izņemot jebkādu neizbēgamo piemaisījumu veidā.

6. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka Fe silicīdi, Al saturoši Fe silicīdi, starpmetāliskas fāzes no Fe/Al sistēmas, Fe daļiņas un opcionāli Mn saturoši Fe jaukti silicīdi un Mn/Al saturoši Fe jaukti silicīdi ir iekļauti vara un alvas jauktā kristāla matricē.

7. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tad, kad Sn saturs sakausējumā pieaug, struktūras matricē izkausētā stāvoklī ir atkarīga no kausēšanas un dzesēšanas procesa, kas satur δ-fāzes pieaugošu daļu (Sn ir daudz), bet α-fāzē (Sn ir maz) process ir raksturīgs ar cinku saturošu Cu/Sn jauktu kristālu tipu.

8. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pēc turpmākas apstrādes, kas satur vismaz vienu karstās presēšanas operāciju vai vismaz vienu aukstās presēšanas operāciju, vai vismaz vienu karstās presēšanas operāciju un vienu aukstās presēšanas operāciju un opcionāli satur arī citu atļaidināšanas operāciju, struktūrai δ fāzes saturs ir līdz 60 tilpuma %, silicīdu, Fe/Al fāžu un Fe daļiņu saturs ir līdz 20 tilpuma %, bet pārējais daudzums ir α fāze.

9. Slokšņu, plākšņu, adatu, stieplu, stieņu, cauruļu un veid-  
elementu izgatavošanas paņēmieni no daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. preten-

zijai, izmantojot atdzesētās liešanas paņēmieni vai nepārtrauktas vai daļēji pārtrauktas veidliešanas paņēmieni.

10. Paņēmieni saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izkausētā stāvoklī turpmākā apstrāde ietver vismaz vienu karstās presēšanas operāciju, kas tiek veikta temperatūras intervālā no 600 līdz 880°C.

11. Paņēmieni saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kas raksturīgs ar vismaz vienu atkvēlināšanas apstrādes operāciju, kas tiek veikta temperatūras intervālā no 200 līdz 880°C.

12. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka turpmākā apstrāde izkausētā stāvoklī vai karstā apstrādes stāvoklī, vai atkvēlinātā liešanas stāvoklī, vai atkvēlinātā karstā presēšanas stāvoklī ietver vismaz vienu aukstās presēšanas operāciju.

13. Paņēmieni saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viena atkvēlināšanas apstrādes operācija tiek veikta temperatūras intervālā no 400 līdz 850°C.

14. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka atļaidināšanas/nogulsnešanas atkvēlināšanas operācija tiek veikta temperatūras intervālā no 200 līdz 650°C.

15. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana gludām darba virsmām kompozītmateriālu elementos, slidošiem elementiem iekšdedzes dzinējos, zobratiem, izplūdes gāzu pārstrādes sistēmās, svīru un šarnīrsavienojumu sistēmās, hidrauliskajos mehānismos vai vispārējās mašīnbūves ierīcēs un iekārtās.

16. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana par konstruktīvajiem elementiem elektronikā un elektrotehnikā.

17. Daudzkomponentu vara un alvas bronzas sakausējuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana metāla objektos, kurus lieto jūras ūdenī dzīvojošu organismu selekcijai.

(51) **C07D 223/16**<sup>(200601)</sup>

(11) **2487158**

**C07C 211/00**<sup>(200601)</sup>

(21) 12290050.9

(22) 13.02.2012

(43) 15.08.2012

(45) 20.02.2013

(31) 1100446

(32) 14.02.2011 (33) FR

(73) Les Laboratoires Servier, 35, rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR

(72) PEGLION, Jean-Louis, FR

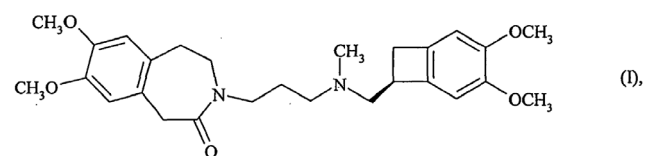
DESSINGES, Aimée, FR

(74) Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

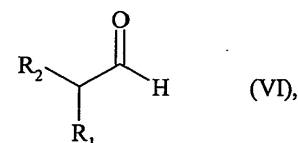
(54) **JAUNS IVABRADĪNA UN TĀ FARMACEITISKI PIENĒMAMU PIEVIENOTĀS SKĀBES SĀĻU SINTĒZES PAŅĒMIENS**

**NEW METHOD FOR SYNTHESISING IVABRADINE AND ITS ADDED SALTS WITH A PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE ACID**

(57) 1. Ivabradīna ar formulu (I):

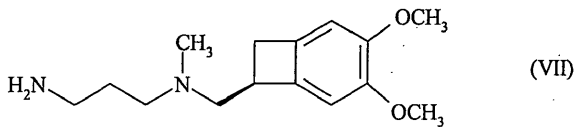


sintēzes paņēmieni raksturīgs ar to, ka savienojumu ar formulu (VI):

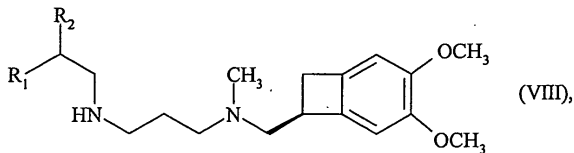


kur grupas R<sub>1</sub> un R<sub>2</sub>, kuras ir vienādas vai dažādas, apzīmē (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupas ar taisnu vai sazarotu virkni, vai kopā ar oglekļa atomu, kuram ir pievienotas šīs grupas, veido 1,3-dioksāna, 1,3-dioksolāna vai 1,3-diosekspāna gredzenu,

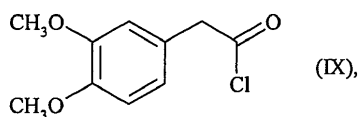
pakļauj reducējošās aminēšanas reakcijai ar savienojumu ar formulu (VII):



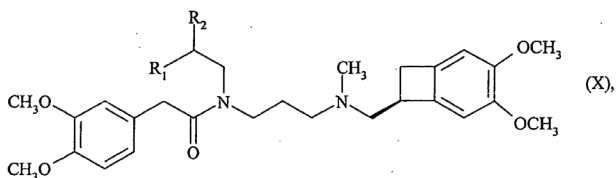
reducētāja klātbūtnē organiskā šķīdinātājā, organisku šķīdinātāju maisījumā vai organiska(-u) šķīdinātāja(-u) un ūdens maisījumā, iegūstot savienojumu ar formulu (VIII):



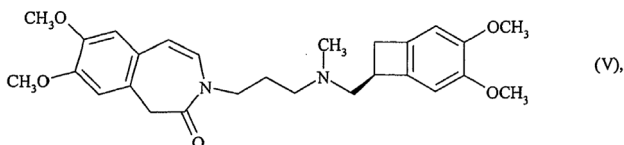
kur grupas R<sub>1</sub> un R<sub>2</sub> ir tādas, kā definēts iepriekš, kuru pakļauj kondensācijas reakcijai ar savienojumu ar formulu (IX):



bāzes klātbūtnē organiskā šķīdinātājā, iegūstot savienojumu ar formulu (X):



kur grupas R<sub>1</sub> un R<sub>2</sub> ir tādas, kā definēts iepriekš, kuru pakļauj ciklizācijas reakcijai skābē vidē, iegūstot savienojumu ar formulu (V):



kuru pakļauj hidrogenēšanas reakcijai, iegūstot ivabradīnu ar formulu (I), kuru, iespējams, var pārvērst par tā farmaceutiski pieņemamiem pievienotās skābes, kas izvēlēta no sāļsskābes, bromūdeņražskābes, sērskābes, fosforskābes, etiķskābes, trifluoretiķskābes, pienskābes, pirovīnogskābes, malonskābes, dzintarskābes, glutārskābes, fumārskābes, vīnskābes, maleīnskābes, citronskābes, askorbīnskābes, skābeņskābes, metānsulfonskābes, benzolsulfonskābes un kamparskābes, sāļiem un to hidrātiem.

2. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju raksturīgs ar to, ka reducētājs, kuru izmanto reducējošās aminēšanas reakcijas veikšanai starp savienojumu ar formulu (VI) un savienojumu ar formulu (VII), ir izvēlēts no nātrija triacetoksiborhidrīda, nātrija ciānborhidrīda un ūdeņraža katalizatora, piemēram, pallādija, platīna, niķeļa, rutēnija, rodija un to savienojumu klātbūtnē, īpaši uz nesēja vai oksīdu veidā.

3. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 2. pretenziju raksturīgs ar to, ka reducētājs, kuru izmanto reducējošās aminēšanas reakcijas veikšanai starp savienojumu ar formulu (VI) un savienojumu ar formulu (VII), ir ūdeņradis pallādija uz ogles klātbūtnē.

4. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 3. pretenziju raksturīgs ar to, ka reducējošās aminēšanas reakciju starp savienojumu ar formulu (VI) un savienojumu ar formulu (VII) veic ar ūdeņradi zem spiediena no 0,5 līdz 1,5 bāriem.

5. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai raksturīgs ar to, ka šķīdinātājs, kuru izmanto reducējošās aminēšanas reakcijas veikšanai starp savienojumu ar formulu (VI) un savienojumu ar formulu (VII), ir izvēlēts no tetrahidrofurāna,

dihlormetāna, 1,2-dihloretāna, acetātiem un spirtiem, vislabāk etanola, metanola vai izopropanola, toluola un ksilola.

6. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 5. pretenziju raksturīgs ar to, ka šķīdinātājs, kuru izmanto reducējošās aminēšanas reakcijas veikšanai starp savienojumu ar formulu (VI) un savienojumu ar formulu (VII), ir etanola un ūdens maisījums.

7. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai raksturīgs ar to, ka reducējošās aminēšanas reakciju starp savienojumu ar formulu (VI) un savienojumu ar formulu (VII) veic pie temperatūras no 0 līdz 40°C.

8. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai raksturīgs ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto reakcijā starp savienojumiem ar formulām (VIII) un (IX), ir izvēlēts no toluola, dihlormetāna, 2-metil-tetrahidrofurāna, hlorbenzola, 1,2-dihloretāna, hloroforma un dioksāna.

9. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 8. pretenziju raksturīgs ar to, ka organiskais šķīdinātājs, kuru izmanto reakcijā starp savienojumiem ar formulām (VIII) un (IX), ir dihlormetāns.

10. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai raksturīgs ar to, ka reakciju starp savienojumiem ar formulām (VIII) un (IX) veic pie temperatūras no 0 līdz 40°C.

11. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai raksturīgs ar to, ka bāze, kuru izmanto reakcijā starp savienojumiem ar formulām (VIII) un (IX), ir izvēlēta no piridīna, 4-dimetilaminopiridīna (DMAP) un trešējā amīna.

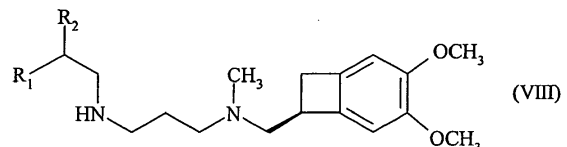
12. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 11. pretenziju raksturīgs ar to, ka bāze, kuru izmanto reakcijā starp savienojumiem ar formulām (VIII) un (IX), ir trietilamīns.

13. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai raksturīgs ar to, ka skābe, kuru izmanto savienojuma ar formulu (X) ciklizācijas veikšanai, lai veidotu savienojumu ar formulu (V), ir izvēlēta no koncentrētas sērskābes, polifosforskābes, koncentrētas sāļsskābes ūdens šķīdumā, koncentrētas sāļsskābes etiķskābes šķīdumā, koncentrētas bromūdeņražskābes etiķskābes šķīdumā un metānsulfonskābes.

14. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 13. pretenziju raksturīgs ar to, ka skābe, kuru izmanto savienojuma ar formulu (X) ciklizācijas veikšanai, lai veidotu savienojumu ar formulu (V), ir koncentrēta sāļsskābe etiķskābes šķīdumā.

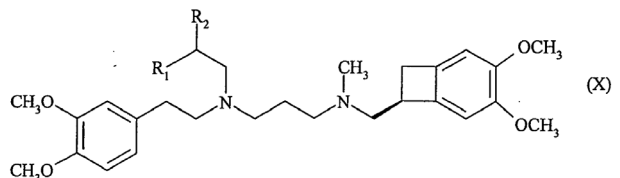
15. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 14. pretenzijai raksturīgs ar to, ka savienojuma ar formulu (X) ciklizāciju, lai veidotu savienojumu ar formulu (V), veic pie temperatūras no 0 līdz 40°C.

16. Savienojums ar formulu (VIII):



kur R<sub>1</sub> un R<sub>2</sub> grupas, kuras ir vienādas vai dažādas, apzīmē (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoksigrupas ar taisnu vai sazarotu virkni vai kopā ar oglekļa atomu, kuram ir pievienotas šīs grupas, veido 1,3-dioksāna, 1,3-dioksolāna vai 1,3-dioksepāna gredzenu.

17. Savienojums ar formulu (X):



kur R<sub>1</sub> un R<sub>2</sub> ir tādi aizvietotāji, kā definēts 16. pretenzijā.

(51) A24D 3/02<sup>(200601)</sup>

A24D 3/04<sup>(200601)</sup>

A24D 3/06<sup>(200601)</sup>

(21) 10790723.0

(43) 03.10.2012

(11) 2503911

(22) 23.11.2010

- (45) 10.07.2013  
 (31) 09252666 (32) 23.11.2009 (33) EP  
 (86) PCT/EP2010/007085 23.11.2010  
 (87) WO2011/060961 26.05.2011  
 (73) Philip Morris Products S.A., Quai Jeanrenaud 3,  
 2000 Neuchâtel, CH  
 (72) BESSO, Clément, CH  
 KUERSTEINER, Charles, CH  
 (74) Millburn, Julie Elizabeth, Reddie & Grose LLP, 16 Theobalds  
 Road, London WC1X 8PL, GB  
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tīpašuma  
 aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV  
 (54) **JAUNS FILTRA SEGMENTS, KAS SATUR SUBSTRĀTU  
 AR DŪMUS MODIFICĒJOŠU PIEDEVU**

**NOVEL FILTER SEGMENT COMPRISING A SUBSTRATE  
 LOADED WITH A SMOKE-MODIFYING AGENT**

(57) 1. Filtra segments (16) izmantošanai smēķēšanas izstrādājuma (10, 20, 20, 40, 50) filtrā (14), kur filtra segments (16) satur nelamināru substrātu (20), kam ir pievienota vismaz viena dūmus modificējoša piedeva, turklāt filtra segmenta (16) caurulītes iekšpusē ievietotais nelaminārais substrāts (20) ir veidots no filtra noslēga ietinamā papīra, kura gaisa caurlaidība ir vismaz 3000 *Coresta* vienības.

2. Filtra segments (16) saskaņā ar 1. pretenziju, kur nelaminārais substrāts (20) ir veidots no filtra noslēga ietinamā papīra, kura gaisa caurlaidība ir apmēram no 5000 *Coresta* vienībām līdz apmēram 30000 *Coresta* vienībām.

3. Filtra segments (16) saskaņā ar 2. pretenziju, kur nelaminārais substrāts (20) ir veidots no filtra noslēga ietinamā papīra, kura gaisa caurlaidība ir apmēram no 6000 *Coresta* vienībām līdz apmēram 24000 *Coresta* vienībām.

4. Filtra segments (16) saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kur nelaminārais substrāts (20) ir veidots no filtra noslēga ietinamā papīra, kura virsmas blīvums ir apmēram no 10 g/m<sup>2</sup> līdz apmēram 80 g/m<sup>2</sup>.

5. Filtra segments (16) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur nelaminārajam substrātam (20) ir pievienots mentols.

6. Filtra segments (16) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā nelaminārais substrāts (20) ir iekrāsots.

7. Filtra segments (16) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur nelaminārais substrāts (20) ir pavediens, kas veidots no vienas vai vairākām filtra noslēga ietinamā papīra sloksnēm.

8. Filtra segments (16) saskaņā ar 7. pretenziju, kur nelaminārais substrāts (20) diametrs ir apmēram no 0,5 mm līdz apmēram 3 mm.

9. Filtra segments (16) saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kur nelaminārais substrāts (20) filtra segmenta (16) caurulītes iekšpusē ir vērsts tā ass virzienā.

10. Spole ar pavedienu izmantošanai filtra segmenta (16), kas atbilst jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, ražošanā, kur pavediens ir veidots no filtra noslēga ietinamā papīra, kura gaisa caurlaidība ir vismaz apmēram 3000 *Coresta* vienības un kura diametrs ir apmēram no 0,5 mm līdz apmēram 3 mm.

11. Smēķēšanas izstrādājuma (10, 20, 30, 40, 50) filtrs (14), kas satur filtra segmentu (16) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai.

12. Smēķēšanas izstrādājuma (30, 50) daudzkomponentu filtrs (14), kas satur filtra segmentu (16) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai tā iemuša galā.

13. Smēķēšanas izstrādājums (10, 20, 30, 40, 50), kas satur filtru (14) saskaņā ar 11. vai 12. pretenziju.

14. Filtra noslēga ietinamā papīra ar gaisa caurlaidību vismaz apmēram 3000 *Coresta* vienības kā nelamināra substrāta (20) priekš vismaz vienas dūmus modificējošas piedevas filtra segmenta (16) iekšpusē izmantošana par smēķēšanas izstrādājuma (10, 20, 20, 40, 50) filtru (14).

15. Filtru (14) saturoša smēķēšanas izstrādājuma (10, 20, 30, 40, 50) radīto dūmu modificēšanas paņēmieni, kas satur tā nodrošināšanu ar nelamināru substrātu (20), kurš veidots no filtra noslēga ietinamā papīra, kura gaisa caurlaidība ir vismaz 3000 *Coresta* vienības, kur nelaminārajā substrātā (20), kas atrodas filtra (14) segmenta (16) iekšpusē, tiek pievienota vismaz viena dūmus modificējoša piedeva.

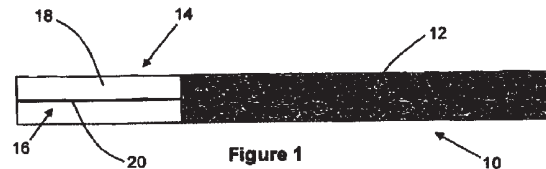


Figure 1

## Papildu aizsardzības sertifikāti

(Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 469/2009 (kodificētā versija) (06.05.2009) par papildu aizsardzības sertifikātu zālēm 11. panta 1. 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) <b>C/LV2013/0008/z</b>   | (22) <b>09.04.2013</b> |
| (54) C-arilglikozīdu SGLT2 inhibitori un metode   |                        |
| (73) BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY, Route 206 and Province Line Road, P.O. Box 4000, Princeton NJ 08543-4000, US |                        |
| (74) Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV   |                        |
| (92) EU/1/12/795/001-010,   | 12.11.2012             |
| (93) EU/1/12/795/001-010,   | 12.11.2012             |
| (94) 12.11.2027   |                        |
| (95) Dapaglifozīns, tā farmaceutiski pieņemams sāls vai stereoizomērs (FORXIGA)                                 |                        |
| (96) 03736643.2,  | 15.05.2003             |
| (97) EP1506211,   | 07.02.2007             |
-



(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
<b>Izgudrojumu pieteikumu publikācijas</b>			LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE			Š		
				P-13-107	A01F29/04	ŠTERNA, Vita	P-12-86	A23K1/14
				-	A01F29/06	-	-	A23K1/165
				-	A01F29/08			
				P-13-108	F26B17/08			
			LATVIJAS UNIVERSITĀTE			T		
<b>A</b>				P-13-144	B01J20/04	TEIVĀNS, Pēteris	P-13-162	A23L1/24
ABRAMENKOVŠ, Andris	P-13-144	B01J20/04	-	-	B01J20/24	TĒRAUDS, Jānis	P-12-83	C02F9/00
-	-	B01J20/24	-	-	C02F1/28	-	-	C02F3/02
-	-	C02F1/28	-	-	C02F9/00	TURKS, Māris	P-13-136	C07D239/72
ADZHIENKO, Vladislav	P-12-83	C02F9/00	-	P-13-177	G01J3/28	-	-	C07D249/08
-	-	C02F3/02	-	-	G01J3/02	-	P-13-139	C07C211/15
ANCĀNS, Dainis	P-13-107	A01F29/04	LATVIJAS UNIVERSITĀTES AĢENTŪRA LATVIJAS UNIVERSITĀTES MATEMĀTIKAS UN INFORMĀTIKAS INSTITŪTS			-	-	C07D203/00
-	-	A01F29/06						
-	-	A01F29/08						
			LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS 'SILAVA'			V		
<b>B</b>				P-13-106	A01G23/06	VALDOVSKA, Anda	P-12-86	A23K1/14
BĀRZDIŅŠ, Guntis	P-12-89	H04L29/02	-	P-13-113	A01G23/06	-	-	A23K1/165
BĒRZIŅA, Egita	P-13-162	A23L1/24	-	-	A01B13/00	-	P-12-87	A23K1/14
BGS, SIA	P-12-83	C02F9/00	-	-	A01B49/04	-	-	A23K1/165
-	-	C02F3/02	-	-	A01G23/06	VĪTIŅA, Īra-Irēna	P-12-87	A23K1/14
BIZDĒNA, Ērika	P-13-136	C07D239/72	-	-	A01B13/00	-	-	A23K1/165
-	-	C07D249/08	-	-	A01B49/04			
BULANOVŠ, Andrejs	P-12-93	C09K11/06	LAZDĀNS, Valentīns	P-13-113	A01G23/06	Z		
-	-	C08G61/12	-	-	A01B13/00	ZIMELIS, Agris	P-13-113	A01G23/06
			LAZDIŅA, Dagnija			-	-	A01B13/00
<b>D</b>				P-13-106	A01G23/06	-	-	A01B49/04
DAUGAVPILS UNIVERSITĀTE	P-12-93	C09K11/06	-	P-13-113	A01G23/06	ZĪTARE, Inese	P-12-86	A23K1/14
-	-	C08G61/12	-	-	A01B13/00	-	-	A23K1/165
DMITRIJENKO, Vjačeslavs	P-13-113	A01G23/06	LAZDIŅŠ, Andis	P-13-106	A01G23/06	-	P-12-87	A23K1/14
-	-	A01B13/00	-	P-13-113	A01G23/06	-	-	A23K1/165
-	-	A01B49/04	-	-	A01B13/00	-	-	A23K1/14
			LĀCE, Lelde			-	-	A23K1/165
<b>G</b>			LUGIŅINA, Jevgeņija					
GUSAREVŠ, Igors	P-13-113	A01G23/06	LUJĀNE, Biruta	P-12-86	A23K1/14			
-	-	A01B13/00	-	-	A23K1/165			
-	-	A01B49/04	<b>M</b>					
			MACKEVIČA, Jevgeņija					
<b>H</b>				P-13-139	C07C211/15			
HEIDENS, Adrians	P-12-89	H04L29/02	-	-	C07D203/00			
			<b>N</b>					
<b>I</b>			NOVOSJOLOVA, Irina					
IVANOVA, Irēna	P-12-93	C09K11/06	-	P-13-136	C07D239/72			
-	-	C08G61/12	-	-	C07D249/08			
			NULLE, Imants					
<b>J</b>				P-13-107	A01F29/04			
JANSONŠ, Imants	P-12-86	A23K1/14	-	-	A01F29/06			
-	-	A23K1/165	-	-	A01F29/08			
JEMEĻJANOVŠ, Aleksandrs	P-12-86	A23K1/14	-	P-13-108	F26B17/08			
-	-	A23K1/165	<b>O</b>					
-	P-12-87	A23K1/14	OZOLLAPIŅŠ, Mārtiņš					
-	-	A23K1/165						
			<b>P</b>					
<b>K</b>			PĒRKONE, Smaida					
KAĶĪTIS, Aivars	P-13-107	A01F29/04	-	P-12-102	A23L1/08			
-	-	A01F29/06	-	-	A61K36/18			
-	-	A01F29/08	-	P-12-102	A23L1/08			
-	P-13-108	F26B17/08	-	-	A61K36/18			
KALNIŅA, Agnese	P-13-136	C07D239/72	PODNIKŠ, Kārlis	P-13-137	G06Q10/06			
-	-	C07D249/08	<b>R</b>					
KIRILOVA, Jelena	P-12-93	C09K11/06	RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE					
-	-	C08G61/12						
KIRILOVŠ, Georgijs	P-12-93	C09K11/06	-	P-13-136	C07D239/72			
-	-	C08G61/12	-	-	C07D249/08			
KĻAVIŅŠ, Māris	P-13-144	B01J20/04	-	P-13-139	C07C211/15			
-	-	B01J20/24	-	-	C07D203/00			
-	-	C02F1/28	RJABOVŠ, Vitālijs	P-13-139	C07C211/15			
KONOŠONOKA, Ināra	P-12-87	A23K1/14	-	-	C07D203/00			
-	-	A23K1/165	<b>S</b>					
-	P-12-87	A23K1/14	SIGRA, Biotehnoloģijas un veterinārmedicīnas zinātniskais institūts, LLU aģentūra					
-	-	A23K1/165						
KURMIS, Ervīns	P-13-113	A01G23/06	-	P-12-86	A23K1/14			
-	-	A01B13/00	-	-	A23K1/165			
-	-	A01B49/04	-	P-12-87	A23K1/14			
			SPILVA, SIA					
<b>L</b>			SPĪGULIS, Jānis					
LADNER, Igor	P-12-83	C02F9/00	-	P-13-162	A23L1/24			
-	-	C02F3/02	-	P-13-177	G01J3/28			
			-	-	G01J3/02			



(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase	(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase
<b>Izgdrojumu pieteikumu publikācijas</b>			<b>Izgdrojumu patentu publikācijas</b>		
P-12-83	14777	C02F9/00	P-11-45	14590	A61G5/00
-		C02F3/02	P-12-61	14739	B04B7/00
P-12-86	14772	A23K1/14	-		B04B13/00
-		A23K1/165	-		B01L11/00
P-12-87	14773	A23K1/14	P-12-63	14745	F23G7/10
-		A23K1/165	-		F23K3/00
P-12-89	14784	H04L29/02	-		F23M13/00
P-12-93	14780	C09K11/06	P-13-52	14694	A61B17/60
-		C08G61/12	P-13-55	14703	G01N33/53
P-12-102	14774	A23L1/08	P-13-86	14737	A61K31/501
-		A61K36/18	-		A61P9/00
P-13-106	14771	A01G23/06	-		C07D403/04
P-13-107	14770	A01F29/04	P-13-104	14742	C13K1/02
-		A01F29/06	-		D21B1/14
-		A01F29/08	P-13-122	14761	F02B23/00
P-13-108	14781	F26B17/08	-		F02B71/04
P-13-113	14769	A01B49/04	P-13-145	14767	H03K3/335
-		A01G23/06			
-		A01B13/00			
P-13-136	14779	C07D239/72			
-		C07D249/08			
P-13-137	14783	G06Q10/06			
P-13-139	14778	C07C211/15			
-		C07D203/00			
P-13-144	14776	B01J20/04			
-		B01J20/24			
-		C02F1/28			
P-13-162	14775	A23L1/24			
P-13-177	14782	G01J3/28			
-		G01J3/02			

## Reģistrētās preču zīmes

Publikācijas par reģistrētajām preču zīmēm sakārtotas to reģistrācijas numuru secībā. Katra publikācija satur visus datus, kas reģistrācijas brīdī iekļauti Valsts 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 nodevu, triju mēnešu laikā no šīs dienas var iesniegt Patentu valdes Apelācijas padomē rakstveida iebildumu 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.

### Starptautiski pieņemtie kodi (INID kodi), kas izmantoti preču zīmju datu identificēšanai:

- |   |  |
|---|--|
| <p><b>(111)</b> Reģistrācijas numurs<br/>Registration number</p> <p><b>(116)</b> Reģistrācijas atjaunojuma numurs, ja tas atšķiras no sākotnējā reģistrācijas numura<br/>Renewal number where different from initial registration number</p> <p><b>(141)</b> Reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums<br/>Date of the termination of the registration</p> <p><b>(151)</b> Reģistrācijas datums<br/>Registration date</p> <p><b>(210)</b> Pieteikuma numurs<br/>Application number</p> <p><b>(220)</b> Pieteikuma datums<br/>Filing date of the application</p> <p><b>(230)</b> Izstādes prioritātes dati<br/>Exhibition priority data</p> <p><b>(300)</b> Konvencijas prioritātes dati:<br/>pieteikuma numurs, pieteikuma datums, valsts kods<br/>Convention priority data:<br/>application number, filing date, code of country</p> <p><b>(350)</b> Senioritātes dati (attiecībā uz Latviju):<br/>reģistrācijas numurs, reģistrācijas datums<br/>Seniority data (in relation to Latvia):<br/>registration number, registration date</p> <p><b>(399)</b> Ziņas par pārreģistrēto dokumentu, kas bija spēkā PSRS (pārreģistrētajām zīmēm)<br/>Data relating to the registration previously in force in SU (for re-registered marks)</p> <p><b>(511)</b> Preču un pakalpojumu starptautiskās klasifikācijas (Nicas klasifikācijas) indeksi; preču un/vai pakalpojumu saraksts<br/>Indication of the International Classification of Goods and Services (Nice Classification); list of goods and/or services</p> <p><b>(526)</b> Zīmes elementi, kas izslēgti no aizsardzības (disklamācija)<br/>Elements excluded from protection (disclaimer)</p> <p><b>(531)</b> Zīmju figurālo elementu starptautiskās klasifikācijas (Vīnes klasifikācijas - CFE) indeksi<br/>Indication of the International Classification of the Figurative Elements of Marks (Vienna Classification - CFE)</p> <p><b>(540)</b> Zīmes attēls<br/>Reproduction of the mark</p> <p><b>(551)</b> Norāde, ka šī zīme ir kolektīvā preču zīme<br/>Indication that the mark is a collective mark</p> <p><b>(554)</b> Telpiska zīme<br/>Three-dimensional mark</p> <p><b>(555)</b> Hologrāfiska zīme<br/>Hologram mark</p> <p><b>(556)</b> Skaņu zīme, tās raksturojums<br/>Sound mark, including characteristics</p> <p><b>(571)</b> Zīmes apraksts<br/>Description of mark</p> | <p><b>(580)</b> Reģistrācijas grozījumu ieraksta datums (īpašumtiesību pāreja, grozījumi vārdos, nosaukumos vai adresēs, reģistrācijas darbības pārtraukšana u.tml.)<br/>Date of recording of a transaction in respect of the registration (change in ownership, change in name or address, termination of protection, etc.)</p> <p><b>(591)</b> Norāde par zīmes aizsardzību krāsās<br/>Indication concerning colours claimed</p> <p><b>(600)</b> 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 Kopienas preču zīmes pieteikumu<br/>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 Community Trade Mark application</p> <p><b>(641)</b> Sākotnējā pieteikuma dati (sadalīta pieteikuma gadījumā)<br/>Initial application data (in case of divided application)</p> <p><b>(646)</b> Sākotnējās reģistrācijas dati (sadalītas reģistrācijas gadījumā)<br/>Initial registration data (in case of divided registration)</p> <p><b>(732)</b> Zīmes īpašnieks, adrese, valsts kods<br/>Name and address of the owner of the mark, code of country</p> <p><b>(740)</b> Pārstāvis (patentpilnvarotais, preču zīmju aģents), adrese<br/>Representative (patent attorney, trademark agent), address</p> <p><b>(791)</b> Licenciāts, adrese, valsts kods<br/>Name and address of the licensee, code of country</p> <p><b>(881)</b> Nacionālās reģistrācijas, kas aizstāta ar starptautisko reģistrāciju, numurs un datums<br/>Number and date of the national registration replaced by an international registration</p> <p><b>(885)</b> Starptautiskās reģistrācijas, kas pārveidota par nacionālo reģistrāciju, numurs un datums<br/>Number and date of the international registration transformed into a national registration</p> |
|---|--|

(111) **Reģ. Nr.** M 66 868 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-12-1544 (220) **Pieteik.dat.** 27.12.2012  
(531) **CFE ind.** 26.1.2; 26.1.3; 26.1.12





- (732) **Īpašn.** Tatjana GUĻKO; Kūdras iela 14-17, Olaine, Olaines nov. LV-2114, LV
- (740) **Pārstāvis** Jevgeņija GAINUTDINOVA; Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013
- (511) **35** metālkonstrukciju un pārvietojamu metāla būvju mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi; galantērijas izstrādājumu, aizkaru un suvenīru mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi
- 37** būvniecība; būvniecības iekārtu iznomāšana; cauruļvadu izbūve un apkope; būvdarbi; metālkonstrukciju izgatavošana un montāža; rūpniecisko ražotņu un citu veidu būvju celtniecība un montāža; naftas produktu, ķīmisko vielu, kā arī pārtikas produktu un citu veidu produktu glabāšanas rezervuāru būvniecība un montāža; dažāda diametra un spiediena tehnoloģisko cauruļvadu montāža; ūdensvadu, kanalizācijas tīklu, siltumtīklu un gāzes vadu montāža; individuālo siltuma mezglu izveidošana, rekonstrukcija, montāža un apkope; ēku, iekārtu un tehnoloģisko cauruļvadu siltumizolācijas darbi; pretkorozijas darbi; smilšstrūklas apstrāde
- 39** transportlīdzekļu iznomāšana; automašīnu iznomāšana; kravas automašīnu iznomāšana; autopārvadājumi; kravu transportēšanas starpniecības pakalpojumi; preču pārvadāšanas pakalpojumi; starpniecības pakalpojumi transporta jomā

(111) **Reģ. Nr.** M 66 869 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-71 (220) **Pieteik.dat.** 25.01.2013  
 (531) **CFE ind.** 3.1.8; 3.1.24; 3.1.28; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** oranžs, sarkans, pelēks, melns
- (732) **Īpašn.** BALTO LINK, UADBB; Kēstučio g. 59, LT-08124 Vilnius, LT
- (740) **Pārstāvis** Jevgeņija GAINUTDINOVA; Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013
- (511) **36** apdrošināšanas pakalpojumi, informācija un konsultācijas saistībā ar apdrošināšanu; aktuāru pakalpojumi; apdrošināšanas brokeru pakalpojumi; finansiālā novērtēšana (apdrošināšanā)

(111) **Reģ. Nr.** M 66 870 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-189 (220) **Pieteik.dat.** 20.03.2013  
 (531) **CFE ind.** 27.7.1; 27.7.17



- (732) **Īpašn.** Haralds ŠLĒGELMILHS; "Lielozoli", Augšciems, Ropažu nov. LV-2135, LV
- (511) **25** apģērbi, apavi, galvassegas
- 41** sporta, izglītības un kultūras pasākumi un sacensības

(111) **Reģ. Nr.** M 66 871 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-298 (220) **Pieteik.dat.** 12.03.2013

## NOTHING WILL EVER FEEL THE SAME

- (732) **Īpašn.** MOBIUS, SIA; Elizabetes iela 69-10, Rīga LV-1050, LV
- (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010

- (511) **9** mobilie telefoni, mobilo telefonu daļas un piederumi, uzlādes ierīces

(111) **Reģ. Nr.** M 66 872 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-387 (220) **Pieteik.dat.** 02.04.2013

## ALCONET

- (732) **Īpašn.** ALCONET, SIA; Pļavniekkalna iela 5, Katlakalns, Ķekavas pag., Ķekavas nov. LV-2111, LV
- (740) **Pārstāvis** Ilmārs SVARINSKIS; Dainas iela 6-5, Rīga LV-1001
- (511) **35** pārtikas preču, alkoholisko dzērienu, tabakas izstrādājumu, mājsaimniecības preču mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 873 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-474 (220) **Pieteik.dat.** 03.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.7; 26.4.22



- (732) **Īpašn.** LIGMAN LIGHTING COMPANY LIMITED; 2912 Ladprao Road, Klongjun, Bangkok, TH
- (740) **Pārstāvis** Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra 'INTELS LATVIJA'; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
- (511) **11** gaismekļi; apgaismošanas ierīču piederumi, apgaismošanas ķermeņi, apgaismošanas ierīces, apgaismošanas laternas

(111) **Reģ. Nr.** M 66 874 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-492 (220) **Pieteik.dat.** 29.08.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.4; 26.4.22; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, balts
- (732) **Īpašn.** JUTRZENKA COLIAN SP. Z O.O.; ul. Zdrojowa 1, 62-860 Opatówek, PL
- (740) **Pārstāvis** Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA; p/k 98, Rīga LV-1050
- (511) **29** dārzeņi (konservēti, zāvēti vai vārīti); augļi (konservēti, žāvēti vai vārīti); sēnes (konservētas, žāvētas vai vārītas); gaļa, mājputni, medījumi, zivis un jūras produkti, visi šie produkti arī ekstraktu formā; želejas, pastas, konservi, saldēti vai kaltēti gatavi ēdieni, ievārījumi, olas, produkti uz sojas bāzes, pārtikas eļļas un tauki; proteīna produkti cilvēka pārtikai, pienu nesaturošas piedevas, desas, gaļas kulinārija, zemesriekstu sviests, zupu koncentrāti, buljons, buljona kubiki, konservētas pupiņas, pārtikas želatīns, rozīnes; kokosrieksti, rieksti
- 30** kafija, kafijas ekstrakti, uz kafijas bāzes pagatavoti produkti un dzērieni; ledus kafija; kafijas aizstājēji; kafijas aizstājēju ekstrakti; produkti un dzērieni, kas pagatavoti uz kafijas aizstājēju bāzes; cigoriņi; tēja, tējas ekstrakti, uz tējas bāzes pagatavoti produkti un dzērieni; ledus tēja; uz iesala bāzes pagatavoti produkti; kakao un uz kakao bāzes pagatavoti produkti un dzērieni; šokolāde, šokolādes izstrādājumi un dzērieni; konfektes, saldumi, cukurs; košļājamā gumija; dabiskie saldinātāji; maizes produkti, maize; raugs; konditorejas izstrādājumi, cepumi, kūkas, vafeles, īrisi, deserti, pudiņi; saldējums; pārtikas ledus; šerbets; saldēti saldumi, saldētas

kūkas, saldēti deserti, saldēti jogurti; saistvielas saldējuma un/vai sasaldētas sulas un/vai šerbeta, un/vai saldētu saldumu, un/vai saldētu kūku, un/vai mīkstā saldējuma, un/vai saldēta deserta, un/vai saldēta jogurta pagatavošanai; medus un medus aizstājēji; auzu putra; musli, kukurūzas pārslas, graudaugu batoniņi; ēšanai gatavas pārslas, graudaugu produkti; rīsi, makaroni, nūdeles; pārtikas produkti, kas pagatavoti uz rīsu, miltu vai graudaugu bāzes, arī kā gatavi ēdieni; picas; sviestmaizes; maizes mīklas maisījumi un mīklas pusfabrikāti; mērces; sojas mērces; kečups; pārtikas aromatizētāji vai garšvielu produkti; pārtikas garšvielas; garšvielas; salātu mērces; majonēze; sinepes; etiķis; aromātiskas piedevas pārtikai; pārtikas putraini, milti; muskatrieksti; pārtikas esences

(111) **Reģ. Nr.** M 66 875 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-503 (220) **Pieteik.dat.** 29.04.2013  
(531) **CFE ind.** 2.9.4



(732) **Īpašn.** ARCANA GLOBAL LTD; Suite 319-3, 32 Threadneedle Street, London EC2R 8AY, GB  
(740) **Pārstāvis** Anda BRIEDE, Aģentūra "INTELS Latvija"; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050  
(511) **9** datoru programnodrošinājums un datorprogrammas; datoraparātūra; serveri, to skaitā serveri tīmekļa vietņu mitināšanas nolūkiem  
**37** datoraparātūras uzstādīšana, apkope un remonts  
**42** mājaslapu un tīmekļa vietņu vizuālās koncepcijas izveide; datoraparātūras, programnodrošinājuma un datorprogrammu, arī mājaslapu un tīmekļa vietņu projektēšana, izstrāde, atjaunināšana un uzturēšana; konsultācijas par datoru tehnisko nodrošinājumu un programnodrošinājumu; serveru mitināšana (hostings); tīkla serveru iznomāšana; drošības pakalpojumu nodrošināšana datortīkliem, datoru pieejai un elektroniskiem pārskaitījumiem

(111) **Reģ. Nr.** M 66 876 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-556 (220) **Pieteik.dat.** 13.05.2013  
(531) **CFE ind.** 5.5.1; 5.5.23; 26.1.1; 26.1.4; 26.1.16; 26.1.21; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** sarkans, dzeltens, melns, balts

(732) **Īpašn.** DRĪKSNE & KO, SIA; Višķu iela 17, Daugavpils LV-5410, LV  
(740) **Pārstāvis** Pāvils SAMUILOVS; Strādnieku iela 94-51, Daugavpils LV-5417  
(511) **35** alkoholisko un bezalkoholisko dzērienu, tabakas izstrādājumu, pārtikas preču, rūpniecības preču un suvenīru tirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 66 877 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-559 (220) **Pieteik.dat.** 14.05.2013  
(531) **CFE ind.** 3.11.9; 3.11.24; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** tumši zils, zils, violets, dzeltens, oranžs, sarkans, brūns  
(732) **Īpašn.** WESTERN EXPRESS, SIA; Brīvības iela 40-29, Rīga LV-1050, LV  
(511) **43** viesu izmitināšana, viesnīcu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 878 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-574 (220) **Pieteik.dat.** 12.09.2013  
(531) **CFE ind.** 27.5.22



(732) **Īpašn.** PAA, SIA; Ūnijas iela 12a, Rīga LV-1084, LV  
(511) **11** sanitārtehniskās ierīces, to skaitā akmens masas izlietnes, vannas un dušas paliktņi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 879 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-601 (220) **Pieteik.dat.** 21.05.2013  
(531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.6; 26.1.19; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** zaļš, balts, melns, dzeltens, zils, violets, sarkans, tumši sarkans, rozā  
(732) **Īpašn.** Edgars RUĢELIS; Pērnavas iela 10-72, Rīga LV-1012, LV  
(511) **29** piens un piena produkti  
**30** kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; saldējums

(111) **Reģ. Nr.** M 66 880 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-636 (220) **Pieteik.dat.** 28.05.2013

**CILART**

- (732) **Īpašn.** NOVARTIS AG; CH-4002 Basel, CH  
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT';  
 Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010  
 (511) **5** farmaceitiskie preparāti, proti, kardiovaskulārie medikamenti

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 881 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-643 (220) **Pieteik.dat.** 30.05.2013  
 (531) **CFE ind.** 2.1.1; 2.1.12; 25.1.5; 26.2.7; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, zils, brūns, bēšs, zeltains, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** ATLANTIKSTARS, SIA; "Surimi", Mucenieki, Ropažu nov. LV-2137, LV  
 (740) **Pārstāvis** Marija TERTIŠNAJA; Vīlandes iela 7-22, Rīga LV-1010  
 (511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārijumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki; zivis un zivju izstrādājumi; izstrādājumi no surimi (jūras produktu aizstājējiem)

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 882 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-673 (220) **Pieteik.dat.** 07.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 2.3.1; 3.4.13; 5.5.20; 25.1.19; 26.2.7; 26.2.8; 26.4.4; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** brūns, gaiši brūns, dzeltens, oranžs, sarkans, zelta, zaļš, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** Olga KARĻIKOVA; Alejas iela 9, Dalbe, Cenu pag., Ozolnieku nov. LV-3018, LV  
 (511) **30** maizes un konditorejas izstrādājumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 883 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-674 (220) **Pieteik.dat.** 07.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 2.3.1; 3.7.24; 5.5.20; 25.1.19; 26.2.7; 26.2.8; 26.4.4; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, brūns, oranžs, dzeltens, zelta, zaļš, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** Olga KARĻIKOVA; Alejas iela 9, Dalbe, Cenu pag., Ozolnieku nov. LV-3018, LV  
 (511) **30** maizes un konditorejas izstrādājumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 884 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-691 (220) **Pieteik.dat.** 10.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 5.3.6; 5.3.13; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.15; 26.1.22; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zaļš, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** LATVIJAS ASTMAS UN ALERĢIJAS BIEDRĪBA, Sabiedriska organizācija; Pērnavas iela 54-11, Rīga LV-1009, LV  
 (511) **41** apmācība

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 885 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-712 (220) **Pieteik.dat.** 14.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.9; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** pelēks, zaļš  
 (732) **Īpašn.** DPA, SIA; Elizabetes iela 75, Rīga LV-1050, LV  
 (740) **Pārstāvis** Aiga IRMEJA; Elizabetes iela 75, Rīga LV-1050



(511) **42** konsultācijas informācijas tehnoloģiju jomā

(111) **Reģ. Nr.** M 66 886 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-720 (220) **Pieteik.dat.** 18.06.2013

## GEMINO

(732) **Īpašn.** IRVITA PLANT PROTECTION, A BRANCH OF CELSIUS PROPERTY B.V.; Pos Cabai Office Park, Unit 13, Curacao, AN

(740) **Pārstāvis** Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006

(511) **5** pesticīdi, to skaitā fungicīdi, insekticīdi un herbicīdi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 887 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-737 (220) **Pieteik.dat.** 20.06.2013  
(531) **CFE ind.** 1.15.23



(591) **Krāsu salikums** tumši pelēks  
(732) **Īpašn.** LEOPARD CREATIVE, SIA; Lielirbes iela 17A-10, Rīga LV-1046, LV  
(511) **43** apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 888 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-747 (220) **Pieteik.dat.** 26.06.2013

## pieci.lv

(732) **Īpašn.** LATVIJAS RADIO, Valsts SIA; Doma laukums 8, Rīga LV-1505, LV

(511) **41** kultūras pasākumi

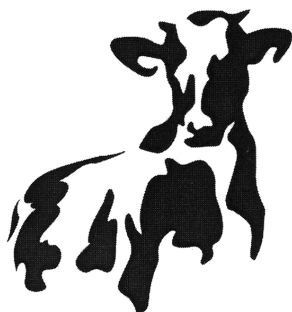
(111) **Reģ. Nr.** M 66 889 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-755 (220) **Pieteik.dat.** 28.06.2013

## CIBUS NOVUS

(732) **Īpašn.** CFBC, SIA; Krišjāņa Valdemāra iela 121-13, Rīga LV-1013, LV

(511) **29** piena produkti  
**30** graudu produkti  
**32** bezalkoholiskie dzērieni  
**35** pārtikas produktu tirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 66 890 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-782 (220) **Pieteik.dat.** 05.07.2013  
(531) **CFE ind.** 3.2.26; 3.4.2



(732) **Īpašn.** AKCINĒ BENDROVĒ PIENO ŽVAIGŽDĒS; Perkūnkemio g. 3, LT-12127 Vilnius, LT

(740) **Pārstāvis** Jevgeņija GAINUTDINOVA; Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013

(511) **29** piens un piena produkti; skābs krējums, krējums, putukrējums, sviesta krēms, sūkalas, jogurts, pārtikas kazeīns, kefīrs, piena dzērieni, piena dzērieni, kuru sastāvā pārsvarā ir piens, himozīna ferments, siers, sviests, kakao vai šokolādes riekstu sviests

(111) **Reģ. Nr.** M 66 891 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-784 (220) **Pieteik.dat.** 08.07.2013  
(531) **CFE ind.** 26.4.6; 26.4.22; 27.5.19; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** zaļš, zils, pelēks  
(732) **Īpašn.** VEHICLES GAS SYSTEMS, SIA; Brīvības gatve 402a-98, Rīga LV-1024, LV

(740) **Pārstāvis** Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA; p/k 98, Rīga LV-1050

(511) **7** sašķidrinātās gāzes sistēmas un citas alternatīvā kurināmā sistēmas sauszemes transportlīdzekļiem, kā arī to daļas, ieskaitot iztvaikotājus, spiediena regulatorus, inžektorus, filtrus un slēgšanas vārstus  
**9** datoru aparatūra un datoru programnodrošinājums, it sevišķi sašķidrinātās gāzes sistēmām un citām alternatīvām sistēmām; kabeļu atsaites; slēdži  
**12** sauszemes transportlīdzekļu motori un dzinēji, kā arī to daļas; sašķidrinātās gāzes tvertnes automobiļiem

(111) **Reģ. Nr.** M 66 892 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-787 (220) **Pieteik.dat.** 09.07.2013

## BRASSERIE BON VIVANT

(732) **Īpašn.** OLIMPS RĪGĀ, SIA; Mārstaļu iela 8, Rīga LV-1050, LV

(740) **Pārstāvis** Dace ŽELVE; Mārstaļu iela 8, Rīga LV-1050

(511) **43** apgāde ar uzturu; kafējnīcu, restorānu, ēdnīcu un bāru pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 893 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-816 (220) **Pieteik.dat.** 21.08.2013

## MIEZĪTIS

(732) **Īpašn.** CĒSU ALUS, AS; Aldaru laukums 1, Cēsis, Cēsu nov. LV-4101, LV

(511) **32** alus

(111) **Reģ. Nr.** M 66 894 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-851 (220) **Pieteik.dat.** 24.07.2013

## MARESSA ESPUMANTE

(732) **Īpašn.** LATVIJAS BALZAMS, AS; Aleksandra Čaka iela 160, Rīga LV-1012, LV

(740) **Pārstāvis** Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006

(511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 66 895 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(210) **Pieteik.** M-13-856 (220) **Pieteik.dat.** 25.07.2013  
(531) **CFE ind.** 26.4.9; 29.1.14





## EASY BUILDING

- (591) **Krāsu salikums** sarkans, tumši pelēks, pelēks, balts  
 (732) **Īpašn.** EASY BUILDING, SIA; Straumes iela 2, Jūrmala LV-2015, LV  
 (511) **36** nekustamā īpašuma lietas

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 896 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-860 (220) **Pieteik.dat.** 02.09.2013

## Kollimpiāde

- (732) **Īpašn.** KOLLIJU PORTĀLS, IK; Dzirnava iela 86, Jūrmala LV-2011, LV  
 (511) **41** sporta un kultūras pasākumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 897 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-872 (220) **Pieteik.dat.** 30.07.2013

## Vidagas Barons

- (732) **Īpašn.** SISTĒMU INOVĀCIJAS, AS; Mazcenu aleja 6a, Jaunmārupe, Mārupes nov. LV-2166, LV  
 (740) **Pārstāvis** Mārtiņš ĒRGLIS; Mazcenu aleja 6a, Jaunmārupe, Mārupes nov. LV-2166  
 (511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki  
**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  
**31** graudi un lauksaimniecības, dārzeņkopības, mežkopības produkcija, kas nav ietverta citās klasēs; dzīvnieki; svaigi augļi un dārzeņi; sēklas; augi un ziedi; dzīvnieku barība; iesals  
**32** alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 898 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-876 (220) **Pieteik.dat.** 31.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 3.1.8; 3.1.24; 3.1.28; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** zils, oranžs, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** CLIFFRON BALTICS, SIA; Brīvības iela 174a, Rīga LV-1012, LV  
 (740) **Pārstāvis** Madara MATĒVIČA; Dzelzavas iela 27-26, Rīga LV-1084  
 (511) **35** bērnu preču mazumtirdzniecības pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 899 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-909 (220) **Pieteik.dat.** 09.08.2013

## GLEZNOTEKA

- (732) **Īpašn.** Jevgēnijs ZAKMANS; Alberta iela 8-5, Rīga LV-1010, LV  
 (740) **Pārstāvis** Māra UZULĒNA, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga LV-1035  
 (511) **41** mākslas darbu un senlietu demonstrēšana un eksponēšana šim nolūkam izveidotās telpās (mākslas galerijās)

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 900 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-986 (220) **Pieteik.dat.** 02.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.3.23; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns  
 (732) **Īpašn.** SOCIÉTÉ COMMERCIALE DES TRANSPORTS ET LOGISTIQUE S.A.; 44, rue de la Vallée, 2661 Luxembourg, LU  
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārto uzstādīšanas) darbi; transportlīdzekļu uzturēšana un remonts; vagonu remonts, vagonu tīrīšana un mazgāšana  
**39** transports; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana; transportlīdzekļu noma; vagonu noma; kravu pārvadājumi; kravu ekspedīcija, loģistikas pakalpojumi; kravu uzglabāšana

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 901 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-1003 (220) **Pieteik.dat.** 04.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.5; 26.4.12; 29.1.13

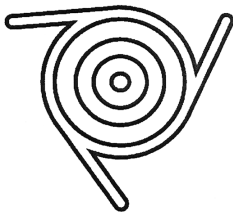


- (591) **Krāsu salikums** zils, pelēks, melns  
 (732) **Īpašn.** MUSIC ONLINE, SIA; Sēpils iela 2C, Rīga LV-1007, LV  
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010  
 (511) **9** lejupielādējamas datorprogrammas; datorprogrammas, arī viedtālruniņiem paredzētās, mūzikas, filmu, TV raidījumu, audio grāmatu un spēļu straumēšanai vai lejuplādēšanai; audio un video ieraksti; lejuplādējamas mūzikas datnes; digitālās mūzikas ieraksti (lejupielādējami), kas iegūstami no Interneta; lejupielādējami digitālās mūzikas ieraksti, kas iegūstami no MP3 vietnēm Internetā  
**38** digitāla saturs elektroniska pārraide un straumēšana trešajām personām, izmantojot globālo un vietējo datortīklu; audio materiāla straumēšana Internetā; video materiāla straumēšana Internetā  
**41** audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi; nodrošināšana ar digitālo mūziku ar Interneta starpniecību (izņemot lejupielādējamu mūziku); nodrošināšana ar digitālo mūziku no MP3 vietnēm Internetā (izņemot lejupielādējamu mūziku); izklaides

pasākumu organizēšana; televīzijas un radio raidījumu veidošana; koncertu un festivālu organizēšana; teatralizētu uzvedumu veidošana; mūzikas sacerēšanas pakalpojumi; scenāriju rakstīšanas pakalpojumi; šovprogrammu veidošana; kultūrizglītojošu konkursu organizēšana; orķestru pakalpojumi; audiodudiju pakalpojumi; videofilmu uzņemšanas pakalpojumi; ierakstu producēšana un izdošana; audio un video ierakstu noma; izklaides un kultūras pasākumu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 902 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-1005 (220) **Pieteik.dat.** 05.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.5

TRIPLE SEVEN



(732) **Īpašn.** BULBASH, SIA; Staraja Rusas iela 22A-14, Rīga LV-1048, LV  
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010  
 (511) **32** alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai, kā arī sastāvdaļas minerālūdens pagatavošanai; kvass; bezalkoholiskie kokteiļi; bezalkoholiskie augļu dzērieni; bezalkoholiskie medus dzērieni; tomātu sula; ābolu sula; dārzeņu sulas  
**33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu), to skaitā aperitīvi, degvīns, džins, alkoholiskie dzērieni gremošanas veicināšanai, alkoholiskie kokteiļi, likieri, augļus saturoši alkoholiskie dzērieni, spirtotie dzērieni, destilētie alkoholiskie dzērieni, medalus, piparmētru alkoholiskie dzērieni, rūgtie uzlējumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 903 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-1031 (220) **Pieteik.dat.** 10.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 27.5.24



(732) **Īpašn.** TPLP GROUP, SIA; Veldres iela 34, Rīga LV-1064, LV  
 (740) **Pārstāvis** Agnese PĒRKONA, COLORART, SIA; Krustabaznīcas iela 11, Rīga LV-1006  
 (511) **25** apģērbi, apavi, galvassegas  
**35** apģērbi, apavu, audumu, aksesuāru un tekstilpreču mazumtirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 66 904 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-1068 (220) **Pieteik.dat.** 19.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 29.1.13



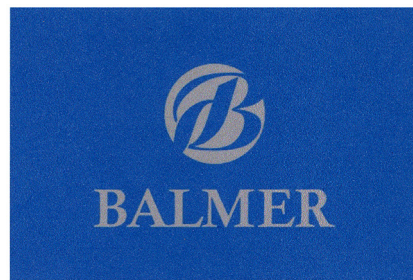
(591) **Krāsu salikums** pelēks, oranžs, balts  
 (732) **Īpašn.** ORANGE GROUP BALTIC, SIA; Torņa iela 4, Rīga LV-1050, LV  
 (740) **Pārstāvis** Artūrs SURMOVIČS; Torņa iela 4, Rīga LV-1050  
 (511) **35** darbā iekārtošanas pakalpojumi; personāla atlases pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 905 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-1076 (220) **Pieteik.dat.** 20.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 5.1.7; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, tumši zils, zaļš  
 (732) **Īpašn.** LATVIJAS HIPOTĒKA, SIA; Brīvības gatve 226-9, Rīga LV-1039, LV  
 (511) **36** finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas  
**45** juridiskie pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 906 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-300 (220) **Pieteik.dat.** 13.03.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 27.5.21; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** tumši zils, sudrabains  
 (732) **Īpašn.** WESTMILE WORLDWIDE LTD; 9 Zinonos Kitieos St., Office 3, 2406 Nicosia, CY  
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010  
 (511) **29** konservēti un žāvēti (kaltēti) augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi; pārtikas eļļas un tauki  
**30** milti, maize; cukurs, medus; sāls; sīrupi, kas nav ietverti citās klasēs  
**31** svaigi augļi un dārzeņi; sēklas  
**32** augļu sulas; sīrupi dzērienu pagatavošanai

(111) **Reģ. Nr.** M 66 907 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-726 (220) **Pieteik.dat.** 19.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.11.22



Lattelecom  
**FREE WiFi**

(732) **Īpašn.** LATTELECOM, SIA; Dzirnau iela 105, Rīga LV-1011, LV  
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010

- (511) **38** telesakari; piekļuves nodrošināšana bezvadu Internetam; bezvadu Interneta pakalpojumi  
**42** datoru aparatūras un programmatūras projektēšana, izstrāde, uzstādīšana, uzturēšana, atjaunināšana un pilnveidošana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 908 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-727 (220) **Pieteik.dat.** 19.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.11.22



**Lattelecom  
 WiFi PAR BRĪVU**

- (732) **Īpašn.** LATTELECOM, SIA; Dzirnau iela 105, Rīga LV-1011, LV  
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010  
 (511) **38** telesakari; piekļuves nodrošināšana bezvadu Internetam; bezvadu Interneta pakalpojumi  
**42** datoru aparatūras un programmatūras projektēšana, izstrāde, uzstādīšana, uzturēšana, atjaunināšana un pilnveidošana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 909 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-785 (220) **Pieteik.dat.** 09.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.2; 26.1.3; 26.4.2; 26.4.5; 26.4.19; 29.1.12



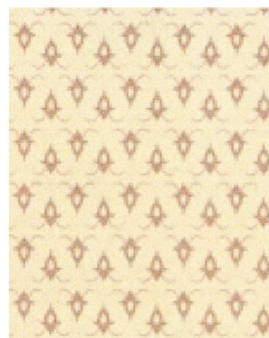
- (591) **Krāsu salikums** sarkans, balts  
 (732) **Īpašn.** SAMSONAS, UAB; Europos pr. 89, LT-46333 Kaunas, LT  
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010  
 (511) **29** gaļa; mājputni un medījumi, izstrādājumi no šiem produktiem, tai skaitā desas; gaļas produkti; gaļas ekstrakti

(111) **Reģ. Nr.** M 66 910 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-786 (220) **Pieteik.dat.** 09.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.2; 26.1.3; 26.4.2; 26.4.5; 26.4.19; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, balts  
 (732) **Īpašn.** SAMSONAS, UAB; Europos pr. 89, LT-46333 Kaunas, LT  
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010  
 (511) **29** gaļa; mājputni un medījumi, izstrādājumi no šiem produktiem, tai skaitā desas; gaļas produkti; gaļas ekstrakti

(111) **Reģ. Nr.** M 66 911 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-12-960 (220) **Pieteik.dat.** 20.08.2012  
 (531) **CFE ind.** 25.7.2; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zeltains, bēšs, brūns  
 (300) **Prioritāte** M201200187; 21.02.2012; EE  
 (732) **Īpašn.** BALBIINO AS; Viljandi mnt. 26, 11217 Tallinn, EE  
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **30** saldējums

(111) **Reģ. Nr.** M 66 912 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-12-988 (220) **Pieteik.dat.** 22.08.2012

**МАСТЕРКАРД**

- (732) **Īpašn.** MASTERCARD INTERNATIONAL INCORPORATED; 2000 Purchase Street, Purchase, NY 10577-2405, US  
 (740) **Pārstāvis** Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma 'LATISS'; Stabu iela 44-21, Rīga LV-1011  
 (511) **9** datoru aparatūras un programmatūras sistēmas maksājumu, banku, kredītkaršu, debetkaršu, norēķinu karšu, bankas automātu, uzkrātās vērtības, elektronisko naudas līdzekļu pārskaitījumu, elektronisko maksājumu, rēķinu apmaksas datu elektroniskās apstrādes un pārraides, skaidrās naudas izmaksas, darījumu autentificēšanas, maršrutēšanas, autorizēšanas un apmaksas, krāpšanas atklāšanas un kontroles, ārkārtas atkopšanas un šifrēšanas pakalpojumu veicināšanai un vadīšanai; zinātniskie aparāti un instrumenti; magnētiskie datu nesēji, ierakstu diski; mehānismi ar naudu iedarbināmiem aparātiem; kases aparāti; datu apstrādes aparātūra; datori; datoru aparātūra; datoru programmatūra un datorprogrammas; aparāti un instrumenti elektriskās strāvas pārvadei; telekomunikāciju aparāti, proti, aparāti datu, to skaitā skaņas un attēlu, ierakstam, pārraidei un reproducēšanai; rēķināšanas mašīnas; aparāti datu, to skaitā skaņas un attēlu, ierakstam, pārraidei vai reproducēšanai; magnētiskie datu nesēji; finanšu kontu izsekošanas, vadīšanas un analīzes aparāti, ko izmanto ar globālā datortīkla starpniecību; datoru aparātūra un programmatūra, it īpaši vietējo un teritoriālo datortīklu attīstīšanai, uzturēšanai un izmantošanai; atmiņas karšu nolasītāji un iekārtas datu nolasīšanai no atmiņas, arī nolasīšanai no integrēto sistēmu atmiņas ierīcēm un bankas karšu atmiņas; lejupielādējamas elektroniskās publikācijas; drukāšanas aparāti, to skaitā drukāšanas



aparāti datu apstrādes sistēmām un finanšu darījumu sistēmām; automātiskie kases aparāti un bankas automāti banku iestāžu vajadzībām; kodētāji un atšifrētāji; modemi; datoru aparatūra un programmatūra maksājumu darījumu atvieglošanai ar elektroniskiem līdzekļiem; datoru aparatūra un šifrēšanas programmatūra, šifrēšanas atslēgas, ciparu sertifikāti, ciparparaksti, programmatūra drošai datu uzglabāšanai un konfidencialas klientu informācijas izguvei un pārsūtīšanai, ko izmanto fizisko personu, banku un finanšu institūciju vajadzībām; kodētas magnētiskās kartes un kartes, kas satur integrētas mikroshēmas (viedkartes); kodētas drošības kartes; ar aizsardzības elementiem kodētas kartes autentifikācijas nolūkiem; ar aizsardzības elementiem kodētas kartes identifikācijas nolūkiem; kartes ar iespiestām hologrammām; maksājumu kartes, bankas kartes, kredītkartes, debetkartes, mikroshēmu kartes, uzkrātās vērtības kartes, elektronisko datu nesēju kartes; norēķinu kartes un kodētās norēķinu kartes; banku kartes, ieskaitot drukātas banku kartes un banku kartes ar magnētisko atmiņu un integrētās shēmas atmiņu; karšu nolasītāji; magnētiski kodēto karšu nolasītāji; elektroniski datu nesēju karšu nolasītāji; elektroniskās šifrēšanas ierīces; datoru aparatūra, datoru termināļi; finanšu pakalpojumu, banku un telekomunikāciju nozarē izmantojama datoru programmatūra; datoru programmatūra iespējamai viedkaršu mijiedarbībai ar termināļiem un nolasītājiem; telefonos un citās sakaru ierīcēs iestrādātas datoru mikroshēmas; telekomunikāciju aparatūra; POS darījumu termināļi, kā arī datorprogrammatūra darījumu, identifikācijas un finanšu informācijas pārraidīšanai, attēlošanai un uzglabāšanai izmantošanai finanšu pakalpojumu, banku un telekomunikāciju nozarē; radiofrekvenču identifikācijas ierīces (retranslatori); elektroniskie verifikācijas aparāti norēķinu karšu, bankas karšu, kredītkaršu, debetkaršu un norēķinu karšu autentifikācijai; skaidras naudas izsniegšanas aparāti; datoru perifērijas ierīces un elektroniskās preces, proti, rēķināšanas mašīnas, kabatas formāta plānotāji, personālie ciparasistenti (PDA) un signalizācijas ierīces

**16** papīrs, kartons un izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; iespaidprodukcija; grāmatu iesiešanas materiāli; fotogrāfijas; rakstāmlietas; līmvielas kancelejas vai mājturības vajadzībām; rakstāmmašīnas un kancelejas preces (izņemot mēbeles); mācību un uzskates līdzekļi (izņemot aparatūru); sintētiskie iesaiņojuma materiāli (kas nav ietverti citās klasēs); iespaidburti; klišējas; drukātās publikācijas, bukleti, brošūras, avīzes, periodiskie izdevumi un žurnāli, rokasgrāmatas, iespaidprodukcija, kas attiecas uz banku pakalpojumiem; kredītkartes, debetkartes; žurnāli

**36** finanšu pakalpojumi, proti, banku pakalpojumi, kredītkaršu pakalpojumi, debetkaršu pakalpojumi un maksājumu karšu pakalpojumi, priekšapmaksas karšu pakalpojumi, kas tiek piedāvāti ar uzkrātās vērtības karšu palīdzību; elektroniskie kredīta un debeta darījumi, rēķinu apmaksas un izrakstīšanas pakalpojumi, skaidrās naudas izmaksa, čeku verifikācija, skaidrās naudas izsniegšana pret čeku; piekļuves nodrošināšana noguldījumiem un bankas automātu pakalpojumi; darījumu autorizēšanas un apmaksas pakalpojumi, darījumu izlīdzināšana, skaidrās naudas pārvaldīšana; finanšu darbības pārskati; apvienoto konfliktu apstrādāšana; datu glabātuvju un klientu profilu informācijas pakalpojumi un saistītie komutācijas, vārteju, apmaksas/izlīdzināšanas un naudas līdzekļu kustības pakalpojumi norēķinu karšu jomā; elektronisko maksājumu apstrādes pakalpojumi; maksājumu darījumu autentificēšanas un verificēšanas pakalpojumi; līdzekļu pārvietošanas pakalpojumi, proti, droši elektroniskie naudas darījumi un elektroniskie naudas pārskaitījumi caur publiskajiem datortīkliem elektroniskās komercijas veicināšanas nolūkos; finanšu

informācijas sniegšana, proti, kredītkaršu un debetkaršu datu un atskaišu sniegšana, finanšu dokumentācijas pārvaldība, elektroniskie naudas līdzekļu pārskaitījumi un valūtas maiņas pakalpojumi; finanšu stāvokļa novērtējumu un risku pārvaldības pakalpojumi trešo personu labā patēriņa kredītu jomā; finanšu informācijas izplatīšana ar globālā datortīkla palīdzību; finanšu informācijas, kas atveidota ar datora palīdzību, izmantojot drošus informācijas datortīklus, konsultatīvie pakalpojumi saistībā ar visiem iepriekšminētajiem pakalpojumiem; finanšu pakalpojumu nodrošināšana mazumtirdzniecības pakalpojumu atbalstam ar mobilo telesakaru līdzekļiem, proti, norēķinu pakalpojumu nodrošināšana ar bezvadu iekārtu palīdzību; finanšu pakalpojumu nodrošināšana mazumtirdzniecības atbalstam tiešsaistē, izmantojot elektroniskos tīklus; finanšu analīze un konsultācijas; apdrošināšanas pakalpojumi; finanšu darījumi, darījumi ar naudu; ar kredītiem saistīti pakalpojumi; banku, norēķinu, kredītu, debeta, maksājumu, piekļuves nodrošināšana uzkrātās vērtības depozītam; rēķinu apmaksas pakalpojumi; bankas automātu pakalpojumi; finanšu darījumu apstrāde tiešsaistē ar datoru datu bāzu vai telesakaru palīdzību un tirdzniecības vietās; kredītkaršu īpašnieku finanšu darījumu apstrāde ar bankas automātu palīdzību; konta izrakstu, naudas iemaksas un naudas izņemšanas nodrošināšana karšu īpašniekiem ar bankas automātu palīdzību; finanšu norēķinu pakalpojumi un finanšu autorizācijas pakalpojumi saistībā ar finanšu maksājumu darījumu apstrādi; ceļojumu apdrošināšanas pakalpojumi; ceļojumu čeku un ceļojumu sertifikātu (vaučeru) izsniegšana un izpirkšana; maksātāja autentificēšanas pakalpojumi; finanšu informācijas verificēšana; finanšu uzskaites uzturēšana; atāllās piekļuves norēķinu pakalpojumi; uzkrātās vērtības elektronisko naudas maku pakalpojumi; elektronisku naudas līdzekļu un valūtas pārskaitījumu pakalpojumu nodrošināšana; elektronisku maksājumu pakalpojumi; priekšapmaksas telefona karšu pakalpojumi; skaidras naudas izmaksas pakalpojumi un darījumu autorizācijas un apmaksas pakalpojumi; debeta un kredīta pakalpojumu nodrošināšana, izmantojot radiofrekvenču identifikācijas ierīces (retranslatorus); debeta un kredīta pakalpojumu nodrošināšana ar sakaru un telesakaru ierīču palīdzību; kredīta un debeta darījumu apstrāde ar telefona un satelītu sakaru līniju palīdzību; finanšu pakalpojumu nodrošināšana mazumtirdzniecības pakalpojumu atbalstam tiešsaistē ar tīklu starpniecību vai citiem elektroniskajiem līdzekļiem, izmantojot elektronisku ciparinformāciju; līdzekļu pārvietošanas pakalpojumi, proti, droša līdzekļu, ieskaitot elektroniskos naudas līdzekļus, pārvietošana pa datortīkliem ar viedkaršu palīdzību; rēķinu apmaksas pakalpojumi ar tīmekļa vietņu starpniecību; banku pakalpojumi tiešsaistē; finanšu pakalpojumi pa telefonu un ar globālā datortīkla vai Interneta palīdzību; ar nekustamo īpašumu saistīti pakalpojumi; nekustamā īpašuma pakalpojumi; nekustamā īpašuma novērtēšana; nekustamā īpašuma investīciju pārvaldība; nekustamā īpašuma investīciju pakalpojumi; nekustamā īpašuma apdrošināšanas pakalpojumi; apdrošināšana īpašuma turētājiem; apdrošināšanas pakalpojumi attiecībā uz īpašumu; nekustamā īpašuma finansēšana; starpniecība attiecībā uz nekustamo īpašumu; nekustamā īpašuma novērtējumi; nekustamā īpašuma aģentūru pakalpojumi; nekustamā īpašuma vērtēšana; nekustamā īpašuma pārvaldība; finanšu darījumu vadība attiecībā uz nekustamo īpašumu; nekustamā īpašuma kredītu nodrošināšana; finansēšanas pakalpojumi attiecībā uz nekustamā īpašuma attīstību; finansiālās starpniecības pakalpojumi attiecībā uz nekustamo īpašumu; finanšu pakalpojumi attiecībā uz nekustamo īpašumu un ēkām; finanšu pakalpojumi nekustamā īpašuma iegādei; kredītīgumu sagatavošana, kas



nodrošināti ar nekustamo īpašumu; dalītu īpašumtiesību organizēšana attiecībā uz nekustamo īpašumu; finanšu nodrošināšanas organizēšana nekustamā īpašuma iegādei; palīdzība nekustamā īpašuma iegādē un līdzdalībā; kapitāla ieguldīšana nekustamajā īpašumā; investēšanas pakalpojumi komerciālajos īpašumos; finanšu pakalpojumi attiecībā uz īpašuma iegādi; finanšu pakalpojumi attiecībā uz īpašuma pārdošanu; dzimtīpašuma finansiāla novērtēšana; nomas īpašuma finansiāla novērtēšana; nekustamā īpašuma izīrēšanas organizēšana; nekustamā īpašuma iznomāšanas organizēšana; īpašuma iznomāšana; nekustamā īpašuma iznomāšana; dzimtīpašuma iznomāšana; īpašuma pārvaldes pakalpojumi attiecībā uz darījumiem ar nekustamo īpašumu; īpašuma novērtēšana; īpašuma portfeļa pārvaldība; īpašuma pārvaldīšana; konsultāciju pakalpojumi attiecībā uz īpašumtiesībām uz nekustamo īpašumu; konsultāciju pakalpojumi attiecībā uz nekustamā īpašuma novērtēšanu; konsultāciju pakalpojumi attiecībā uz korporatīvu nekustamo īpašumu; datorizēti informācijas pakalpojumi attiecībā uz nekustamo īpašumu; konsultāciju pakalpojumi attiecībā uz nekustamo īpašumu; informācijas nodrošināšana attiecībā uz nekustamo īpašumu; informācijas nodrošināšana attiecībā uz īpašuma tirgu; izpētes pakalpojumi attiecībā uz nekustamā īpašuma iegādi; izpētes pakalpojumi attiecībā uz nekustamā īpašuma izvēli; hipotēku finansēšana un aktīvu izvietošana vērtspapīros; konsultāciju pakalpojumi attiecībā uz norēķinu risinājumiem, banku, kredītkaršu, debetkaršu, norēķinu karšu un bankas automātu pakalpojumiem

(111) **Reģ. Nr.** M 66 913 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-651 (220) **Pieteik.dat.** 03.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.9; 26.15.9; 29.1.13

**PRO DEV**

(591) **Krāsu salikums** oranžs, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** PRO DEV, SIA; Kurzemes prospekts 23, Rīga LV-1067, LV  
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi  
**37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi  
**42** inženiertehniskie darbi; konsultācijas celtniecības un arhitektūras jautājumos; dizainprojektēšanas pakalpojumi; interjeru noformēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 914 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-732 (220) **Pieteik.dat.** 29.07.2013

## WINE TREASURY

(732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198a, Rīga LV-1019, LV  
 (511) **9** ar naudu darbināmi spēļu automātu mehānismi  
**28** elektroniskai, magnētiskai un biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti, kas tiek darbināti ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un ir paredzēti komerciālai izmantošanai kazino un spēļu zālēs ar vai bez laimestu izmaksas; spēļu automātu korpusi; ar monētām darbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi  
**41** azartspēļu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 915 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-749 (220) **Pieteik.dat.** 12.08.2013  
 (531) **CFE ind.** 29.1.12

**Job Care**  
 quick . smart . effective

(591) **Krāsu salikums** oranžs, melns  
 (732) **Īpašn.** Mārtiņš PILSKALNS; Lielirbes iela 11-88, Rīga LV-1046, LV  
 (740) **Pārstāvis** Uldis ROZENBERGS; Druvas iela 18, Rīga LV-1002  
 (511) **35** darbā iekārtošanas pakalpojumi; personāla vadības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 916 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-750 (220) **Pieteik.dat.** 12.08.2013

## JOB CARE

(732) **Īpašn.** Mārtiņš PILSKALNS; Lielirbes iela 11-88, Rīga LV-1046, LV  
 (740) **Pārstāvis** Uldis ROZENBERGS; Druvas iela 18, Rīga LV-1002  
 (511) **35** darbā iekārtošanas pakalpojumi; personāla vadības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 917 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-762 (220) **Pieteik.dat.** 02.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 27.5.1

**GLASS**

(300) **Prioritāte** TO/M/13/02737; 07.02.2013; TO  
 (732) **Īpašn.** GOOGLE INC.; 1600 Amphitheatre Parkway, Mountain View, CA 94043, US  
 (740) **Pārstāvis** Ieva ANDERSONE, Zvērinātu advokātu birojs "SORAINEN"; Kr. Valdemāra iela 21, Rīga LV-1010  
 (511) **9** datoraparātūra; datoru perifērijas ierīces; valkāšanai piemērotas datoru perifērijas ierīces; perifērijas ierīces mobilajām ierīcēm; valkāšanai piemērotas perifērijas ierīces mobilajām ierīcēm; datoraparātūra attālinātai piekļuvei un datu pārraidei; datoru perifērijas ierīces attālinātai piekļuvei un datu pārraidei; perifērijas ierīces mobilajām ierīcēm attālinātai piekļuvei un datu pārraidei; datoraparātūra datu un videoattēlu parādīšanai; datoru perifērijas ierīces datu un videoattēlu parādīšanai; perifērijas ierīces mobilajām ierīcēm datu un videoattēlu parādīšanai; datorprogrammatūra

(111) **Reģ. Nr.** M 66 918 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-763 (220) **Pieteik.dat.** 02.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.4; 26.4.5; 29.1.12



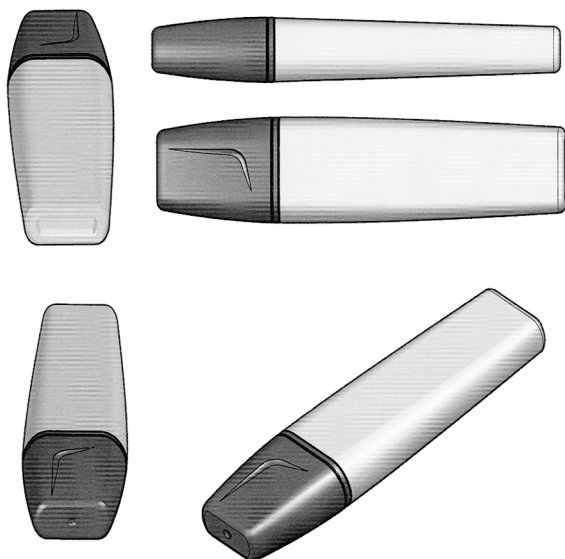
- (591) **Krāsu salikums** zils, balts  
 (732) **Īpašn.** ASK.FM, SIA; Zaļā iela 1, Rīga LV-1010, LV  
 (740) **Pārstāvis** Jānis LĪKOPS, Zvērinātu advokātu birojs "ADVERSUS"; Antonijas iela 8-4, Rīga LV-1010  
 (511) **35** informācijas direktoriju pakalpojumi tiešsaistē; sludinājumu publicēšana tiešsaistē; reklāmas pakalpojumi; reklāmas tekstu un reklāmas materiālu izplatīšana Internetā; reklāmas materiālu un laukumu noma sakaru medijos; reklāmas ideju izstrāde  
**38** sociālo tīklu pieejas nodrošināšanas pakalpojumi; elektronisko paziņojumu dēļu pakalpojumi; personu savstarpējās komunikācijas, proti, tērzēšanas vietņu pieejas, nodrošināšana; elektronisko sakaru pakalpojumi; globālā datortīkla pakalpojumi sakaru jomā; ziņu un attēlu pārraide; datorkomunikācijas pakalpojumu nodrošināšana; datu, ziņojumu, attēlu un videoinformācijas pārraide ar datoru un Interneta starpniecību  
**45** privātie un sabiedriskie pakalpojumi individuālo vajadzību apmierināšanai, proti, tiešsaistes sociālo tīklu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 919 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-804 (220) **Pieteik.dat.** 29.08.2013

## MUSHROOM FABLE

- (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 laimesta 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

(111) **Reģ. Nr.** M 66 920 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-888 (220) **Pieteik.dat.** 01.08.2013  
 (531) **CFE ind.** 20.1.11; 20.1.17



- (554) **Telpiska zīme**  
 (732) **Īpašn.** SCHWAN-STABILO SCHWANHÄUßER GMBH & CO. KG; Schwanweg 1, 90562 Heroldsberg, DE  
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010  
 (511) **16** kancelejas piederumi, kas ietvertas šajā klasē, rakstāmpiederumi, proti, rollerpildspalvas, marķieri un

teksta marķieri, zīmuli, zīmūļu grafiņa serdeni, krāsainie zīmuli, mehāniskie zīmuli, lodīšu pildspalvas, lodīšu pildspalvu serdeni, flomāsteri un pildspalvas ar šķiedras vai filca rakstāmelementu; serdeni pildspalvām ar šķiedras rakstāmelementu; pildspalvas, dzēšamgumijas, zīmūļu asinātāji, lineāli (kancelejas piederumi), zīmēšanas un rasēšanas piederumi, rakstāmpiederumu turētāji, rakstāmpiederumu konteineri, šķīdie korekcijas līdzekļi (biroja preces), papīra preces, kas ietvertas šajā klasē, piezīmju bloknoti, piezīmju grāmatas, rakstāmpiederumu kārbas no kartona vai plastmasas, afišas un plakāti

(111) **Reģ. Nr.** M 66 921 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-982 (220) **Pieteik.dat.** 02.09.2013

## AGRITRANS

- (732) **Īpašn.** GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA; c/o ACSA SA, Commercialisti Associati Via Giacometti 1, 6901 Lugano, CH  
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi; transportlīdzekļu uzturēšana un remonts; vagonu remonts, vagonu tīrīšana un mazgāšana  
**39** transports; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana; transportlīdzekļu iznomāšana; vagonu iznomāšana; kravu pārvadājumi; kravu ekspedīcijas pakalpojumi, loģistikas pakalpojumi; kravu uzglabāšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 922 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-983 (220) **Pieteik.dat.** 02.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 18.1.11; 18.1.23; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16; 29.1.13



### AGRITRANS

GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA

- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA; c/o ACSA SA, Commercialisti Associati Via Giacometti 1, 6901 Lugano, CH  
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi; transportlīdzekļu uzturēšana un remonts; vagonu remonts, vagonu tīrīšana un mazgāšana  
**39** transports; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana; transportlīdzekļu iznomāšana; vagonu iznomāšana; kravu pārvadājumi; kravu ekspedīcijas pakalpojumi, loģistikas pakalpojumi; kravu uzglabāšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 923 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-984 (220) **Pieteik.dat.** 02.09.2013

## TVG

- (732) **Īpašn.** GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA; c/o ACSA SA, Commercialisti Associati Via Giacometti 1, 6901 Lugano, CH  
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi; transportlīdzekļu uzturēšana un remonts; vagonu remonts, vagonu tīrīšana un mazgāšana

**39** transports; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana; transportlīdzekļu iznomāšana; vagonu iznomāšana; kravu pārvadājumi; kravu ekspedīcijas pakalpojumi, loģistikas pakalpojumi; kravu uzglabāšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 924 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-985 (220) **Pieteik.dat.** 02.09.2013  
 (531) **CFE ind.** 18.1.11; 18.1.23; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16; 29.1.13



**TRANS VAGON GROUP**  
 GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA

(591) **Krāsu salikums** brūns, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA; c/o ACSA SA, Commercialisti Associati Via Giacometti 1, 6901 Lugano, CH  
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi; transportlīdzekļu uzturēšana un remonts; vagonu remonts, vagonu tīrīšana un mazgāšana  
**39** transports; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana; transportlīdzekļu iznomāšana; vagonu iznomāšana; kravu pārvadājumi; kravu ekspedīcijas pakalpojumi, loģistikas pakalpojumi; kravu uzglabāšana

(111) **Reģ. Nr.** M 66 925 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-12-933 (220) **Pieteik.dat.** 13.08.2012  
 (531) **CFE ind.** 1.5.1; 1.5.10; 1.15.15; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** zils, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** BGS, SIA; Ūnijas iela 8 k-9, Rīga LV-1084, LV  
 (511) **1** ķīmikālijas rūpnieciskiem nolūkiem; bāzes polimēri, ko pielieto (dūņu) atūdeņošanas procesā; reaģenti, ko pielieto notekūdeņu blīvo nosēdumu izdalīšanai

(111) **Reģ. Nr.** M 66 926 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-97 (220) **Pieteik.dat.** 01.02.2013  
 (531) **CFE ind.** 16.3.13



(732) **Īpašn.** TAKE A LOOK, SIA; Fabrikas iela 15, Talsi, Talsu nov. LV-3201, LV  
 (511) **35** redzes korekcijas līdzekļu un to kopšanas līdzekļu, proti, optisko brillu, kontaktlēcu, kontaktlēcu kopšanas šķīdumu, kā arī saulesbrillu un to aksesuāru vairumtirdzniecības un mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 927 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-247 (220) **Pieteik.dat.** 01.03.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16



**black** Salt

(732) **Īpašn.** Indra SALCEVIČA; Ganību dambis 13-5, Rīga LV-1045, LV  
 (511) **25** apģērbi, apavi, galvassegas un apģērbu aksesuāri, kas ietverti šajā klasē  
**35** reklāma; apģērbu, apavu, galvassegu un apģērbu aksesuāru mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību

(111) **Reģ. Nr.** M 66 928 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-248 (220) **Pieteik.dat.** 01.03.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16; 29.1.13



**red** Salt

(591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** Indra SALCEVIČA; Ganību dambis 13-5, Rīga LV-1045, LV  
 (511) **25** apģērbi, apavi, galvassegas un apģērbu aksesuāri, kas ietverti šajā klasē  
**35** reklāma; apģērbu, apavu, galvassegu un apģērbu aksesuāru mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību

(111) **Reģ. Nr.** M 66 929 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-402 (220) **Pieteik.dat.** 04.04.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.2; 26.1.4; 29.1.13



**ALOE VERA KING**

(591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** OKF CORPORATION; 714, Bokjeung-Dong, Sujeung-Gu, 461-200 Sungnam City, Gyeonggi-Do, KR



- (740) **Pārstāvis** Jevgeņija GAINUTDINOVA; Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013  
 (511) **32** dārzeņu sulas dzērienu pagatavošanai; augļu sulas; sulas, kas satur alveju; augļu sīrupi dzērienu pagatavošanai; sīrupi dzērienu pagatavošanai; pārstrādātu dārzeņu vai augļu dzērieni; bezalkoholiski augļu nektāri; gāzētais ūdens; bezalkoholiskie dzērieni, kas satur augļu sulas; minerālūdeņi; dārzeņu dzērieni; alvejas sula

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 930 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-422 (220) **Pieteik.dat.** 18.08.2006  
 (531) **CFE ind.** 26.1.3; 26.1.12; 26.11.1; 26.11.12; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns  
 (600) Kopienas preču zīmes 005298997 konversija  
 (732) **Īpašn.** DAKOTA S.A.; Av. 15 de Novembro, 3665 Pia, 95150-000 Nova Petrópolis, RS, BR  
 (740) **Pārstāvis** Jevgeņija GAINUTDINOVA; Tomsona iela 24-15, Rīga LV-1013  
 (511) **25** rītakurpes, vannas sandales, garo zābaku stulmi, zābaki, sporta zābaki, stulmzābaki, apavi, viriešu apakšbikses, bikses, siksnas, ādas apģērbs, sporta apavi, sporta apavu augšdaļas, vingrošanas apavi, zeķes, pusgarās zeķes, papēži, sandales, kurpes, pludmales apavi, apavu zoles, apģērbi, zābaku un kurpju stiprinājumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 931 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-443 (220) **Pieteik.dat.** 15.04.2013  
 (531) **CFE ind.** 5.5.20; 20.5.15; 27.5.22; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** gaiši dzeltens, pelēks, melns  
 (732) **Īpašn.** I.T.A. MODA, SIA; Ganību dambis 40C, Rīga LV-1005, LV  
 (740) **Pārstāvis** Arnolds ZVIRGZDS, Agency ARNOPATENTS, SIA; Brīvības iela 162 k-2-17, Rīga LV-1012  
 (511) **18** āda un ādas imitācijas, izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; ceļasomas un čemodāni; rokassomas; lietussargi, saulesargi un spieķi  
**25** apģērbi, apakšveļa, apavi, galvassegas; jostas, šaltes, kaklasaites, lakati, cimdi, aproces, plīvuri  
**26** mežģīnes un izšuvumi, pogas, āķi un cilpiņas; sprādzes, jostu sprādzes, lentes, matu lentes, elastīgas lentes, pītas lentes; apģērbu rotājumi, kas ietverti šajā klasē

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 932 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-494 (220) **Pieteik.dat.** 25.04.2013  
 (531) **CFE ind.** 3.1.1; 3.1.22; 7.1.1; 14.5.3; 24.1.9; 24.1.11; 24.1.13; 24.1.15; 29.1.12



**White House**  
 Property Management & Supervisory

- (591) **Krāsu salikums** gaiši zils, balts  
 (732) **Īpašn.** Aiga ZAHARĀNE; Krišjāņa Valdemāra iela 75-34a, Rīga LV-1013, LV  
 (511) **36** nekustamā īpašuma lietas; nekustamā īpašuma pārvaldnieku pakalpojumi, īpašumu apsaimniekošana, izīrēšana, iznomāšana  
**37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas darbi, telpu uzkopšana, teritorijas labiekārtošana, teritorijas uzkopšana

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 933 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-547 (220) **Pieteik.dat.** 10.05.2013  
 (531) **CFE ind.** 7.3.11; 7.3.12; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zaļš, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** DŪMVADU SERVISS, SIA; Rāmavas iela 4, Rāmava, Ķekavas pag., Ķekavas nov. LV-2111, LV  
 (511) **11** dūmvadi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 934 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-548 (220) **Pieteik.dat.** 10.05.2013

**EKO mds**

- (732) **Īpašn.** DŪMVADU SERVISS, SIA; Rāmavas iela 4, Rāmava, Ķekavas pag., Ķekavas nov. LV-2111, LV  
 (511) **11** dūmvadi

- (111) **Reģ. Nr.** M 66 935 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-594 (220) **Pieteik.dat.** 17.05.2013

**Vidzemes Papīrs Plus**

- (732) **Īpašn.** Estera VALEINE; Valmieras iela 45-51, Rīga LV-1009, LV



(511) **35** papīra un kancelejas preču tirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 66 936

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013

(210) **Pieteik.** M-13-702

(220) **Pieteik.dat.** 13.06.2013

## VIENS VIENS

(732) **Īpašn.** VIENSVIENS.LV, SIA; Dzirnau iela 37-45, Rīga LV-1010, LV

(740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60A-32, Rīga LV-1050

(511) **38** piekļuves pakalpojumi spēļu un azartspēļu datu bāzēm, kas nodrošina lietotāju pieeju spēļu un azartspēļu informācijai un pakalpojumiem ar Interneta un citu veidu datu un informācijas pārraides vai telefona sakaru starpniecību (ieskaitot mobilos telefonus); ziņojumu un attēlu pārraides pakalpojumi ar nestacionāru komunikāciju ierīču, arī ar mobilo telefonu, datortīklu un Interneta starpniecību; telekomunikāciju pakalpojumi, kas saistīti ar Internetu un telefona sakariem, arī ar mobilo telefonu sakariem; datu straumēšana; video pārraides pakalpojumi tiešsaistes režīmā; kultūras, izklaides un sporta pasākumu translācijas nodrošināšana; Interneta tērzēšanas vietņu pakalpojumi; elektroniskā pasta pakalpojumi; radio un/vai televīzijas translācijas nodrošināšana

**41** audzināšanas pakalpojumi; apmācība; izklaide; sporta un kultūras pasākumu pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību; spēļu, arī azartspēļu, interaktīvo spēļu un kāršu spēļu, izložu un derību organizēšana, arī ar Interneta un telefona sakaru starpniecību; instruēšana un apmācība attiecībā uz piekļuves nodrošināšanu datu bāzēm, vietējam un globālajam datortīklam spēļu un azartspēļu spēlēšanas nolūkiem; kazino pakalpojumi; spēļu zāļu pakalpojumi; grāmatu un periodisko izdevumu publicēšana; informācijas pakalpojumi atpūtas un izklaides jomā; publikāciju nodrošināšana tiešsaistes režīmā

(111) **Reģ. Nr.** M 66 937

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013

(210) **Pieteik.** M-13-703

(220) **Pieteik.dat.** 13.06.2013

(531) **CFE ind.** 24.17.7; 26.4.4; 26.4.9; 26.4.24; 27.7.24



**UZVARĒT  
VAR IKVIENS**

(732) **Īpašn.** VIENSVIENS.LV, SIA; Dzirnau iela 37-45, Rīga LV-1010, LV

(740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60A-32, Rīga LV-1050

(511) **38** piekļuves pakalpojumi spēļu un azartspēļu datu bāzēm, kas nodrošina lietotāju pieeju spēļu un azartspēļu informācijai un pakalpojumiem ar Interneta un citu veidu datu un informācijas pārraides vai telefona sakaru starpniecību (ieskaitot mobilos telefonus); ziņojumu un attēlu pārraides pakalpojumi ar nestacionāru komunikāciju ierīču, arī ar mobilo telefonu, datortīklu un Interneta starpniecību; telekomunikāciju pakalpojumi, kas saistīti ar Internetu un telefona sakariem, arī ar mobilo telefonu sakariem; datu straumēšana; video pārraides pakalpojumi tiešsaistes režīmā; kultūras, izklaides un sporta pasākumu translācijas nodrošināšana; Interneta tērzēšanas vietņu pakalpojumi;

elektroniskā pasta pakalpojumi; radio un/vai televīzijas translācijas nodrošināšana

**41** audzināšanas pakalpojumi; apmācība; izklaide; sporta un kultūras pasākumu pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību; spēļu, arī azartspēļu, interaktīvo spēļu un kāršu spēļu, izložu un derību organizēšana, arī ar Interneta un telefona sakaru starpniecību; instruēšana un apmācība attiecībā uz piekļuves nodrošināšanu datu bāzēm, vietējam un globālajam datortīklam spēļu un azartspēļu spēlēšanas nolūkiem; kazino pakalpojumi; spēļu zāļu pakalpojumi; grāmatu un periodisko izdevumu publicēšana; informācijas pakalpojumi atpūtas un izklaides jomā; publikāciju nodrošināšana tiešsaistes režīmā

(111) **Reģ. Nr.** M 66 938

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013

(210) **Pieteik.** M-13-764

(220) **Pieteik.dat.** 02.07.2013

(531) **CFE ind.** 5.5.20; 5.5.21; 29.1.13



# ELIZABETH

*Anno 1899 × Rīga*

(591) **Krāsu salikums** zeltains, melns, balts

(732) **Īpašn.** DZINTARU 34, SIA; Kārļa Ulmaņa gatve 119, Mārupe, Mārupes nov. LV-2167, LV

(511) **36** nekustamā īpašuma lietas

(111) **Reģ. Nr.** M 66 939

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013

(210) **Pieteik.** M-13-765

(220) **Pieteik.dat.** 02.07.2013

(531) **CFE ind.** 27.5.21; 27.5.24; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** melns, dzeltens, sarkans, balts

(732) **Īpašn.** RIMI LATVIA, SIA; Augusta Deglava iela 161, Rīga LV-1021, LV

(511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 66 940

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013

(210) **Pieteik.** M-13-771

(220) **Pieteik.dat.** 03.07.2013

(531) **CFE ind.** 1.15.15; 3.9.1; 3.9.24; 26.4.4; 26.4.5; 26.4.15; 26.4.16; 26.4.22; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zaļš, pelēks, balts  
 (732) **Īpašn.** AVS GRUPA, SIA; Eksporta iela 18-75, Rīga LV-1045, LV  
 (511) **9** lejupielādējamas datorprogrammas un elektroniskās publikācijas  
**35** elektroniska datu apstrāde un datu bāzu pakalpojumi, kas ietverti šajā klasē; reklāma; reklāmas materiālu izplatīšana Internetā; šajā klasē ietvertie pakalpojumi, kas saistīti ar informācijas sniegšanu par uzņēmējdarbību  
**38** elektroniskie sakari; ar globālā datortīkla izmantošanu saistīti pakalpojumi sakaru jomā; ziņu un attēlu pārraide ar datoru starpniecību; datorkomunikācijas pakalpojumi; satelītpārraides; sakaru pakalpojumi, izmantojot optiskās šķiedras tīklus; šajā klasē ietvertie pakalpojumi datu un informācijas sagatavošanai vai pārraidei no elektroniski ierakstītiem datu bāzēm; elektroniskā pasta pakalpojumi; ziņojumu, attēlu un datu bāzu datu pārraide ar datoru un Interneta starpniecību; saglabātas informācijas pārraide uz datu apstrādes aparatūru (ierīcēm)

(111) **Reģ. Nr.** M 66 941 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-790 (220) **Pieteik.dat.** 09.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.1.22; 29.1.13

 ir nauda

- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** CITS MEDIJS, AS; Blaumaņa iela 5a-9, Rīga LV-1011, LV  
 (740) **Pārstāvis** Ieva CIELAVA; Blaumaņa iela 5a-9, Rīga LV-1011  
 (511) **16** iespaidprodukcija  
**35** reklāma  
**38** telesakari  
**41** izklaides un izglītības pakalpojumi; laikrakstu, žurnālu un grāmatu izdošana; ar izklaidi un izglītību saistītas informācijas sniegšana tiešsaistes režīmā

(111) **Reģ. Nr.** M 66 942 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-853 (220) **Pieteik.dat.** 24.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 24.17.25; 29.1.12

EVENT  CATERING

- (591) **Krāsu salikums** bēšs, melns  
 (732) **Īpašn.** BELASCO, SIA; Raiņa bulvāris 21-1, Rīga LV-1050, LV  
 (511) **43** apgāde ar uzturu; sabiedriskās ēdināšanas pakalpojumi un izbraukuma tirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 66 943 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-874 (220) **Pieteik.dat.** 30.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.3.4; 26.3.24

 VAN REIN  
 Juvelierizstrādājumi  
 un aksesuāri vīriešiem

- (732) **Īpašn.** GRENARDI, SIA; Lielirbes iela 17a, Rīga LV-1046, LV  
 (511) **35** juvelierizstrādājumu, rotaslietu, dārgakmeņu un pulksteņu mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 944 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-875 (220) **Pieteik.dat.** 30.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.3.4; 26.3.24

 VAN REIN  
 Ювелирные изделия  
 и аксессуары для мужчин

- (732) **Īpašn.** GRENARDI, SIA; Lielirbes iela 17a, Rīga LV-1046, LV  
 (511) **35** juvelierizstrādājumu, rotaslietu, dārgakmeņu un pulksteņu mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 945 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-891 (220) **Pieteik.dat.** 02.08.2013  
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 29.1.12

WOODENS  SOUL

- (591) **Krāsu salikums** zaļš, oranžs  
 (732) **Īpašn.** DIŽMEŽS, SIA; "Dižmeži", Krustpils pag., Krustpils nov. LV-5204, LV  
 (511) **4** malka; kurināmie un vielas apgaismošanas nolūkiem  
**35** kurināmo un vielu apgaismošanas nolūkiem vairumtirdzniecības un mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 946 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-895 (220) **Pieteik.dat.** 05.08.2013

## octomēbeles

- (732) **Īpašn.** OCTO GROUP, SIA; Nīcgales iela 18a, Rīga LV-1035, LV  
 (511) **35** mēbeļu, apgaismes ierīču un māsaimniecības preču mazumtirdzniecība specializētajos veikalos

(111) **Reģ. Nr.** M 66 947 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-706 (220) **Pieteik.dat.** 06.04.2012  
 (531) **CFE ind.** 27.5.1

 Intesa

- (600) Kopienas preču zīmes 010791804 konversija  
 (732) **Īpašn.** MIRATO S.P.A.; Strada Provinciale Est Sesia, 28064 Landiona, Novara, IT  
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010  
 (511) **3** ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas, kosmētiskie līdzekļi; zobu pulveri un pastas; dezodoranti; krēmi un sauļošanās losjoni; līdzekļi ādas kopšanai pēc sauļošanās, iedeguma imitācijas krēmi un losjoni; skūšanās krēmi un pēcskūšanās līdzekļi; matu kopšanas līdzekļi, to skaitā matu kondicionēšanas līdzekļi, šampūni, balzami un matu želejas; sejas ādas mazgāšanas līdzekļi; sejas ādas krēmi; ķermeņa ādas krēmi un eļļas; intīmās higiēnas līdzekļi; talks;

dekoratīvās kosmētikas līdzekļi; nagu spīdumi; nagu lakas un nagu laku noņemšanas līdzekļi; vannas putas un dušas želejas

(111) **Reģ. Nr.** M 66 950  
(210) **Pieteik.** M-13-200

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(220) **Pieteik.dat.** 20.02.2013

(111) **Reģ. Nr.** M 66 948  
(210) **Pieteik.** M-13-767

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(220) **Pieteik.dat.** 02.07.2013

## YUTON

- (732) **Īpašn.** ZHENGZHOU YUTONG BUS CO., LTD; Yutong Road, Guancheng District, Zhengzhou, CN
- (740) **Pārstāvis** Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra 'INTELS LATVIJA'; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
- (511) **12** autoiekrāvēji ar pacelājdakšu; autopacelāji; laistīšanas automašīnas; autobusi; tālsatiksmes autobusi; kravas automobiļi; piekabes (transportlīdzekļi); autopiekabes; treileri (transportlīdzekļi); ratiņi lokano cauruļu satīšanai; traktori; vagonetes; mazi trīsriteņu automobiļi; elektriskie transportlīdzekļi; autofurģoni; refrižiratori (automobiļi); militārie transportlīdzekļi; sporta automobiļi; pašizgāzēji (transportlīdzekļi); tramvaja vagoni; pārvietošanās līdzekļi pa sauszemi, gaisu, ūdeni vai slīdēm; viegļie automobiļi; motorizēti automobiļi; automobiļi; betona maisītāji (transportlīdzekļi); neatliekamās medicīniskās palīdzības automobiļi; kempingu automobiļi (nelielas mājiņas uz riteņiem); dzīvojamās autopiekabes; transportlīdzekļi braukšanai pa sniegu; tālvadāmi transportlīdzekļi, izņemot rotaļlietas; transportlīdzekļu asis; guļamvagoni; sauszemes transportlīdzekļu ātrumkārbas; transportlīdzekļu virsbūves; griezes momenta pārveidotāji sauszemes transportlīdzekļiem; naftas produktu autocisternas; trošu vagoniņi; vagonetes metālliešanai; uzkopšanas ratiņi; ūdens transportlīdzekļi; transportlīdzekļi uz gaisa spilvena; transportlīdzekļu amortizatoru atsperes; automobiļu bagāžnieki; transportlīdzekļu riteņi; transportlīdzekļu riteņu rumbas; transportlīdzekļu šasijas; transportlīdzekļu amortizatori; transportlīdzekļu bremzes; transportlīdzekļu durvis; transportlīdzekļu piekares atsperes; transportlīdzekļu riteņu diskus; transportlīdzekļu sēdekļi; transportlīdzekļu iekšējais apšuvums
- 37** motorizēto transportlīdzekļu tehniskā apkope un remonts; transportlīdzekļu mazgāšana; transportlīdzekļu apkopes un degvielas uzpildes staciju pakalpojumi, ciktāl tie attiecas uz šo klasi; transportlīdzekļu tīrīšana; transportlīdzekļu remonts avārijas gadījumos; riepu vulkanizācija (remonts)

(111) **Reģ. Nr.** M 66 949  
(210) **Pieteik.** M-13-93

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(220) **Pieteik.dat.** 01.02.2013

## LATVIJAS FAILI

- (732) **Īpašn.** TV 3 LATVIA, SIA; Dzelzavas iela 120G, Rīga LV-1021, LV
- (740) **Pārstāvis** Jurgita SPĪGULE, Zvērinātu advokātu birojs "SPĪGULIS, KUKAINIS & AZANDA"; Valņu iela 3, Rīga LV-1050
- (511) **16** papīrs, kartons un izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; iespiedprodukcija; fotogrāfijas; rakstāmlietas; kancelejas preces (izņemot mēbeles); sintētiskie iesaiņojuma materiāli, kas nav ietverti citās klasēs
- 35** reklāma; reklāmas materiālu publicēšana; reklāmas materiālu izplatīšana
- 41** televīzijas un radio raidījumu veidošana; ziņu reportieru pakalpojumi; fotografēšana; reportāžu gatavošana televīzijai; fotoreportāžu veidošana; raidījumu videoierakstu veikšana; vizuālās mākslas darbu publicēšana kultūras vai izglītības nolūkiem; dokumentālo filmu veidošana

## SKYSTAIRS

- (732) **Īpašn.** TĒRBATAS SĒTA, SIA; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083, LV
- (740) **Pārstāvis** Aleksejs OĻESOVŠ; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083
- (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
- 36** apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas

(111) **Reģ. Nr.** M 66 951  
(210) **Pieteik.** M-13-201  
(531) **CFE ind.** 29.1.12

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(220) **Pieteik.dat.** 20.02.2013



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns
- (732) **Īpašn.** TĒRBATAS SĒTA, SIA; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083, LV
- (740) **Pārstāvis** Aleksejs OĻESOVŠ; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083
- (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
- 36** apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas

(111) **Reģ. Nr.** M 66 952  
(210) **Pieteik.** M-13-234

(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(220) **Pieteik.dat.** 27.02.2013

## Gudriem

- (732) **Īpašn.** GUDRIEM, SIA; Viršu iela 13-33, Rīga LV-1035, LV
- (511) **35** pakalpojumu salīdzināšana, preču cenu salīdzināšana
- 38** elektronisko sakaru pakalpojumi un ar globālā datortīkla izmantošanu saistīti pakalpojumi sakaru jomā; ziņu un attēlu pārraide
- 42** programmatūras un datorprogrammu atjaunošana; zinātnisko un tehnisko projektu izpēte; Interneta platformu izstrāde elektroniskās komercijas nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 66 953  
(210) **Pieteik.** M-13-760

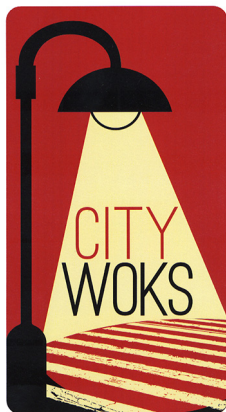
(151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
(220) **Pieteik.dat.** 01.07.2013

## ДРОБА

- (732) **Īpašn.** TĒRBATAS SĒTA, SIA; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083, LV
- (740) **Pārstāvis** Aleksejs OĻESOVŠ; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083
- (511) **41** izpriecas; sporta un kultūras pasākumi
- 43** apgāde ar uzturu (pārtikas produktiem un dzērieniem); kafejnīcu, bāru, restorānu, bufešu pakalpojumi; viesu izmitināšana; viesnīcu pakalpojumi, vietu rezervēšana viesnīcās



(111) **Reģ. Nr.** M 66 954 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-768 (220) **Pieteik.dat.** 02.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 1.15.9; 13.1.10; 26.4.4; 26.4.5; 26.4.16; 26.4.22;  
 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** sarkans, gaiši dzeltens, melns  
 (732) **Īpašn.** ALPHA STAR, SIA; Ropažu iela 11-3, Rīga LV-1039, LV  
 (511) **35** ēšanai gatavu pārtikas produktu un dzērienu vairumtirdzniecība un mazumtirdzniecība  
**43** restorānu, kas piedāvā ēdienus līdzņemšanai, pakalpojumi; ēdināšana; restorānu un bāru pakalpojumi; pašapkalpošanās restorānu pakļpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 955 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-768 (220) **Pieteik.dat.** 03.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 3.7.16; 26.11.1; 26.11.12; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** tumši zils, zils, melns  
 (732) **Īpašn.** AV FOOD, SIA; Bruņinieku iela 6-36, Rīga LV-1010, LV  
 (511) **29** zivis, zivju izstrādājumi, ikri; jūras produkti, kas ietverti šajā klasē

(111) **Reģ. Nr.** M 66 956 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-840 (220) **Pieteik.dat.** 23.07.2013

## ASTMOSIL

(732) **Īpašn.** SILVANOLS, SIA; Kurbada iela 2a, Rīga LV-1009, LV  
 (740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti

(111) **Reģ. Nr.** M 66 957 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-841 (220) **Pieteik.dat.** 23.07.2013

## ATERIN

(732) **Īpašn.** SILVANOLS, SIA; Kurbada iela 2a, Rīga LV-1009, LV  
 (740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti

(111) **Reģ. Nr.** M 66 958 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-842 (220) **Pieteik.dat.** 23.07.2013

## SILVADEPREX

(732) **Īpašn.** SILVANOLS, SIA; Kurbada iela 2a, Rīga LV-1009, LV  
 (740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti

(111) **Reģ. Nr.** M 66 959 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-202 (220) **Pieteik.dat.** 20.02.2013  
 (531) **CFE ind.** 16.1.13; 17.1.2; 27.7.11; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** zils, dzeltens  
 (732) **Īpašn.** PANDORA GROUP, SIA; Tērbatas iela 73, Rīga LV-1001, LV  
 (740) **Pārstāvis** Aleksejs OĻESOVŠ; Imantas 2. līnija 19, Rīga LV-1083  
 (511) **41** izpriecās; sporta un kultūras pasākumi  
**43** apgāde ar uzturu (pārtikas produktiem un dzērieniem); kafējnīcu, bāru, restorānu un bufešu pakalpojumi; viesu izmitināšana, viesnīcu pakalpojumi, vietu rezervēšana viesnīcās  
**44** veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam

(111) **Reģ. Nr.** M 66 960 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-696 (220) **Pieteik.dat.** 12.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 24.5.7; 25.1.10; 25.1.17; 25.7.15; 26.4.6; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** sarkans, gaiši brūns, pelēks, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** ALTIA LATVIA, SIA; Kuldīgas iela 36a, Rīga LV-1083, LV  
 (740) **Pārstāvis** Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma 'LATISS'; Stabu iela 44-21, Rīga LV-1011  
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni, proti, dzirkstošie vīni



(111) **Reģ. Nr.** M 66 961 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-752 (220) **Pieteik.dat.** 27.06.2013

## Puķu Balle

(732) **Īpašn.** BOTĀNISKĀ DĀRZA DRAUGU BIEDRĪBA, Biedrība;  
 Berģu iela 74, Rīga LV-1024, LV  
 (511) **41** sporta un kultūras pasākumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 962 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-707 (220) **Pieteik.dat.** 16.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 11.1.1; 11.1.5



# Cottage

RESTORĀNS

(732) **Īpašn.** LABADIENA, SIA; Krišjāņa Barona iela 24/26-28, Rīga  
 LV-1050, LV

(740) **Pārstāvis** Arvis ZĒMANIS; Tallinas iela 37a-13, Rīga LV-1012

(511) **43** apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana un uztura  
 nodrošināšana, arī īslaicīgas uzturēšanās vietās, tostarp  
 viesnīcās un pansijās; ēdienu un dzērienu sagatavošana  
 tūlītējam patēriņam, arī restorānos, bāros un kafējnīcās;  
 apmešanās vietu rezervēšana ceļotājiem, it īpaši ar  
 ceļojumu aģentūru vai ceļojumu aģentu starpniecību;  
 dzīvnieku izmitināšanas (dzīvnieku viesnīcu)  
 pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 963 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-291 (220) **Pieteik.dat.** 12.03.2013  
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 27.5.21



Supreme  
BLEND

(732) **Īpašn.** GLOBAL TOBACCO, LLC; 2861 Congressman Lane,  
 Dallas, TX 76053, US

(740) **Pārstāvis** Valters GENCS; Kr. Valdemāra iela 21, Rīga  
 LV-1010

(511) **34** tabaka; cigāri; smēķēšanas piederumi; sērskociņi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 964 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-117 (220) **Pieteik.dat.** 06.02.2013

## Баянист Тамада Услуги

(732) **Īpašn.** JJ & Q, SIA; "Surimi", Mucenieki, Ropažu nov. LV-2137,  
 LV

(740) **Pārstāvis** Marija TERTIŠNAJA; Vīlandes iela 7-22, Rīga  
 LV-1010

(511) **9** zinātniskie, kuģniecības, ģeodēziskie, fotogrāfiskie,  
 kinematogrāfiskie, optiskie, svēršanas, mērīšanas,  
 signalizācijas, kontroles (pārbaudes), glābšanas  
 un mācību aparāti, ierīces un instrumenti; aparāti,  
 ierīces un instrumenti elektriskās strāvas pārvadei,  
 komutācijai, pārveidošanai, uzkrāšanai, regulēšanai  
 vai kontrolei; aparāti skaņas vai attēlu ierakstam,  
 pārraidei vai reproducēšanai; mehānismi ar naudu  
 iedarbināmiem aparātiem; kases aparāti, rēķināšanas  
 mašīnas, informācijas apstrādes ierīces, datori; datoru  
 programmatūra; ugunsdzēsības ierīces

(111) **Reģ. Nr.** M 66 965 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-878 (220) **Pieteik.dat.** 31.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.4.2; 26.4.5; 26.4.22; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** tumši zils, zils, zaļš, balts  
 (732) **Īpašn.** JOGOTAVA, SIA; Priežu iela 13, Jaunmārupe,  
 Mārupes nov. LV-2166, LV  
 (740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA  
 PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **41** fitnesa pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 966 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-897 (220) **Pieteik.dat.** 05.08.2013  
 (531) **CFE ind.** 21.1.9; 26.4.1; 26.4.4; 26.4.7; 26.4.24



(591) **Krāsu salikums** zils, pelēks, melns, balts  
 (732) **Īpašn.** EXPORTSTAR OÜ; Rännaku pst 12, 10917 Tallinn,  
 Harju maakond, EE  
 (740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA  
 PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010  
 (511) **16** mācību materiāli (izņemot aparatūru)  
**41** semināri, apmācība, biznesa apmācība

(111) **Reģ. Nr.** M 66 967 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-570 (220) **Pieteik.dat.** 14.05.2013

## ETNOKOKS

(732) **Īpašn.** ETNOKOKS, Biedrība; Dzilas iela 15-48, Rīga  
 LV-1011, LV

(511) **41** kultūrizglītojoši pakalpojumi, kas saistīti ar  
 kultūrvēsturiskajiem objektiem un to apzināšanu

(111) **Reģ. Nr.** M 66 968 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-796 (220) **Pieteik.dat.** 11.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 8.7.4; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** tumši brūns, gaiši brūns, oranži brūns, oranžs, tumši bēšs, gaiši bēšs, balts  
 (732) **Īpašn.** PICU DARBNĪCA, SIA; Zeltrītu iela 22-57, Mārupe, Mārupes nov. LV-2167, LV  
 (511) **43** apgāde ar uzturu

(111) **Reģ. Nr.** M 66 969 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-797 (220) **Pieteik.dat.** 11.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 2.1.11; 8.7.4; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** tumši brūns, gaiši brūns, oranžs, bēšs, dzeltens, pelēks, balts  
 (732) **Īpašn.** PICU DARBNĪCA, SIA; Zeltrītu iela 22-57, Mārupe, Mārupes nov. LV-2167, LV  
 (511) **43** apgāde ar uzturu

(111) **Reģ. Nr.** M 66 970 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-817 (220) **Pieteik.dat.** 16.07.2013

## DIZAINA LĪNIJA

(732) **Īpašn.** Larisa POMEŠČIKOVA; Baznīcas iela 39-7, Rīga LV-1010, LV  
 (740) **Pārstāvis** Aleksandrs BOGDANOVŠ; Andrejostas iela 1a-11, Rīga LV-1045  
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi  
**42** mākslas dizains; ēku fasāžu noformēšanas pakalpojumi (ciktāl tie attiecas uz šo klasi); telpu interjeru noformēšana; arhitektu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 66 971 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-877 (220) **Pieteik.dat.** 31.07.2013  
 (531) **CFE ind.** 27.5.4



(732) **Īpašn.** Natalja KAZAKOVA; Tomsona iela 30-46, Rīga LV-1013, LV  
 (740) **Pārstāvis** Aleksandrs BOGDANOVŠ; Andrejostas iela 1a-11, Rīga LV-1045  
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; asistēšana biznesa pārvaldīšanā  
**38** telesakari; elektronisko ziņojumu dēļu darbības nodrošināšana tiešsaistes režīmā (provaideru pakalpojumi), pieejas nodrošināšana datu bāzēm

(111) **Reģ. Nr.** M 66 972 (151) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (210) **Pieteik.** M-13-719 (220) **Pieteik.dat.** 17.06.2013  
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.1.19



(732) **Īpašn.** Jurijs RUZINS; Tallinas iela 40-61, Jūrmala LV-2016, LV  
 Dmitrijs ZELENKO; Tērbatas iela 41-37, Jūrmala LV-2016, LV  
 (740) **Pārstāvis** Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra "A. SMIRNOV & CO."; Alīses iela 10-69, Rīga LV-1046  
 (511) **3** abrazīvie līdzekļi, to skaitā smilšpapīrs  
**7** darbmašīnu piederumi, to skaitā slīpēšanas rīpas, griešanas ierīces un urbji  
**8** rokas darbarīki, ar roku darbināmas ierīces

## Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs

(210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs	(210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs
M-12-933	M 66 925	M-13-817	M 66 970
M-12-960	M 66 911	M-13-840	M 66 956
M-12-988	M 66 912	M-13-841	M 66 957
M-12-1544	M 66 868	M-13-842	M 66 958
M-13-71	M 66 869	M-13-851	M 66 894
M-13-93	M 66 949	M-13-853	M 66 942
M-13-97	M 66 926	M-13-856	M 66 895
M-13-117	M 66 964	M-13-860	M 66 896
M-13-189	M 66 870	M-13-872	M 66 897
M-13-200	M 66 950	M-13-874	M 66 943
M-13-201	M 66 951	M-13-875	M 66 944
M-13-202	M 66 959	M-13-876	M 66 898
M-13-234	M 66 952	M-13-877	M 66 971
M-13-247	M 66 927	M-13-878	M 66 965
M-13-248	M 66 928	M-13-888	M 66 920
M-13-291	M 66 963	M-13-891	M 66 945
M-13-298	M 66 871	M-13-895	M 66 946
M-13-300	M 66 906	M-13-897	M 66 966
M-13-387	M 66 872	M-13-909	M 66 899
M-13-402	M 66 929	M-13-982	M 66 921
M-13-422	M 66 930	M-13-983	M 66 922
M-13-443	M 66 931	M-13-984	M 66 923
M-13-474	M 66 873	M-13-985	M 66 924
M-13-492	M 66 874	M-13-986	M 66 900
M-13-494	M 66 932	M-13-1003	M 66 901
M-13-503	M 66 875	M-13-1005	M 66 902
M-13-547	M 66 933	M-13-1031	M 66 903
M-13-548	M 66 934	M-13-1068	M 66 904
M-13-556	M 66 876	M-13-1076	M 66 905
M-13-559	M 66 877		
M-13-570	M 66 967		
M-13-574	M 66 878		
M-13-594	M 66 935		
M-13-601	M 66 879		
M-13-636	M 66 880		
M-13-643	M 66 881		
M-13-651	M 66 913		
M-13-673	M 66 882		
M-13-674	M 66 883		
M-13-691	M 66 884		
M-13-696	M 66 960		
M-13-702	M 66 936		
M-13-703	M 66 937		
M-13-706	M 66 947		
M-13-707	M 66 962		
M-13-712	M 66 885		
M-13-719	M 66 972		
M-13-720	M 66 886		
M-13-726	M 66 907		
M-13-727	M 66 908		
M-13-732	M 66 914		
M-13-737	M 66 887		
M-13-747	M 66 888		
M-13-749	M 66 915		
M-13-750	M 66 916		
M-13-752	M 66 961		
M-13-755	M 66 889		
M-13-760	M 66 953		
M-13-762	M 66 917		
M-13-763	M 66 918		
M-13-764	M 66 938		
M-13-765	M 66 939		
M-13-766	M 66 954		
M-13-767	M 66 948		
M-13-768	M 66 955		
M-13-771	M 66 940		
M-13-782	M 66 890		
M-13-784	M 66 891		
M-13-785	M 66 909		
M-13-786	M 66 910		
M-13-787	M 66 892		
M-13-790	M 66 941		
M-13-796	M 66 968		
M-13-797	M 66 969		
M-13-804	M 66 919		
M-13-816	M 66 893		

## Preču zīmju īpašnieku rādītājs

(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs	(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs
AKCINĒ BENDROVĒ PIENO ŽVAIGZDĒS	M-13-782	ORANGE GROUP BALTIC, SIA PAA, SIA	M-13-1068 M-13-574
ALCONET, SIA	M-13-387	PANDORA GROUP, SIA	M-13-202
ALPHA STAR, SIA	M-13-766	PICU DARBNĪCA, SIA	M-13-796
ALTIA LATVIA, SIA	M-13-696		M-13-797
ARCANA GLOBAL LTD	M-13-503	PILSKALNS, Mārtiņš	M-13-749
ASK.FM, SIA	M-13-763		M-13-750
ATLANTIKSTARS, SIA	M-13-643	POMEŠČIKOVA, Larisa	M-13-817
AV FOOD, SIA	M-13-768	PRO DEV, SIA	M-13-651
AVS GRUPA, SIA	M-13-771	RIMI LATVIA, SIA	M-13-765
BALBIINO AS	M-12-960	RUĢELIS, Edgars	M-13-601
BALTO LINK, UADBB	M-13-71	RUZINS, Jurijs	M-13-719
BELASCO, SIA	M-13-853	SALCEVIČA, Indra	M-13-247
BGS, SIA	M-12-933		M-13-248
BOTĀNISKĀ DĀRZA DRAUGU BIEDRĪBA, Biedrība	M-13-752	SAMSONAS, UAB	M-13-785
BULBASH, SIA	M-13-1005		M-13-786
CĒSU ALUS, AS	M-13-816	SCHWAN-STABILO SCHWANHÄUßER	
CFBC, SIA	M-13-755	GMBH & CO. KG	M-13-888
CITS MEDIJS, AS	M-13-790	SILVANOLS, SIA	M-13-840
CLIFFRON BALTICS, SIA	M-13-876		M-13-841
DAKOTA S.A.	M-13-422		M-13-842
DIŽMEŽS, SIA	M-13-891	SISTĒMU INOVĀCIJAS, AS	M-13-872
DLV, SIA	M-13-732	SOCIÉTÉ COMMERCIALE DES TRANSPORTS ET	
	M-13-804	LOGISTIQUE S.A.	M-13-986
DPA, SIA	M-13-712	ŠLĒGELMILHS, Haralds	M-13-189
DRĪKSNE & KO, SIA	M-13-556	TAKE A LOOK, SIA	M-13-97
DŪMVADU SERVISS, SIA	M-13-547	TĒRBATAS SĒTA, SIA	M-13-200
	M-13-548		M-13-201
DZINTARU 34, SIA	M-13-764		M-13-760
EASY BUILDING, SIA	M-13-856		M-13-1031
ETNOKOKS, Biedrība	M-13-570	TPLP GROUP, SIA	M-13-93
EXPORTSTAR OŪ	M-13-897	TV 3 LATVIA, SIA	M-13-594
GLOBAL TOBACCO, LLC	M-13-291	VALEINE, Estera	M-13-784
GOOGLE INC.	M-13-762	VEHICLES GAS SYSTEMS, SIA	M-13-702
GRENARDI, SIA	M-13-874	VIENSVIENS.LV, SIA	M-13-703
	M-13-875		M-13-559
GRUPPO TRASPORTI FERROVIARI MARITTIMI SA	M-13-982	WESTERN EXPRESS, SIA	M-13-300
	M-13-983	WESTMILE WORLDWIDE LTD	M-13-494
	M-13-984	ZAHARĀNE, Aiga	M-13-909
	M-13-985	ZAKMANS, Jevgēnijs	M-13-719
GUDRIEM, SIA	M-13-234	ZELĒNKO, Dmitrijs	
GULĶO, Tatjana	M-12-1544	ZHENGZHOU YUTONG BUS CO., LTD	M-13-767
I.T.A. MODA, SIA	M-13-443		
IRVITA PLANT PROTECTION, A BRANCH OF CELSIUS PROPERTY B.V.	M-13-720		
JJ & Q, SIA	M-13-117		
JOGOTAVA, SIA	M-13-878		
JUTRZENKA COLIAN SP. Z O.O.	M-13-492		
KARĻIKOVA, Olga	M-13-673		
	M-13-674		
KAZAKOVA, Natalja	M-13-877		
KOLLIJU PORTĀLS, IK	M-13-860		
LABA DIENA, SIA	M-13-707		
LATTELECOM, SIA	M-13-726		
	M-13-727		
LATVIJAS ASTMAS UN ALERĢIJAS BIEDRĪBA, Sabiedriska organizācija	M-13-691		
LATVIJAS BALZAMS, AS	M-13-851		
LATVIJAS HIPOTĒKA, SIA	M-13-1076		
LATVIJAS RADIO, Valsts SIA	M-13-747		
LEOPARD CREATIVE, SIA	M-13-737		
LIGMAN LIGHTING COMPANY LIMITED	M-13-474		
MASTERCARD INTERNATIONAL INCORPORATED	M-12-988		
MIRATO S.P.A.	M-13-706		
MOBIUS, SIA	M-13-298		
MUSIC ONLINE, SIA	M-13-1003		
NOVARTIS AG	M-13-636		
OCTO GROUP, SIA	M-13-895		
OKF CORPORATION	M-13-402		
OLIMPS RĪGĀ, SIA	M-13-787		



## 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 66 925	35	M 66 868	41	M 66 959
3	M 66 947		M 66 872		M 66 961
	M 66 972		M 66 876		M 66 965
4	M 66 945		M 66 889		M 66 966
5	M 66 880		M 66 898		M 66 967
	M 66 886		M 66 903	42	M 66 875
	M 66 956		M 66 904		M 66 885
	M 66 957		M 66 913		M 66 907
	M 66 958		M 66 915		M 66 908
7	M 66 891		M 66 916		M 66 913
	M 66 972		M 66 918		M 66 952
8	M 66 972		M 66 926		M 66 970
9	M 66 871		M 66 927	43	M 66 877
	M 66 875		M 66 928		M 66 887
	M 66 891		M 66 935		M 66 892
	M 66 901		M 66 940		M 66 942
	M 66 912		M 66 941		M 66 953
	M 66 914		M 66 943		M 66 954
	M 66 917		M 66 944		M 66 959
	M 66 919		M 66 945		M 66 962
	M 66 940		M 66 946		M 66 968
	M 66 964		M 66 949		M 66 969
11	M 66 873		M 66 950	44	M 66 959
	M 66 878		M 66 951	45	M 66 905
	M 66 933		M 66 952		M 66 918
	M 66 934		M 66 954		
12	M 66 891		M 66 971		
	M 66 948		M 66 869		
16	M 66 912	36	M 66 895		
	M 66 920		M 66 905		
	M 66 941		M 66 912		
	M 66 949		M 66 932		
	M 66 966		M 66 938		
18	M 66 931		M 66 950		
25	M 66 870		M 66 951		
	M 66 903	37	M 66 868		
	M 66 927		M 66 875		
	M 66 928		M 66 900		
	M 66 930		M 66 913		
	M 66 931		M 66 921		
26	M 66 931		M 66 922		
28	M 66 914		M 66 923		
	M 66 919		M 66 924		
29	M 66 874		M 66 932		
	M 66 879		M 66 948		
	M 66 881		M 66 970		
	M 66 889	38	M 66 901		
	M 66 890		M 66 907		
	M 66 897		M 66 908		
	M 66 906		M 66 918		
	M 66 909		M 66 936		
	M 66 910		M 66 937		
	M 66 955		M 66 940		
30	M 66 874		M 66 941		
	M 66 879		M 66 952		
	M 66 882		M 66 971		
	M 66 883	39	M 66 868		
	M 66 889		M 66 900		
	M 66 897		M 66 921		
	M 66 906		M 66 922		
	M 66 911		M 66 923		
31	M 66 897		M 66 924		
	M 66 906	41	M 66 870		
32	M 66 889		M 66 884		
	M 66 893		M 66 888		
	M 66 897		M 66 896		
	M 66 902		M 66 899		
	M 66 906		M 66 901		
	M 66 929		M 66 914		
33	M 66 894		M 66 936		
	M 66 902		M 66 937		
	M 66 939		M 66 941		
	M 66 960		M 66 949		
34	M 66 963		M 66 953		

## 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 Valsts 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 dizainparaugu 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. Iebildumu 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).

### 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) Pārstāvis (patentpilnvarotais, dizainparaugu aģents), adrese  
Representative (attorney), 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)

(51) LOC kl. 11-01

- (11) Reģ. Nr. D 15 514 (15) Reģ. dat. 20.12.2013  
(21) Pieteik. D-13-43 (22) Pieteik.dat. 04.09.2013  
(72) Dizainers Eduards ZVEJNIEKS (LV)  
(73) Īpašnieks Eduards ZVEJNIEKS; Strēlnieku iela 11-21, Rīga LV-1010, LV  
(54) PIEKARIŅŠ

1.01



1.02



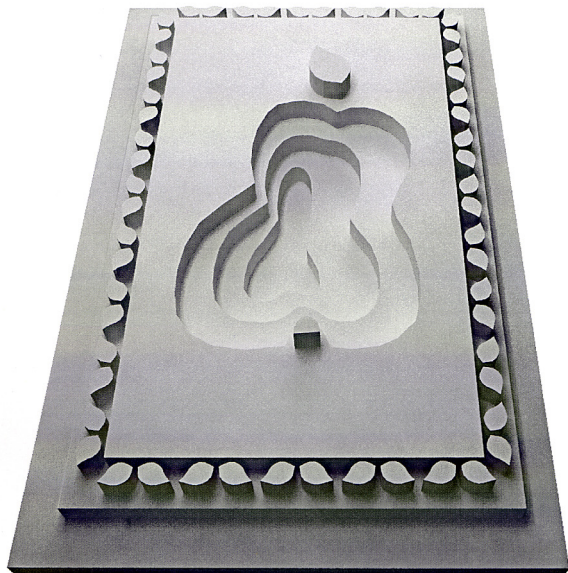


(51) **LOC kl.** 25-01  
 (11) **Reģ. Nr.** D 15 515 (15) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (21) **Pieteik.** D-13-47 (22) **Pieteik.dat.** 13.09.2013  
 (46) **Publikācijas atlikšanas termiņš** 13.12.2013  
 (72) **Dizainers** Jeļena KURJANA (LV)  
 (73) **Īpašnieks** Jeļena KURJANA; Hamburgas iela 7-2, Rīga LV-1014, LV  
 (54) **DEKORATĪVS SIENU PANELIS**  
 (28) **Dizainparaugu skaits** 2

1.01

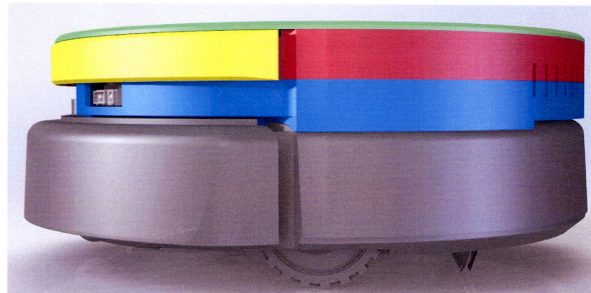


2.01

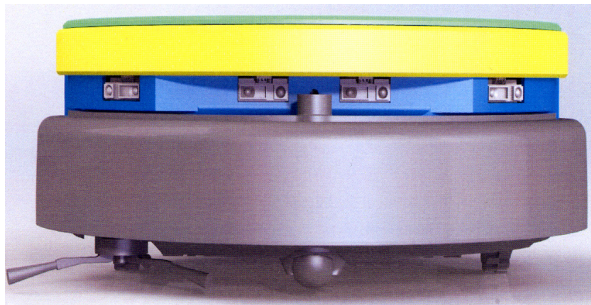


(51) **LOC kl.** 15-05  
 (11) **Reģ. Nr.** D 15 516 (15) **Reģ. dat.** 20.12.2013  
 (21) **Pieteik.** D-13-56 (22) **Pieteik.dat.** 07.10.2013  
 (72) **Dizaineri** Guntis KUĻIKOVSKIS (LV);  
 Agris ŅIKITENKO (LV);  
 Einārs DEKSNIS (LV)  
 (73) **Īpašnieks** RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga LV-1658, LV  
 (54) **PUTEKĻU SŪCĒJS**

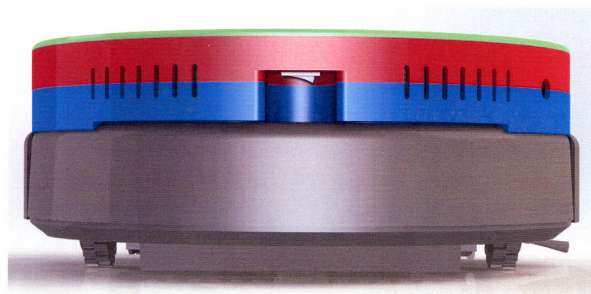
1.01



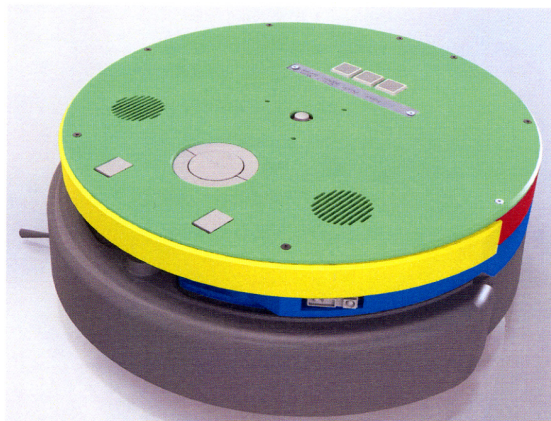
1.02



1.03

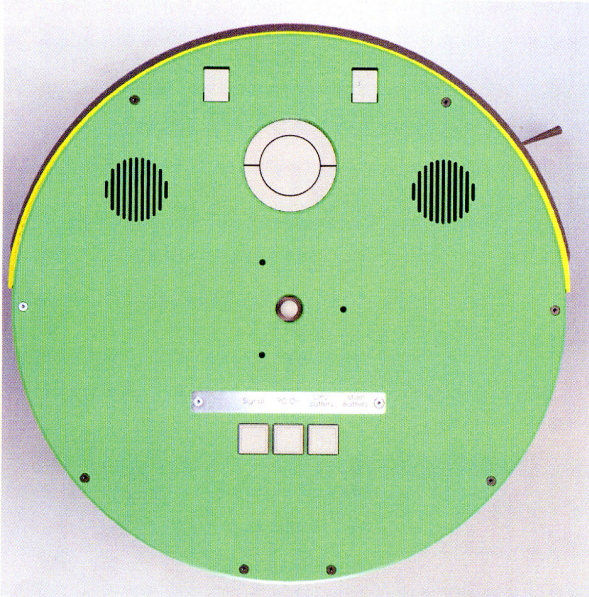


1.04

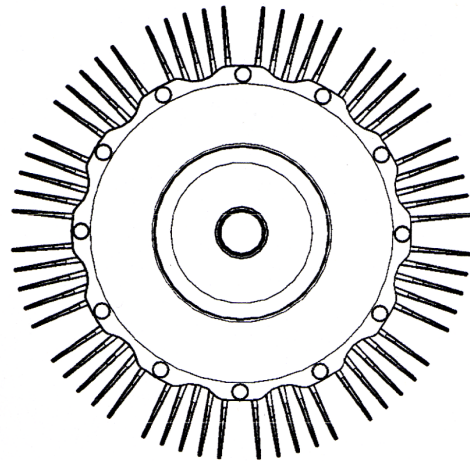




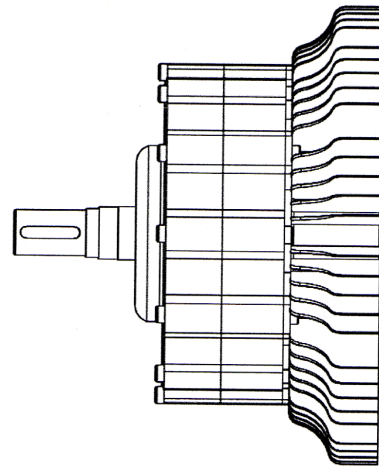
1.05



1.02

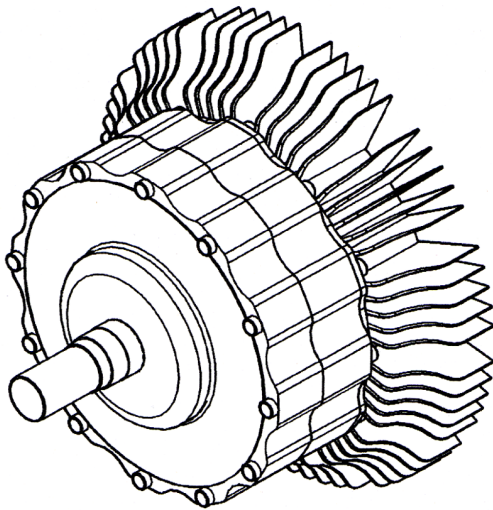


1.03

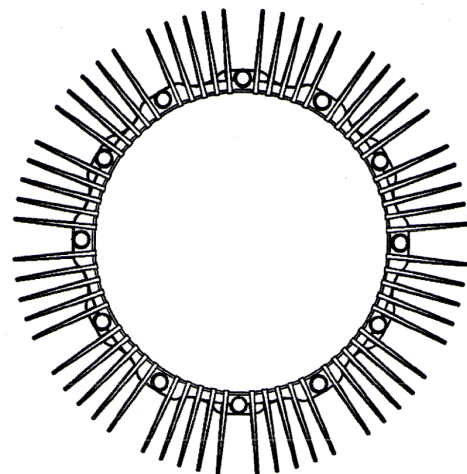


(51) LOC kl. 15-05  
 (11) Reģ. Nr. D 15 517 (15) Reģ. dat. 20.12.2013  
 (21) Pieteik. D-13-59 (22) Pieteik.dat. 16.10.2013  
 (72) Dizainers Alvis SOKOLOVS (LV)  
 (73) Īpašnieks RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kalķu iela 1,  
 Rīga LV-1658, LV  
 (54) ĢENERATORS AR PĀRVEIDOTĀJU

1.01



1.04





**Dizainparaugu pieteikumu numerācijas rādītājs**  
(ietver 2013. gadā reģistrētos un publicētos dizainparaugus)

(21) Pieteikuma numurs	(11) Reģistrācijas numurs
D-12-20	D 15 503
D-12-39	D 15 466
D-12-41	D 15 463
D-12-42	D 15 464
D-12-44	D 15 455
D-12-45	D 15 456
D-12-46	D 15 465
D-12-48	D 15 467
D-12-50	D 15 468
D-12-51	D 15 457
D-12-52	D 15 469
D-12-53	D 15 470
D-12-54	D 15 458
D-12-55	D 15 459
D-12-56	D 15 460
D-12-57	D 15 461
D-12-58	D 15 474
D-12-59	D 15 462
D-12-60	D 15 471
D-13-1	D 15 479
D-13-2	D 15 475
D-13-3	D 15 472
D-13-4	D 15 473
D-13-5	D 15 480
D-13-6	D 15 497
D-13-7	D 15 476
D-13-9	D 15 481
D-13-10	D 15 477
D-13-11	D 15 478
D-13-13	D 15 498
D-13-14	D 15 492
D-13-19	D 15 483
D-13-20	D 15 484
D-13-21	D 15 485
D-13-22	D 15 487
D-13-23	D 15 493
D-13-24	D 15 488
D-13-25	D 15 482
D-13-26	D 15 499
D-13-27	D 15 486
D-13-29	D 15 489
D-13-30	D 15 490
D-13-31	D 15 491
D-13-32	D 15 504
D-13-33	D 15 494
D-13-34	D 15 495
D-13-35	D 15 500
D-13-36	D 15 496
D-13-38	D 15 501
D-13-39	D 15 502
D-13-40	D 15 508
D-13-41	D 15 509
D-13-42	D 15 505
D-13-43	D 15 514
D-13-45	D 15 506
D-13-46	D 15 507
D-13-47	D 15 515
D-13-49	D 15 510
D-13-50	D 15 511
D-13-56	D 15 516
D-13-57	D 15 512
D-13-58	D 15 513
D-13-59	D 15 517

## Dizaineru un dizainparaugu īpašnieku alfabētiskais rādītājs (ietver 2013. gadā reģistrētos un publicētos dizainparaugus)

(72) Dizainers (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(72) Dizainers (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(72) Dizainers (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs
<b>5</b>					
5WAY, SIA	D-12-59	KULDĪGAS NOVADA PAŠVALDĪBA	D-13-40	URBAHS, Aleksandrs	D-13-45
<b>A</b>		-	D-13-41	-	D-13-46
ABLV Bank, AS	D-13-25	KUĻIKOVSKIS, Guntis	D-13-56	<b>V</b>	
ABSOLUTE, SIA	D-13-2	KUPČS, Edgars	D-13-10	VENTSPILS PILSĒTAS DOME	D-12-51
AIMAX, SIA	D-13-42	KURJANA, Jeļena	D-13-47	VOLFAS ENGELMAN, AB	D-12-57
a-la-tea, SIA	D-12-44	<b>L</b>		<b>Y</b>	
AQUA RIGA, SIA	D-13-2	LAPA, Inga	D-13-57	YOON, Byeonguk	D-12-58
ARTA-F, A/S	D-13-21	LIEPIŅA, Inese Īrisa	D-12-54		
ASKETIC, SIA	D-13-33	-	D-13-11		
		-	D-13-7		
<b>B</b>		LUDBORŽA, Karīna	D-13-38	<b>Z</b>	
BALTIC BUSINESS NETWORK, SIA	D-13-3	<b>M</b>		ZAGORNAJA, Marija	D-12-59
BAŠTIKS, Miķelis	D-13-33	MARKĒVIČS, Jurijs	D-13-21	ZANDBERGA, Guna	D-13-36
BINGGRAE CO., LTD	D-12-58	MARTINSONS, Jānis	D-13-35	ZVEJNIEKS, Eduards	D-13-43
BULANOVS, Vladimirs	D-13-45	-	D-13-4		
-	D-13-46	MATUKAITIS, Mantas	D-12-57		
<b>C</b>		<b>N</b>			
CARJOVA, Kristīne	D-13-45	ŅIKITENKO, Agris	D-13-56		
-	D-13-46	<b>O</b>			
<b>D</b>		ORNIŅŠ, Aldis	D-13-41		
DAERS, SIA	D-12-60	OZOLS, Ilmārs	D-13-45		
DĀBOLIŅA, Ieva Nikoleta	D-12-42	-	D-13-46		
DDB WORLDWIDE LATVIA, SIA	D-12-51	<b>P</b>			
DEKSNIS, Einārs	D-13-56	PANOVS, Valerijs	D-12-55		
DIMANTE, Māra	D-13-29	PETROVS, Vladimirs	D-13-45		
-	D-13-31	-	D-13-46		
DITTON ASSETS LP	D-13-20	PIČUKĀNE, Ingrīda	D-13-3		
-	D-13-9	PINKOVSKIS, Rūdolfs	D-13-5		
DRENGERS, Uģis	D-12-46	POČS, Linards	D-13-23		
		PRECO, SIA	D-13-58		
<b>E</b>		<b>R</b>			
EKIMOV, Ivan	D-13-32	RAZDORSKIHS, Vjačeslavs	D-12-45		
ENCE, Enno	D-12-41	RĪGAS PIENA KOMBINĀTS, AS	D-13-27		
EZERIŅŠ, Rinalds	D-13-34	RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE	D-13-45		
		-	D-13-46		
<b>Ē</b>		-	D-13-56		
ĒLERTS, Mārtiņš	D-13-1	-	D-13-59		
		RUDZĪTIS, Jānis	D-13-30		
<b>G</b>		RUNIS, Ģirts	D-13-49		
GAILUMS, Mairis	D-13-22	<b>S</b>			
GIPTERS, Aivars	D-12-39	SHABLOVS, SIA	D-13-19		
-	D-12-48	-	D-13-24		
-	D-12-50	SINKIN, Aleksej			
GODĪGA, Ineta	D-12-56	Valerevich	D-13-27		
GOLDBERGA, Annija	D-12-44	SOKOLOVS, Alvis	D-13-59		
GRUZINSKIS, Jānis	D-12-20	SUKHORUKOV, Oleg	D-13-20		
		-	D-13-9		
<b>J</b>		SULOJEVA, Inese	D-13-40		
JAKOVĻEVS, Aleksandrs	D-13-45	<b>Š</b>			
-	D-13-46	ŠABLOVSKIS, Mārtiņš	D-13-19		
JAROŠENKO, Irina	D-13-42	-	D-13-24		
JUKUMSONS JUKUMNIEKS, Krišjānis	D-13-33	ŠVEIDE, Viktors	D-13-10		
		<b>T</b>			
<b>K</b>		TOMA, Sintija	D-13-22		
KARASEVS, Aldis	D-13-50	TUFETULOV, Renats	D-12-55		
KĀRKLIŅŠ, Kalvis	D-12-52	<b>U</b>			
-	D-12-53	URBAHA, Margarita	D-13-45		
-	D-13-13	-	D-13-46		
-	D-13-14				
-	D-13-39				
-	D-13-6				
KLIMOV, Roman Anatolevich	D-13-27				
KLINTS, Vilnis	D-12-20				
KRUGĻANSKIS, Marks	D-13-20				
-	D-13-9				
KUDIŅŠ, Eduards	D-13-26				

## Dizainparaugu rādītājs pēc Lokarno klasifikācijas klasēm

(ietver 2013. gadā reģistrētos un publicētos dizainparaugus)

(51) LOC klase	(11) Reģistrācijas numurs	(51) LOC klase	(11) Reģistrācijas numurs
1-01	D 15 474		D 15 484
3-01	D 15 464		D 15 489
	D 15 470		D 15 491
	D 15 478		D 15 501
	D 15 492		
	D 15 497		
	D 15 498		
	D 15 499		
	D 15 502		
6-01	D 15 479		
6-04	D 15 495		
6-09	D 15 487		
	D 15 510		
7-01	D 15 493		
8-03	D 15 458		
	D 15 490		
8-10	D 15 511		
9-01	D 15 461		
	D 15 475		
9-03	D 15 463		
	D 15 486		
	D 15 505		
9-05	D 15 455		
	D 15 460		
	D 15 476		
10-06	D 15 508		
11-01	D 15 512		
	D 15 514		
11-02	D 15 459		
11-05	D 15 496		
12-07	D 15 506		
	D 15 507		
12-11	D 15 477		
	D 15 480		
15-05	D 15 516		
19-01	D 15 462		
19-03	D 15 482		
19-07	D 15 472		
	D 15 494		
19-08	D 15 457		
	D 15 465		
	D 15 469		
	D 15 471		
	D 15 481		
	D 15 484		
	D 15 488		
	D 15 489		
	D 15 491		
	D 15 501		
20-02	D 15 485		
20-03	D 15 508		
21-01	D 15 472		
	D 15 503		
25-01	D 15 515		
25-02	D 15 504		
25-03	D 15 483		
	D 15 513		
26-03	D 15 473		
	D 15 500		
	D 15 509		
26-05	D 15 466		
	D 15 467		
	D 15 468		
28-03	D 15 456		
32-00	D 15 459		
	D 15 469		
	D 15 481		

## GROZĪJUMI PATENTU REĢISTRĀ

**Patenta īpašnieka maiņa**  
 (LR Patentu likuma 51. panta 2. daļa)

- (11) **EP 0800539, EP 0804234**  
 (73) PAH Switzerland GmbH, c/o Pfizer AG;  
 Schärenmoosstrasse 99, 8052 Zurich, CH  
 (74) Baiba KRAVALE, „ALFA-PATENTS”; a/k 109, Rīga,  
 LV-1082, LV

*Ieraksts valsts reģistrā:* 10.06.2013

- (11) **EP 1476388, EP 1494952, EP 1551748**  
 (73) Indexator Group AB; Box 522, 922 31 Vindeln, SE  
 (74) Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS; a/k 109, Rīga,  
 LV-1082, LV

*Ieraksts valsts reģistrā:* 04.12.2013

- (11) **EP 1905443**  
 (73) OTSUKA PHARMACEUTICAL FACTORY, INC.;  
 115, Aza Kuguhara Tateiwa, Muya-cho, Naruto-shi,  
 Tokushima 772-8601, JP  
 Hayashibara Co., Ltd.; 675-1, Fujisaki, Naka-ku,  
 Okayama-shi, Okayama, JP  
 The University of Tokyo; 3-1, Hongo 7-chome  
 Bunkyo-ku, Tokyo 113-8654, JP  
 (74) Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS; a/k 109, Rīga,  
 LV-1082, LV

*Ieraksts valsts reģistrā:* 04.12.2013

- (11) **EP 1353700, EP 1541137**  
 (73) Bayer Intellectual Property GmbH;  
 Alfred-Nobel Strasse 10, 40789 Monheim, DE  
 (74) Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra  
 A.SMIRNOV & Co.; a/k 301, Rīga, LV-1050, LV

*Ieraksts valsts reģistrā:* 04.12.2013

- (11) **EP 1957415**  
 (73) BBA BIOTECH SRL;  
 Piazza Ercolea, 11-20122 Milano, IT  
 (74) Valters GENCS, Zvērināta advokāta Valtera Genca  
 birojs; Kr. Valdemāra iela 21, Rīga, LV-1010, LV

*Ieraksts valsts reģistrā:* 04.12.2013

**Patenta īpašnieka nosaukuma maiņa**  
 (LR Patentu likuma 47. panta 3. daļa)

- (11) **EP 0800539, EP 0804234**  
 (73) Zoetis Schweiz GmbH, c/o Pfizer AG;  
 Schärenmoosstrasse 99, 8052 Zurich, CH

*Ieraksts valsts reģistrā:* 11.06.2013

- (11) **EP 1128815, EP 1861073**  
 (73) Takeda Nycomed AS; Drammensveien 852,  
 1372 Asker, NO

*Ieraksts Valsts reģistrā:* 03.12.2013

- (11) **EP 1541137**  
 (73) Bayer Pharma Aktiengesellschaft;  
 Mullerstrasse 178, 13353 Berlin, DE

*Ieraksts Valsts reģistrā:* 04.12.2013

**Patenta īpašnieka adreses maiņa**  
 (LR Patentu likuma 47. panta 3. daļa)

- (11) **EP 1836115**  
 (73) Peter Lisec Privatstiftung; Theobaldgasse 19,  
 1060 Wien, AT

*Ieraksts Valsts reģistrā:* 04.12.2013

## GROZĪJUMI VALSTS DIZAINPARAUGU REĢISTRĀ

**Reģistrāciju atjaunošana**  
 (LR Dizainparaugu likuma 31. pants, Pārejas noteikumu 7. punkts)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

<b>D 10 819</b>	24.11.2013
<b>D 10 821</b>	14.11.2013
<b>D 10 822</b>	05.12.2013
<b>D 10 823</b>	08.12.2013
<b>D 10 836</b>	12.11.2013
<b>D 15 175</b>	22.05.2013
<b>D 15 176</b>	22.05.2013
<b>D 15 177</b>	22.05.2013
<b>D 15 181</b>	22.05.2013
<b>D 15 230</b>	12.11.2013

## GROZĪJUMI VALSTS PREČU ZĪMJU REĢISTRĀ

**Zīmes īpašnieka maiņa**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 25. pants)

- (111) **M 16 652, M 19 522**  
 (732) MANDARINA DUCK s.p.a.;  
 Via Minghetti, 13, Località Cadriano,  
 40057 Granarolo Emilia (Bologna), IT  
 (740) Baiba KRAVALE, Patentu birojs „ALFA-PATENTS”;  
 Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV  
 (580) 04.12.2013

- (111) **M 17 982**  
 (732) STANLEY WORKS (EUROPE) GMBH;  
 Ringstrasse 14, Floor 3 & 4, 8600 Dübendorf, CH  
 (740) Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra „KDK”;  
 Dzērbenes iela 27-206, Rīga, LV-1006, LV  
 (580) 06.12.2013

- (111) **M 31 616, M 39 916**  
 (732) THE ABSOLUT COMPANY AKTIEBOLAG;  
 SE-117 97 Stockholm, SE  
 (740) Anna DENIŅA, Aģentūra „PĒTERSONA  
 PATENTS”; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV  
 (580) 29.11.2013

- (111) **M 32 932**  
 (732) LMT RETAIL & LOGISTICS, SIA; Ropažu iela 6,  
 Rīga, LV-1039, LV  
 (740) Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra „PĒTERSONA  
 PATENTS”; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV  
 (580) 12.12.2013

- (111) **M 33 790**  
 (732) IRE BETEILIGUNGS GMBH; Industriestraße 48,  
 70565 Stuttgart, DE  
 (740) Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra „INTELS LATVIJA”;  
 Akadēmijas laukums 1, Rīga, LV-1050, LV  
 (580) 12.11.2013

- (111) **M 35 324**  
 (732) SAINT-GOBAIN BYGGPRODUKTER AB;  
 Box 415, 191 24 Sollentuna, SE  
 (740) Vladimirs ANOHINS, Aģentūra „TRIA ROBIT”;  
 Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV  
 (580) 03.12.2013



(111)	<b>M 39 721</b>	(111)	<b>M 60 869</b>
(732)	MEDTECH PRODUCTS INC.;	(732)	DEMONA, SIA; Bauskas iela 58-1, Rīga, LV-1004, LV
(740)	660 White Plains Road, Tarrytown, NY 10591, US	(740)	Vladimirs ANOHINS, Aģentūra „TRIA ROBIT”;
(580)	Natālija ANOHINA, Aģentūra „TRIA ROBIT”;	(580)	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV		27.11.2013
	10.12.2013		
(111)	<b>M 41 698</b>	(111)	<b>M 63 211</b>
(732)	VINOS DE LOS HEREDEROS DEL MARQUÉS	(732)	Jevgeņijs GAVRILOVS; Aviācijas iela 7-63, Rīga, LV-1063, LV
(740)	DE RISCAL, S.A.; Calle Torrea 1, 01340 Elciego (Alava), ES	(580)	10.12.2013
(580)	Vladimirs ANOHINS, Aģentūra „TRIA ROBIT”;		
	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV	(111)	<b>M 63 957</b>
	25.11.2013	(732)	MINT FURNITURE, SIA; Anniņmuižas bulv. 80-9, Rīga, LV-1069, LV
		(580)	25.11.2013
(111)	<b>M 42 766</b>	(111)	<b>M 64 748</b>
(732)	ORREFORS KOSTA BODA AB (Reg. Nr. 556519-1300); Stora vägen 96, 360 52 Kosta, SE	(732)	Sergejs GUDZS; Pasta iela 6-15, Ādaži, Ādažu nov., LV-2164, LV
(740)	Līga FJODOROVA, Zvērinātu advokātu birojs „BORENIUS”; Lāčplēša iela 20a, Rīga, LV-1011, LV	(580)	Nauris GRĀVERIS; Raiņa iela 14-4, Skruna, Skrundas nov., LV-3326, LV
(580)	04.12.2013		13.11.2013
		(111)	<b>M 65 037</b>
(111)	<b>M 42 956</b>	(732)	VAASAN OY; Nuijalantie 13, Espoo, 02630, FI
(732)	Augusts SUKUTS; Krišjāņa Valdemāra iela 77-57, Rīga, LV-1013, LV	(740)	Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”;
(580)	21.11.2013	(580)	Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV
			20.11.2013
(111)	<b>M 47 455</b>	(111)	<b>M 65 654, M 65 655, M 65 656</b>
(732)	EDELWEISS GMBH & CO. KG;	(732)	SILVANOLS, SIA; Kurbada iela 2a, Rīga, LV-1009, LV
(740)	Oberstdorfer Strasse 7, 87435 Kempten, DE	(740)	Ieva ŠTĀLA, Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”;
(580)	Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma „LATISS”; Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV	(580)	Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV
	27.11.2013		05.12.2013
		(111)	<b>M 65 919</b>
(111)	<b>M 52 769</b>	(732)	STREET FOOD INC., SIA; Dzirnau iela 37-43, Rīga, LV-1010, LV
(732)	ANSELL LIMITED; Victoria Gardens, Level 3, 678 Victoria Street, 3121 Richmond, Victoria, AU	(740)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”;
(740)	Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma „LATISS”; Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV	(580)	Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV
(580)	05.12.2013		10.12.2013
(111)	<b>M 55 317</b>	<b>Licences</b>	
(732)	OMEGA PHARMA NV; Venecoweg 26, 9810 Nazareth, BE	(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 26. pants)	
(740)	Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra „A.SMIRNOV & CO”;	(111)	<b>M 34 315</b>
(580)	a/k 301, Rīga, LV-1050, LV	(732)	LATVIJAS OLIMPISKĀ KOMITEJA;
	29.11.2013	(791)	Elizabetes iela 49, Rīga, LV-1050, LV
			SIA „OLIMPISKAIS SPORTA CENTRS”;
(111)	<b>M 55 317</b>		Grostonas iela 6b, Rīga, LV-1010, LV
(732)	OMEGA PHARMA INNOVATION & DEVELOPMENT NV; Venecoweg 26, 9810 Nazareth, BE		Licences veids: vienkārša licence
(740)	Aleksandrs SMIRNOVS, Patentu aģentūra „A.SMIRNOV & CO”;		Licences darbības laiks: no 12.11.2013 līdz 31.12.2015
(580)	a/k 301, Rīga, LV-1050, LV		Licences darbības vieta: Latvijas Republikas teritorija
	02.12.2013		(580) 12.11.2013
		(111)	<b>M 38 199</b>
(111)	<b>M 58 318</b>	(732)	LEGIS HOLDING, SIA; Rīgas iela 2A-23, Piņķi, Babītes pag., Babītes nov., LV-2107, LV
(732)	TELEVĪZIJAS KANĀLS PRO100TV, SIA;	(791)	Konsultāciju sabiedrība „Miķelsons & Partneri”;
(580)	Ropažu iela 122 k-12, Rīga, LV-1006, LV		Lāčplēša iela 2-3, Rīga, LV-1010, LV
	25.11.2013		Licences veids: vienkārša licence
			Licences darbības laiks: beztermiņa licence no 26.11.2013, ja vien tā netiek izbeigta Līgumā vai spēkā esošajos LR likumos noteiktajā kārtībā
(111)	<b>M 59 996</b>		Licences darbības vieta: Latvijas Republikas teritorija
(732)	DAKINE, INC. (Delaware corp.);		(580) 26.11.2013
(740)	603 Portway Avenue, Hood River, OR 97031, US		
(580)	Aleksandra FORTŪNA, „FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra” SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV		
	13.11.2013		

**Zīmes īpašnieka nosaukuma maiņa**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111)	<b>M 12 073</b>
(732)	MANPOWERGROUP INC.; 100 Manpower Place, Milwaukee, WI, US
(580)	20.11.2013
(111)	<b>M 18 133</b>
(732)	INDUSTRIA COLOMBIANA DE CAFE S.A.S.; Calle 8 Sur No. 50-67, Medellin, CO
(580)	10.12.2013
(111)	<b>M 18 865</b>
(732)	SOLVAY ACETOW GMBH; Engesserstrasse 8, D-79108 Freiburg im Breisgau, DE
(580)	27.11.2013
(111)	<b>M 18 873</b>
(732)	MC PROJECTS B.V. MAASTRICHT, succursale de Granges-Paccot; Route Louis-Braille 10, CH-1763 Granges-Paccot (Fribourg), CH
(580)	15.11.2013
(111)	<b>M 34 669, M 34 670, M 35 791, M 35 795</b>
(732)	MC PROJECTS B.V. MAASTRICHT, succursale de Granges-Paccot; Route Louis-Braille 10, CH-1763 Granges-Paccot (Fribourg), CH
(580)	15.11.2013
(111)	<b>M 38 186</b>
(732)	CLOETTA ITALIA S.R.L.; Via Milano 16, Cremona, IT
(580)	20.11.2013
(111)	<b>M 41 516</b>
(732)	LUCASFILM LTD. LLC (California LLC); One Letterman Drive, Bldg. B, San Francisco, CA 94129, US
(580)	02.12.2013
(111)	<b>M 45 740, M 45 742</b>
(732)	LUCASFILM ENTERTAINMENT COMPANY LTD. LLC (California LLC); One Letterman Drive, Bldg. B, San Francisco, CA 94129, US
(580)	02.12.2013
(111)	<b>M 53 093</b>
(732)	BERENDSEN TEKSTILA SERVISS, AS; Bukaišu iela 3a, Rīga, LV-1004, LV
(580)	15.11.2013
(111)	<b>M 54 726, M 54 727, M 54 728, M 54 730</b>
(732)	PREMIA TALLINNA KÜLMHOONE AS; Betooni 4, 11415 Tallinn, EE
(580)	11.11.2013
(111)	<b>M 55 536</b>
(732)	PRALO, SIA; Dzelzavas iela 120g, Rīga, LV-1021, LV
(580)	10.12.2013

**Zīmes īpašnieka adreses maiņa**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111)	<b>M 18 900</b>
(732)	JOCKEY INTERNATIONAL, INC.; 2300 60th Street, P.O. Box 1417, Kenosha, Wisconsin 53141-1417, US
(580)	12.11.2013
(111)	<b>M 33 687</b>
(732)	MUNDIPHARMA AG; St. Alban-Rheinweg 74, 4020 Basel, CH
(580)	05.12.2013
(111)	<b>M 35 274</b>
(732)	SALAMANDER GMBH; Zur Schlenkhecke 4, 40764 Langenfeld, DE
(580)	15.11.2013
(111)	<b>M 35 904</b>
(732)	EMINENT LUGGAGE CORP.; No. 40, Chung-Shan 9th Street, Kuei-Jen District, Tainan City, TW
(580)	02.12.2013
(111)	<b>M 53 415</b>
(732)	RECIPE PLUS, AS; Mūkusalas iela 41, Rīga, LV-1004, LV
(580)	20.11.2013
(111)	<b>M 53 942</b>
(732)	LĀTVIJAS TIRGOTĀJU KOOPERĀCIJA „AIBE”, SIA; „Ciedri”, Lielvārži, Ķekavas pag., Ķekavas nov., LV-2123, LV
(580)	28.11.2013
(111)	<b>M 53 943</b>
(732)	LĀTVIJAS TIRGOTĀJU KOOPERĀCIJA „AIBE”, SIA; „Ciedri”, Lielvārži, Ķekavas pag., Ķekavas nov., LV-2123, LV
(580)	19.11.2013
(111)	<b>M 54 228, M 54 372</b>
(732)	SPIRITS PRODUCT INTERNATIONAL INTELLECTUAL PROPERTY B.V.; 3, rue du Fort Rheinsheim, L-2419 Luxembourg, LU
(580)	26.11.2013
(111)	<b>M 54 452</b>
(732)	AUTOMATIC SWITCH COMPANY; 50-60 Hanover Road, Florham Park, NJ, 07932, US
(580)	09.12.2013
(111)	<b>M 54 493</b>
(732)	METSÄ TISSUE OYJ; Revontulenpuisto 2, FI-02100 Espoo, FI
(580)	15.11.2013
(111)	<b>M 54 828</b>
(732)	WALLY YACHTS S.A.; 5, Avenue Gaston Diderich, L-1420 Luxembourg, LU
(580)	04.12.2013

**Reģistrāciju atjaunošana**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 21. panta 2. daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

M 16 273	27.05.2013
M 16 652	04.06.2013
M 16 866	14.06.2013
M 18 133	21.06.2013
M 18 762	10.12.2013
M 18 763	10.12.2013
M 18 764	13.12.2013
M 18 765	13.12.2013
M 18 766	14.12.2013
M 18 798	29.12.2013
M 18 799	29.12.2013
M 18 800	29.12.2013
M 18 802	29.12.2013
M 18 865	02.12.2013
M 18 866	03.12.2013
M 18 867	06.12.2013
M 18 868	06.12.2013
M 18 873	13.12.2013
M 18 894	29.12.2013
M 18 897	29.12.2013
M 18 898	29.12.2013
M 18 900	29.12.2013
M 18 906	29.12.2013
M 18 907	30.12.2013
M 18 912	31.12.2013
M 19 012	07.12.2013
M 19 139	29.11.2013
M 19 143	29.12.2013
M 19 209	07.12.2013
M 19 273	20.12.2013
M 19 274	20.12.2013
M 19 275	20.12.2013
M 19 276	20.12.2013
M 19 279	20.12.2013
M 19 280	20.12.2013
M 19 281	20.12.2013
M 19 289	29.12.2013
M 19 344	20.12.2013
M 19 348	29.12.2013
M 19 351	29.12.2013
M 19 475	28.12.2013
M 19 484	27.12.2013
M 19 486	27.12.2013
M 19 487	27.12.2013
M 19 522	04.06.2013
M 30 555	07.12.2013
M 30 556	17.12.2013
M 30 588	29.12.2013
M 32 932	11.06.2013
M 33 687	14.12.2013
M 33 689	14.12.2013
M 33 691	14.12.2013
M 33 693	14.12.2013
M 33 694	20.12.2013
M 33 695	20.12.2013
M 33 790	16.07.2013
M 34 246	01.12.2013
M 34 261	02.12.2013
M 34 269	02.12.2013
M 34 278	07.12.2013
M 34 280	08.12.2013
M 34 281	08.12.2013
M 34 287	10.12.2013
M 34 288	10.12.2013
M 34 289	10.12.2013
M 34 299	14.12.2013
M 34 300	14.12.2013

M 34 305	17.12.2013
M 34 306	17.12.2013
M 34 308	17.12.2013
M 34 312	20.12.2013
M 34 314	20.12.2013
M 34 315	21.12.2013
M 34 316	21.12.2013
M 34 318	21.12.2013
M 34 329	28.12.2013
M 34 331	28.12.2013
M 34 352	28.12.2013
M 34 777	03.12.2013
M 34 779	30.12.2013
M 34 798	21.12.2013
M 34 801	28.12.2013
M 34 811	31.12.2013
M 34 812	31.12.2013
M 34 814	31.12.2013
M 34 815	31.12.2013
M 34 816	31.12.2013
M 34 817	31.12.2013
M 34 818	31.12.2013
M 35 023	21.12.2013
M 35 025	28.12.2013
M 35 070	03.12.2013
M 35 074	31.12.2013
M 35 175	27.12.2013
M 35 176	27.12.2013
M 35 177	27.12.2013
M 35 956	14.12.2013
M 35 957	14.12.2013
M 36 737	28.12.2013
M 37 415	30.12.2013
M 53 093	28.11.2013
M 53 415	28.11.2013
M 53 536	01.12.2013
M 53 876	01.10.2013
M 53 942	21.11.2013
M 53 943	21.11.2013
M 54 110	04.12.2013
M 54 111	04.12.2013
M 54 157	05.12.2013
M 54 165	19.12.2013
M 54 167	23.12.2013
M 54 211	04.12.2013
M 54 212	05.12.2013
M 54 223	07.11.2013
M 54 228	28.11.2013
M 54 234	10.12.2013
M 54 274	09.12.2013
M 54 275	09.12.2013
M 54 276	12.12.2013
M 54 372	04.12.2013
M 54 379	22.12.2013
M 54 541	12.12.2013
M 54 542	12.12.2013
M 54 544	12.12.2013
M 54 545	17.12.2013
M 54 546	17.12.2013
M 54 549	29.12.2013
M 54 665	04.12.2013
M 54 668	17.12.2013
M 54 828	08.12.2013
M 54 829	09.12.2013
M 54 832	23.12.2013
M 54 914	29.12.2013
M 55 000	04.12.2013
M 55 724	22.12.2013

**Zīmes reģistrācijas dzēšana**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 19. panta 6. daļa)

(111)	<b>M 62 755</b>
(141)	20.11.2010
(580)	04.12.2013

(111)	<b>M 63 180</b>
(141)	20.03.2011
(580)	13.11.2013

**Zīmes reģistrācijas izslēgšana no Reģistra**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 33. panta 1. daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums

M 15 788	04.05.2013
M 15 792	05.05.2013
M 15 795	06.05.2013
M 15 797	06.05.2013
M 15 798	06.05.2013
M 15 802	06.05.2013
M 15 803	07.05.2013
M 15 810	10.05.2013
M 15 816	10.05.2013
M 15 931	06.05.2013
M 15 933	06.05.2013
M 15 934	06.05.2013
M 15 941	06.05.2013
M 15 946	06.05.2013
M 15 951	06.05.2013
M 15 952	06.05.2013
M 15 953	06.05.2013
M 15 956	06.05.2013
M 15 957	06.05.2013
M 15 959	06.05.2013
M 15 960	06.05.2013
M 15 961	06.05.2013
M 15 963	06.05.2013
M 15 964	10.05.2013
M 15 965	10.05.2013
M 15 967	10.05.2013
M 15 969	10.05.2013
M 15 972	10.05.2013
M 15 980	10.05.2013
M 15 981	10.05.2013
M 16 006	10.05.2013
M 16 010	10.05.2013
M 16 014	10.05.2013
M 16 019	10.05.2013
M 16 022	11.05.2013
M 16 029	11.05.2013
M 16 037	11.05.2013
M 16 039	13.05.2013
M 16 040	13.05.2013
M 16 042	13.05.2013
M 16 043	13.05.2013
M 16 045	13.05.2013
M 16 048	13.05.2013
M 16 051	13.05.2013
M 16 054	13.05.2013
M 16 056	14.05.2013
M 16 057	14.05.2013
M 16 171	06.05.2013
M 16 173	06.05.2013
M 16 175	06.05.2013
M 16 180	06.05.2013
M 16 182	06.05.2013
M 16 185	06.05.2013

M 16 188	06.05.2013
M 16 189	06.05.2013
M 16 197	06.05.2013
M 16 201	10.05.2013
M 16 203	10.05.2013
M 16 206	11.05.2013
M 16 207	11.05.2013
M 16 208	11.05.2013
M 16 209	11.05.2013
M 16 215	14.05.2013
M 16 216	14.05.2013
M 16 217	14.05.2013
M 16 223	14.05.2013
M 16 225	14.05.2013
M 16 226	17.05.2013
M 16 232	18.05.2013
M 16 236	20.05.2013
M 16 238	21.05.2013
M 16 243	24.05.2013
M 16 251	24.05.2013
M 16 254	24.05.2013
M 16 255	24.05.2013
M 16 257	25.05.2013
M 16 258	26.05.2013
M 16 259	26.05.2013
M 16 260	26.05.2013
M 16 265	27.05.2013
M 16 266	27.05.2013
M 16 278	28.05.2013
M 16 280	28.05.2013
M 16 343	06.05.2013
M 16 344	06.05.2013
M 16 356	14.05.2013
M 16 357	14.05.2013
M 16 358	14.05.2013
M 16 361	17.05.2013
M 16 362	17.05.2013
M 16 365	18.05.2013
M 16 370	18.05.2013
M 16 372	18.05.2013
M 16 373	18.05.2013
M 16 383	25.05.2013
M 16 385	26.05.2013
M 16 386	26.05.2013
M 16 393	28.05.2013
M 16 631	11.05.2013
M 16 637	27.05.2013
M 16 819	06.05.2013
M 17 257	06.05.2013
M 17 259	10.05.2013
M 17 260	17.05.2013
M 17 262	17.05.2013
M 17 448	10.05.2013
M 17 453	24.05.2013
M 17 455	31.05.2013
M 17 722	10.05.2013
M 17 724	10.05.2013
M 17 726	11.05.2013
M 19 238	14.05.2013
M 19 439	13.05.2013
M 19 444	13.05.2013
M 19 446	13.05.2013
M 19 447	13.05.2013
M 19 489	03.05.2013
M 19 490	03.05.2013
M 19 503	11.05.2013
M 32 182	04.05.2013
M 32 192	11.05.2013
M 32 227	05.05.2013
M 32 303	11.05.2013
M 32 304	11.05.2013
M 32 306	27.05.2013
M 32 360	14.05.2013
M 32 361	17.05.2013



M 32 362 21.05.2013  
 M 32 363 25.05.2013  
 M 32 364 27.05.2013  
 M 32 428 06.05.2013  
 M 32 429 06.05.2013  
 M 32 434 06.05.2013  
 M 32 437 06.05.2013  
 M 32 439 06.05.2013  
 M 32 446 24.05.2013  
 M 32 486 05.05.2013  
 M 32 488 07.05.2013  
 M 32 489 11.05.2013  
 M 32 495 21.05.2013  
 M 32 498 25.05.2013  
 M 32 530 04.05.2013  
 M 32 531 04.05.2013  
 M 32 532 04.05.2013  
 M 32 536 11.05.2013  
 M 32 567 06.05.2013  
 M 32 568 07.05.2013  
 M 32 579 28.05.2013  
 M 32 623 06.05.2013  
 M 32 837 04.05.2013  
 M 32 848 06.05.2013  
 M 32 854 11.05.2013  
 M 32 857 11.05.2013  
 M 32 860 11.05.2013  
 M 32 861 11.05.2013  
 M 32 862 11.05.2013  
 M 32 866 11.05.2013  
 M 32 867 11.05.2013  
 M 32 870 11.05.2013  
 M 32 876 13.05.2013  
 M 32 877 13.05.2013  
 M 32 884 14.05.2013  
 M 32 885 14.05.2013  
 M 32 896 21.05.2013  
 M 32 897 21.05.2013  
 M 33 549 28.05.2013  
 M 34 486 05.05.2013  
 M 37 170 19.05.2013  
 M 37 619 21.05.2013  
 M 38 373 11.05.2013  
 M 51 989 15.05.2013  
 M 52 016 02.05.2013  
 M 52 226 22.05.2013  
 M 52 227 27.05.2013  
 M 52 229 27.05.2013  
 M 52 286 20.05.2013  
 M 52 499 08.05.2013  
 M 52 756 16.05.2013  
 M 52 822 02.05.2013  
 M 52 827 06.05.2013  
 M 52 831 09.05.2013  
 M 52 833 12.05.2013  
 M 52 864 06.05.2013  
 M 52 866 12.05.2013  
 M 52 868 12.05.2013  
 M 52 869 13.05.2013  
 M 52 870 13.05.2013  
 M 52 941 02.05.2013  
 M 52 943 05.05.2013  
 M 52 945 12.05.2013  
 M 52 950 15.05.2013  
 M 52 951 16.05.2013  
 M 52 955 19.05.2013  
 M 52 956 19.05.2013  
 M 52 989 05.05.2013  
 M 52 992 13.05.2013  
 M 52 993 15.05.2013  
 M 52 994 16.05.2013  
 M 53 063 19.05.2013  
 M 53 066 19.05.2013  
 M 53 068 22.05.2013

M 53 070 28.05.2013  
 M 53 071 28.05.2013  
 M 53 098 26.05.2013  
 M 53 101 26.05.2013  
 M 53 103 26.05.2013  
 M 53 105 30.05.2013  
 M 53 111 26.05.2013  
 M 53 112 30.05.2013  
 M 53 119 05.05.2013  
 M 53 120 05.05.2013  
 M 53 121 05.05.2013  
 M 53 124 08.05.2013  
 M 53 125 23.05.2013  
 M 53 135 23.05.2013  
 M 53 166 07.05.2013  
 M 53 172 21.05.2013  
 M 53 173 21.05.2013  
 M 53 174 26.05.2013  
 M 53 175 28.05.2013  
 M 53 176 29.05.2013  
 M 53 250 14.05.2013  
 M 53 256 27.05.2013  
 M 53 269 15.05.2013  
 M 53 270 15.05.2013  
 M 53 271 15.05.2013  
 M 53 272 15.05.2013  
 M 53 302 05.05.2013  
 M 53 320 07.05.2013  
 M 53 323 21.05.2013  
 M 53 366 22.05.2013  
 M 53 434 27.05.2013  
 M 53 483 16.05.2013  
 M 53 525 27.05.2013  
 M 53 673 28.05.2013  
 M 53 674 29.05.2013  
 M 53 675 29.05.2013  
 M 53 976 20.05.2013  
 M 54 046 02.05.2013  
 M 54 060 07.05.2013  
 M 54 086 12.05.2013  
 M 54 087 16.05.2013

---

**Grozījumi preču sarakstā**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111) **M 66 331**  
 (511) 35  
 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; reklāmas aģentūru pakalpojumi; sabiedriskās domas aptaujas; konsultācijas darījumu vadīšanas un organizēšanas jomā; informācijas apkopošana datoru datu bāzēs; datoru datņu pārvaldība; laikrakstu abonēšana trešajām personām; reklāmas izplatīšana ar laikrakstu un radio starpniecību; informācijas sistematizēšana datoru datu bāzēs  
 36, 41  
*līdzšinējā redakcija*  
 (580) 14.11.2013

---

**Grozījumi preču sarakstā**

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 19. panta 6. daļa)

(111) **M 63 593**  
 (511) 16  
*ar 20.07.2011:*  
 iespiedprodukcija, kas saistīta ar veselības un skaistumkopšanas pakalpojumiem; fotogrāfijas;

rakstāmlietas; līmvielas kancelejas vai mājturības vajadzībām; materiāli māksliniekiem; otas; rakstāmmašīnas un kancelejas preces (izņemot mēbeles); mācību un uzskates līdzekļi (izņemot aparāturu); iespieburti; klišejas  
18, 25, 28, 30, 32, 33, 34, 41, 43, 44

*līdzšinējā redakcija*

(580) 10.12.2013

#### Zīmes elementu maiņa

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111) **M 33 113**

(540)



(580) 06.12.2013

#### Labojumi

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111) **M 39 721**

(540) MASSENGILL

(580) 10.12.2013

(111) **M 66 814**

(511) 7, 9

*līdzšinējā redakcija*

11

apgaismošanas ierīces un aparāti; apsildes ierīces un aparāti, kas ir minēto, šajā klasē ietvertu preču daļas; tvaika ražošanas, ēdiena termiskās apstrādes, dzesēšanas, žāvēšanas, vēdināšanas, ūdensapgādes ierīces un aparāti; lampas; ielu apgaismošanas laternas; apgaismošanas armatūra un instalācijas; spuldžu kolbas; elektriskās lampas; projektoru lampas; griestu lampas; spuldzīšu virtenes; gaismas caurules apgaismošanai; lukturīši; apgaismošanas ierīces transporta līdzekļiem; spuldzes; drošības lampas; lampu prožektoru; automobiļu lukturi; lampu atstarotāji; gaismas izkliedētāji; kabatas lukturīši; transporta līdzekļu gaisa kondicionēšanas iekārtas; ventilatori (gaisa kondicionēšanai); ventilatori (gaisa kondicionēšanas iekārtu daļas); siltummaiņi; gaisa kondicionēšanas aparāti; gaisa kondicionēšanas iekārtas; ventilācijas iekārtas un aparāti; dzesēšanas ierīces un iekārtas; gaisa attīrīšanas aparāti un ierīces; velkmes skapji; gaisa recirkulācijas sildītāji, kas ir minēto, šajā klasē ietvertu preču daļas; gaisa plūsmas žāvēšanas ierīces; gaisa filtrēšanas iekārtas; atūdeņošanas aparāti; žāvēšanas aparāti un iekārtas; siltumregulatori; līdzstrāvas motori gaisa kondicionēšanai; soļa motori gaisa kondicionēšanai; līdzstrāvas ventilatori gaisa kondicionēšanai; maiņstrāvas ventilatori gaisa kondicionēšanai; draiveri gaismu emitējošo diodžu (LED) apgaismes iekārtām

(580) 03.12.2013

**Pamanīto kļūdu labojums Vēstnesī 11/2013**

---

1776. lappuse, Patenta īpašnieka nosaukuma maiņa, EP 1315420 publikācijā

**jābūt:**

(11) **EP 1315420**

(73) BASF SE; 67056 Ludwigshafen, DE

*Ieraksts valsts reģistrā:* 14.11.2013

---

---

**Patentpilnvaroto saraksts****1. Armīns PĒTERSONS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”  
Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010  
a/k 61, Rīga, LV-1010  
Tālrunis: 67 32 46 95 vai 67 32 54 37  
Fakss: 67 83 00 30  
E-pasts: <petpat@petpat.lv> vai <armins@petpat.lv>  
Internets: <http://www.petpat.lv>

**2. Valentīna SERGEJEVA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

a/k 16, Rīga, LV-1083  
Tālrunis/Fakss: 67 47 11 85  
E-pasts: <latip@zb.lv> vai <sergejeva@bluewin.ch>

**3. Raimonds L. SLAIÐIŅŠ***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „LAWIN”  
Elizabetes iela 15, Rīga, LV-1010  
Tālrunis: 67 81 48 48  
Fakss: 67 81 48 49  
E-pasts: <riga@lawin.lv> vai  
<raimonds.slaidins@lawin.lv>  
Internets: <http://www.lawin.lv>

**4. Guntis KAZAINIS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu un preču zīmju aģentūra „GUNTIS KAZAINIS”  
Mālkalnes prospekts 29-59  
Ogre, LV-5003  
Tālrunis: 65 04 48 53  
Fakss: 65 04 48 53

**5. Jānis LOZE***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Zvērinātu advokātu birojs „LOZE & PARTNERI”  
Kr. Valdemāra iela 33, Rīga, LV-1010  
Tālrunis: 67 74 44 44  
Fakss: 67 54 44 44  
E-pasts: <janis.loze@loze.lv>  
Internets: <http://www.loze.lv>

**6. Vitālijs VERIGINS***Preču zīmes*

a/k 81, Rīga, LV-1073  
Tālrunis: 67 24 18 73

**7. Gunārs ROTBERGS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

„FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra”, SIA  
a/k 98, Rīga, LV-1050  
Tālrunis: 67 22 65 50 vai 67 22 34 50  
Fakss: 67 82 01 07 vai 67 22 65 06  
E-pasts: <foral@foral.lv>  
Internets: <http://www.foral.lv>

**8. Vladimirs ANOHINS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis: 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss: 67 32 56 00  
E-pasts: <info@triarobit.com>

**9. Natālija ANOHINA***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis: 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss: 67 32 56 00  
E-pasts: <info@triarobit.com>

**11. Ņina DOLGICERE***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu aģentūra „KDK”  
Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006  
a/k 185, Rīga, LV-1084  
Tālrunis: 67 55 25 30 vai 67 54 51 30  
Fakss: 67 55 07 00 vai 67 55 20 66  
E-pasts: <kdk@edi.lv>  
Internets: <http://www.kdk.lv>

**12. Aleksandrs SMIRNOVS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu aģentūra „A. SMIRNOV & CO”  
a/k 301, Rīga, LV-1050  
Tālrunis: 67 45 10 85  
Fakss: 67 45 10 85  
E-pasts: <smirnov@junik.lv>

**13. Ināra ŠMĪDEBERGA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „INTELS Latvija”  
Akadēmijas laukums 1-807, Rīga, LV-1050  
Tālrunis: 67 20 53 82 vai 29 25 04 29  
Fakss: 67 20 53 81  
E-pasts: <intels@parks.lv>  
Internets: <http://www.intels.lv>

**14. Marks KUZĀNS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Stirnu iela 39-9, Rīga, LV-1084  
Tālrunis: 29 40 41 89  
E-pasts: <pat.lic@inbox.lv>

**15. Lūcija KUZJUKĒVIČA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”  
Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010  
a/k 61, Rīga, LV-1010  
Tālrunis: 67 32 46 95 vai 67 32 54 37  
Fakss: 67 83 00 30  
E-pasts: <petpat@petpat.lv> vai <lucija@petpat.lv>  
Internets: <http://www.petpat.lv>

**16. Valentīns CVETKOVŠ***Patenti un preču zīmes*

Patentu aģentūra „KDK”  
Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006  
a/k 185, Rīga, LV-1084  
Tālrunis: 67 55 25 30 vai 67 54 51 30  
Fakss: 67 55 07 00 vai 67 55 20 66  
E-pasts: <kdk@edi.lv>  
Internets: <http://www.kdk.lv>

**17. Olga ŽUKOVSKA***Preču zīmes*

Aģentūra „ATM LEGE ARTIS”  
a/k 93, Rīga, LV-1047  
Tālrunis: 67 35 44 77 vai 67 35 52 78  
Fakss: 67 62 22 47



**18. Arnolds ZVIRGZDS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

„Agency ARNOPATENTS”, SIA  
Brīvības iela 162-17, Rīga, LV-1012  
Tālr. 29 54 74 37  
Tālr./Fakss 67 37 15 83  
E-pasts <info@arnopatents.lv>  
Internets <http://www.arnopatents.lv>

**20. Inese POĻAKA***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vilandes iela 5, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālr. 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss 67 32 56 00  
E-pasts <info@triarobit.com>

**21. Romualds VONSOVIČS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Zvērinātu advokātu birojs „LEJIŅŠ,  
TORGĀNS un VONSOVIČS”  
Kr. Valdemāra iela 20, Rīga, LV-1010  
Tālr. 67 24 06 89  
Fakss 67 82 15 24  
E-pasts <romualds.vonsovics@lt-v.lv>

**22. Larisa MOSKAĻENKO***Preču zīmes*

Dzirnavu iela 113-23, Rīga, LV-1011  
a/k 170, Rīga, LV-1011  
Tālr. 67 28 80 03

**23. Ludmila IVANOVA***Patenti un preču zīmes*

PATENTU AĢENTŪRA TESIO  
Kronvalda bulvāris 3, Rīga, LV-1010  
Tālr. 67 21 40 19  
Fakss 67 21 40 26  
E-pasts <patent@tesioapat.lv>

**24. Svetlana MAKEJEVA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Intelektuālā īpašuma juridiskā firma „LATISS”  
Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011  
Tālr. 67 35 66 39  
Fakss 67 32 43 54  
E-pasts <latiss@latiss.eu>  
Internets <http://www.latiss.eu>

**25. Ineta KRODERE-IMŠA***Preču zīmes un dizainparaugi*

Zvērinātu advokātu birojs „KRODERE & JUDINSKA”  
Dzirnavu iela 60-32, Rīga, LV-1050  
Tālr. 67 24 06 98  
Fakss 67 24 06 60  
E-pasts <ineta.krodere@k-j.lv>  
Internets <http://www.k-j.lv>

**26. Olīta LŪKA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „LUDIŅŠ UN KRASTIŅŠ”  
Brīvības iela 52-1, Rīga, LV-1011  
Tālr. 67 50 22 50 vai 67 50 22 58  
Fakss 67 50 22 51  
E-pasts <ludins@latnet.lv>

**27. Māra UZULĒNA***Preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu birojs „ALFA-PATENTS”  
Virānes iela 2, Rīga, LV-1035  
a/k 109, Rīga, LV-1082  
Tālr. 67 17 62 51  
Fakss 67 17 62 52 vai 67 24 70 37  
E-pasts <info@alfa-patents.lv>  
Internets <http://www.alfa-patents.lv>

**28. Valters GENCS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Zvērināta advokāta Valtera GENCA birojs  
Kr. Valdemāra iela 21, 3. stāvs, Rīga, LV-1010  
Tālr. 67 24 00 90  
Fakss 67 24 00 91  
E-pasts <valters.gencs@gencs.lv>  
Internets <http://www.gencs.lv>

**29. Helēna STANIŠLAVSKA***Preču zīmes*

Kr. Valdemāra iela 145/5-83, Rīga, LV-1013  
Tālr./Fakss 67 27 56 03  
Mob. tālr. 27 85 10 33  
E-pasts [helena@com.latnet.lv](mailto:helena@com.latnet.lv)

**30. Aleksandra FORTŪNA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

„FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra”, SIA  
a/k 98, Rīga, LV-1050  
Tālr. 67 22 65 50 vai 67 22 34 50  
Fakss 67 82 01 07 vai 67 22 65 06  
E-pasts <foral@foral.lv>  
Internets <http://www.foral.lv>

**31. Edvards LAVRINOVIČS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Kalnciema iela 32A-9A, Rīga, LV-1046  
Tālr. 65 14 12 21 vai 26 38 65 80  
E-pasts <jobs@apollo.lv>

**32. Rīta MEDVIDA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu birojs „ALFA-PATENTS”  
Virānes iela 2, Rīga, LV-1073  
a/k 109, Rīga, LV-1082  
Tālr. 67 17 62 51  
Fakss 67 17 62 52 vai 67 24 70 37  
E-pasts <info@alfa-patents.lv>  
Internets <http://www.alfa-patents.lv>

**33. Dace SILAVA-TOMSONE***Dizainparaugi*

Zvērinātu advokātu birojs „RAIDLA LEJINS & NORCOUS”  
Kr. Valdemāra 20, Rīga, LV-1010  
Tālr. 67 24 06 89  
Fakss 67 82 15 24  
E-pasts <dace.silava-tomsone@rln.lv>

**34. Brigita PĒTERSONE***Preču zīmes*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”  
Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010  
a/k 61, Rīga, LV-1010  
Tālr. 67 32 46 95 vai 67 32 54 37  
Fakss 67 83 00 30  
E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <brigita@petpat.lv>  
Internets <http://www.petpat.lv>

**35. Ilze VEISA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu un preču zīmju aģentūra „GUNTIS KAZAINIS”

Mālkalnes prospekts 29-59, Ogre, LV-5003

Tālrunis 65 04 48 53Fakss 65 04 48 53**36. Maruta VĪTIŅA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”

Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010

a/k 22, Rīga, LV-1010

Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00Fakss 67 32 56 00E-pasts <info@triarobit.com>**37. Voldemārs OSMANS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”

Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010

a/k 22, Rīga, LV-1010

Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00Fakss 67 32 56 00E-pasts <info@triarobit.com>**38. Mārcis KRŪMIŅŠ***Preču zīmes*

Advokātu birojs „SKUDRA &amp; ŪDRIS”

Marijas iela 13/III, Rīga, LV-1050

Tālrunis 67 81 20 78Fakss 67 82 81 71E-pasts <marcis.krumins@su.lv>**39. Jevgeņijs FORTŪNA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

„FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra”, SIA

a/k 98, Rīga, LV-1050

Tālrunis 67 22 34 50 vai 67 22 65 50Fakss 67 82 01 07 vai 67 22 65 06E-pasts <foral@foral.lv>Internets <http://www.foral.lv>**40. Larisa FORTŪNA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

„FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra”, SIA

a/k 98, Rīga, LV-1050

Tālrunis 67 22 34 50Fakss 67 82 01 07E-pasts <foral@foral.lv>Internets <http://www.foral.lv>**41. Ieva JUDINSKA-BANDENIECE***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „KRODERE &amp; JUDINSKA”

Dzirnavu iela 60-32, Rīga, LV-1050

Tālrunis 67 24 06 98Fakss 67 24 06 60E-pasts <ieva.judinska@k-j.lv>Internets <http://www.k-j.lv>**42. Inese KALNĀJA-ZELČA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „Eversheds Bitāns”

Lāčplēša iela 20a, Rīga, LV-1011

Tālrunis 67 50 45 70 vai 67 28 01 02E-pasts <inese.kalnaja-zelca@evershedsbitans.com>Internets <http://www.evershedsbitans.com>**43. Rūta OLMANE***Preču zīmes un dizainparaugi*

a/k 49, Rīga, LV-1006

Tālrunis 29 22 96 83Fakss 67 80 91 34E-pasts <mail@olmane.lv>Internets <http://www.olmane.lv>**44. Inese LŪKINA***Preču zīmes*

Berga Bazārs, Marijas iela 13-40, Rīga, LV-1050

Tālrunis 29 48 68 61E-pasts <inese.lukina@gmail.com>**45. Sandra KUMAČEVA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”

Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010

a/k 61, Rīga, LV-1010

Tālrunis 67 32 46 95 vai 67 32 54 37Fakss 67 83 00 30E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <sandra@petpat.lv>Internets <http://www.petpat.lv>**46. Māra ROZENBLATE***Patenti**Pašlaik nepraktizē***47. Anda STUDĀNE***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „RUSANOVŠ, RODE, BUŠŠ”

Brīvības iela 103-24, Rīga, LV-1001

Tālrunis 67 27 32 67 vai 29 41 15 66E-pasts <studane@rrb-c.lv>**48. Žanna ŠMUĻJĀNE***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”

Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010

a/k 22, Rīga, LV-1010

Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00Fakss 67 32 56 00E-pasts <info@triarobit.com>**49. Brigita TĒRAUDA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „KRODERE &amp; JUDINSKA”

Dzirnavu iela 60-32, Rīga, LV-1050

Tālrunis 67 24 06 98Fakss 67 24 06 60E-pasts <brigita.terauda@k-j.lv>**50. Olga VAHATOVA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”

Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010

a/k 22, Rīga, LV-1010

Tālrunis 67 32 03 00 vai 26 05 35 52Fakss 67 32 56 00E-pasts <info@triarobit.com>**51. Lauma BUKA***Preču zīmes un dizainparaugi**Prakse uz laiku pārtraukta, sākot ar 09.01.2006*

**52. Tatjana KREICBERGA***Preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu birojs „ALFA-PATENTS”  
Virānes iela 2, Rīga, LV-1035  
a/k 109, Rīga, LV-1082  
Tālrunis 67 17 62 51  
Fakss 67 17 62 52 vai 67 24 70 37  
E-pasts <info@alfa-patents.lv>  
Internets <http://www.alfa-patents.lv>

**53. Ilga GUDRENIKA-KREBA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „LAWIN”  
Elizabetes iela 15, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 81 48 48  
Fakss 67 81 48 49  
E-pasts <ilga.gudrenika-krebs@lawin.lv>  
Internets <http://www.lawin.lv>

**54. Ingrīda KARIŅA-BĒRZIŅA***Preču zīmes un dizainparaugi*

Zvērinātu advokātu birojs „RAIDLA LEJINS & NORCOUS”  
Kr. Valdemāra 20, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 24 06 89 vai 28 62 48 42  
Fakss 67 82 15 24  
E-pasts <karina-berzina@rln.lv>

**55. Inese LĪBIŅA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „LIEPA, SKOPIŅA / BORENIUS”  
Lāčplēša iela 20a, Rīga, LV-1011  
Tālrunis 67 20 18 00  
Fakss 67 20 18 01  
E-pasts <inese.libina@borenius.lv>  
Internets <http://www.borenius.lv>

**56. Linda MAZURE***Preču zīmes un dizainparaugi*

Ak. M. Keldiša iela 28-65, Rīga, LV-1021  
E-pasts <lindamazure@one.lv>

**57. Solveiga BIEZĀ***Preču zīmes un dizainparaugi*

*Prakse uz laiku pārtraukta, sākot ar 01.05.2011*

**58. Marija BOICOVA***Patenti un preču zīmes*

Katrīnas dambis 24a-11, Rīga, LV-1045  
Tālrunis (+32) 486 271 107  
E-pasts <maria.boicova@gmail.com>

**59. Anda BRIEDE***Preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „INTELS Latvija”  
Akadēmijas laukums 1-807, Rīga, LV-1050  
Tālrunis 67 20 53 82 vai 26 30 68 62  
Fakss 67 20 53 81  
E-pasts <intels@parks.lv>  
Internets <http://www.intels.lv>

**60. Genadijs BUKATOVŠ***Preču zīmes*

Krūzes iela 49-3, Rīga, LV-1002  
Tālrunis 26 85 59 90  
E-pasts <transponse@one.lv>

**61. Silva DROZDOVSKA***Preču zīmes*

„FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra”, SIA  
a/k 98, Rīga, LV-1050  
Tālrunis 67 22 65 50 vai 67 22 34 50  
Fakss 67 82 01 07 vai 67 22 65 06  
E-pasts <foral@foral.lv>  
Internets <http://www.foral.lv>

**62. Vadims MANTROVS***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs  
„Advokātu birojs Rozenfelds un partneri”  
Blaumaņa iela 11/13-8, Rīga, LV-1011  
Tālrunis 67 82 15 63  
Fakss 67 24 22 02  
E-pasts <vadims@rozenfelds.lv>  
Internets <http://www.rozenfelds.lv>

**63. Gatis MERŽVINSKIS***Preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”  
Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010  
a/k 61, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 46 95 vai 67 32 54 37  
Fakss 67 83 00 30  
E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <gatis@petpat.lv>  
Internets <http://www.petpat.lv>

**64. Viktorija PĪRSONE***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss 67 32 56 00  
E-pasts <info@triarobit.com> vai <vpirsonne@gmail.com>

**65. Kaspars PUBULIS***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

*Prakse uz laiku pārtraukta, sākot ar 01.07.2012*

**66. Katerina GRIŠINA***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5-2, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 03 00  
Fakss 67 32 56 00  
E-pasts <info@triarobit.com>

**67. Artis KROMANIS***Patenti*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”  
Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010  
a/k 61, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 46 95 vai 67 32 54 37  
Fakss 67 83 00 30  
E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <artis@petpat.lv>  
Internets <http://www.petpat.lv>

**68. Ieva ŠTĀLA***Preču zīmes*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”  
Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010  
a/k 61, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 46 95 vai 67 32 54 37  
Fakss 67 83 00 30  
E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <ieva@petpat.lv>  
Internets <http://www.petpat.lv>

**69. Jevgeņija GAINUTDINOVA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013

Tāl. 67 39 92 93 vai 29 87 22 67Fakss 67 39 92 32E-pasts <j.gainutdinova@inbox.lv>**70. Līga FJODOROVA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „BORENIUS”

Lāčplēša iela 20a, Rīga, LV-1011

Tāl. 67 20 18 16 vai 29 83 83 94Fakss 67 20 18 01E-pasts <liga.fjodorova@borenius.lv>Internets <http://www.borenius.lv>**71. Kristīne OSTROVSKA***Preču zīmes*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”

Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010

a/k 61, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 32 46 95 vai 67 32 54 37Fakss 67 83 00 30E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <kristine@petpat.lv>Internets <http://www.petpat.lv>**72. Mārīte ROMANOSA***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „KDK”

Dzērbenes iela 27-206, Rīga, LV-1006

a/k 185, Rīga, LV-1084

Tāl. 67 54 51 30Fakss 67 55 07 00 vai 67 55 20 66E-pasts <marite.kdk@edi.lv>Internets <http://www.kdk.lv>**73. Marija MAKEJEVA***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Ģertrūdes iela 50-6, Rīga, LV-1011

Tāl. 29 86 80 13E-pasts <maria.makeeva@gmail.com>**74. Broņislavs BALTRUMVIČS***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”

Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010

a/k 22, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 32 03 00 vai 67 32 13 00Fakss 67 32 56 00E-pasts <info@triarobit.com>**75. Anda BORISOVA***Patenti*

Patentu birojs „ALFA-PATENTS”

Virānes iela 2, Rīga, LV-1035

a/k 109, Rīga, LV-1082

Tāl. 67 17 62 51Fakss 67 17 62 52 vai 67 24 70 37E-pasts <info@alfa-patents.lv>Internets <http://www.alfa-patents.lv>**76. Baiba KRAVALE***Patenti, preču zīmes un dizainparaugi*

Patentu birojs „ALFA-PATENTS”

Virānes iela 2, Rīga, LV-1035

a/k 109, Rīga, LV-1082

Tāl. 67 17 62 51Fakss 67 17 62 52 vai 67 24 70 37E-pasts <info@alfa-patents.lv>Internets <http://www.alfa-patents.lv>**77. Mārtiņš GAILIS***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „LAWIN”

Elizabetes iela 15, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 81 48 48Fakss 67 81 48 49E-pasts <martins.gailis@lawin.lv>Internets <http://www.lawin.lv>**78. Normunds LAMSTERS***Preču zīmes un dizainparaugi**Prakse uz laiku pārtraukta, sākot ar 01.12.2012***79. Jānis BĒRZS***Preču zīmes un dizainparaugi*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”

Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010

a/k 61, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 32 46 95 vai 67 32 54 37Fakss 67 83 00 30E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <janis@petpat.lv>Internets <http://www.petpat.lv>**80. Edvīns DRABA***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „SORAINEN”

Kr. Valdemāra iela 21, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 36 50 00Fakss 67 36 50 01E-pasts <edvins.draba@sorainen.com>Internets <http://www.sorainen.com>**81. Lauris RASNAČS***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „ECOVIS CONVENTS”

Elizabetes iela 2, Rīga, LV-1340

Tāl. 67 03 96 65 vai 26 13 74 67Fakss 67 03 96 66E-pasts <lauris.rasnacs@ecovis.com>**82. Ilmārs ŠATOVŠ***Preču zīmes un dizainparaugi*

Dagdas iela 3-10, Rīga, LV-1003

Tāl. 26 66 71 99E-pasts <ilmars@satovs.lv>Internets <http://www.satovs.lv>**83. Ieva ANDERSONE***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „SORAINEN”

Kr. Valdemāra iela 21, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 36 50 00Fakss 67 36 50 01E-pasts <ieva.andersone@sorainen.com>Internets <http://www.sorainen.com>**84. Anna DENIŅA***Preču zīmes*

Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”

Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010

a/k 61, Rīga, LV-1010

Tāl. 67 32 46 95 vai 67 32 54 37Fakss 67 83 00 30E-pasts <petpat@petpat.lv> vai <anna@petpat.lv>Internets <http://www.petpat.lv>



**85. Aļina BOGDANOVIČA***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5-2, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss 67 32 56 00  
E-pasts <info@triarobit.com>

**86. Jurgita SPĪGULE***Preču zīmes un dizainparaugi*

Zvērinātu advokātu birojs „SPĪGULIS KUKAINIS & AZANDA”  
Vaļņu iela 3, Rīga, LV-1050  
Tālrunis 29 35 44 26  
Fakss 67 21 42 73  
E-pasts <Jurgita.Spigule@ska.lv>  
Internets <http://www.ska.lv>

**87. Ilze BUKALDERE***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „BORENIUS”  
Lāčplēša iela 20a, Rīga, LV-1011  
Tālrunis 67 20 18 24  
Fakss 67 20 18 01  
E-pasts <ilze@borenius.lv>  
Internets <http://www.borenius.lv>

**88. Maija LIBERTE***Preču zīmes*

AS „GRINDEKS”  
Krustpils iela 53, Rīga, LV-1057  
Tālrunis 26 22 62 62  
Fakss 67 08 35 16  
E-pasts <maija.liberte@grindeks.lv>

**89. Irina NURGAĻEJEVA***Preču zīmes*

Intelektuālā īpašuma juridiskā firma „LATISS”  
Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011  
Tālrunis 67 35 66 45  
Fakss 67 32 43 54  
E-pasts <latiss@latiss.eu>  
Internets <http://www.latiss.eu>

**90. Aleksejs VALLE***Preču zīmes*

Zvērinātu advokātu birojs „MAGNUSSON”  
Smilšu iela 8, Rīga, LV-1050  
Tālrunis 67 32 00 00  
Fakss 67 32 00 65  
E-pasts <aleksejs.valle@magnussonlaw.com>  
Internets <http://www.magnussonlaw.com>

**91. Aļona SIVCOVA***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss 67 32 56 00  
E-pasts <info@triarobit.com>

**92. Sabīne ŪDRE***Preču zīmes*

Patentu aģentūra „TRIA ROBIT”  
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010  
a/k 22, Rīga, LV-1010  
Tālrunis 67 32 03 00 vai 67 32 13 00  
Fakss 67 32 56 00  
E-pasts <info@triarobit.com>

Atbildīgā par izdevumu K. Libarte  
Reģistrācijas apliecība Nr. 000701174